

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 691 726**

51 Int. Cl.:

C07D 215/14 (2006.01) **C07D 491/048** (2006.01)
A01N 43/42 (2006.01) **C07D 495/04** (2006.01)
A01N 55/00 (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)
C07D 215/18 (2006.01)
C07D 215/20 (2006.01)
C07D 215/38 (2006.01)
C07D 221/04 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **28.12.2010 PCT/JP2010/073683**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **07.07.2011 WO11081174**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **28.12.2010 E 10841029 (1)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **26.09.2018 EP 2522658**

54 Título: **Compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno y germicida agrícola/hortícola**

30 Prioridad:

04.01.2010 JP 2010000194

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

28.11.2018

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

**SHIBAYAMA KOTARO;
INAGAKI JUN;
SAIKI YUTO;
MITANI AKIRA;
KUWAHARA RAITO;
SATO MOTOAKI;
NISHIMURA SATOSHI y
KUBOKI MAMI**

74 Agente/Representante:

VEIGA SERRANO, Mikel

ES 2 691 726 T3

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

DESCRIPCIÓN

Compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno y germicida agrícola/hortícola

5 Sector de la técnica

La presente invención se refiere a nuevos compuestos heterocíclicos que contienen nitrógeno y a un fungicida agrícola que contiene al menos uno seleccionado entre el grupo que consiste en los compuestos heterocíclicos que contienen nitrógeno como principio activo.

10

Estado de la técnica

En el cultivo de cultivos agrícolas, se usa una diversidad de agentes de control para tratar las enfermedades de los cultivos. Sin embargo, existen muy pocos agentes que satisfagan plenamente los requisitos para su uso como agente de control debido a razones tales como un efecto de control insuficiente, un uso limitado debido a la aparición de patógenos resistentes a los agentes, efectos fitotóxicos o contaminantes en las plantas o toxicidad para los seres humanos, animales domésticos y peces, y un efecto adverso sobre el medio ambiente. Por tanto, se requiere la necesidad de agentes que tengan menos desventajas de este tipo y que sean seguras de usar.

15

20

Relacionado con la presente invención, en el siguiente Documento de Patente 1 o 2 o en el documento WO 92/17452, se desvelan derivados de quinolina que tienen estructuras químicas similares a los compuestos de acuerdo con la presente invención y fungicidas agrícolas que contienen los derivados de quinolina como principios activos.

25

También relacionado con la presente invención, en el siguiente Artículo de Investigación 1, se desvelan derivados de quinolina que tienen estructuras químicas similares a los compuestos de acuerdo con la presente invención. Un derivado de quinolina incluido en la fórmula (II) pero excluido de la materia objeto reivindicada también se desvela en Crabbendam et al. *Delft Progr. Rep.*, 1982, 7, 77-80.

30

Documentos de la técnica relacionada**Documentos de patentes**

35

[Documento de Patente 1] Folleto del documento WO2005/070917

[Documento de Patente 2] Folleto del documento WO2007/011022

[Artículo de Investigación 1] Carlos et al. *Angew. Chem. Int. Ed.* 2006, 45, 4321-4326.

Objeto de la invención

40

Problemas que se han de resolver por la invención

Un objeto de la presente invención es proporcionar un nuevo compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno, y una sal del mismo o un compuesto de N-óxido del mismo, y un fungicida agrícola, que tiene efectos fiables, es seguro de usar y contiene al menos uno seleccionado entre el grupo que consiste en el compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno, la sal y el compuesto de N-óxido del mismo como principio activo.

45

Medios para resolver los problemas

50

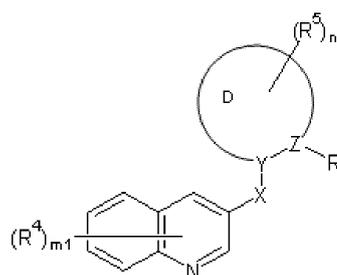
Los inventores han estudiado exhaustivamente con el fin de resolver los problemas anteriores. Como resultado, se obtuvo un compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno, una sal del mismo o un compuesto de N-óxido del mismo de acuerdo con la reivindicación 1. También se descubrió que el compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno, la sal del mismo o el compuesto de N-óxido del mismo son útiles como principio activo de un fungicida agrícola, que tiene efectos fiables y es seguro de usar. La presente invención se completó con estudios adicionales basados en estos hallazgos.

55

Es decir, la presente invención incluye los siguientes aspectos.

60

<1> Un compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno representado por la Fórmula (II), una sal del mismo o un compuesto de N-óxido del mismo.



Fórmula (II)

En la Fórmula (II), R representa un grupo representado por $CR^1R^2R^3$, un grupo arilo C_{6-10} sin sustituir o sustituido o un grupo ciano;

5 R^1 a R^3 representan cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo alqueno C_{2-8} sin sustituir o sustituido, un grupo alquino C_{2-8} sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalquilo C_{3-8} sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalqueno C_{4-8} sin sustituir o sustituido, un grupo arilo C_{6-10} sin sustituir o sustituido, un grupo heterocíclico sin sustituir o sustituido, un grupo acilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo (1-imino)alquilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo carboxilo sin sustituir o sustituido, un grupo carbamoilo sin sustituir o sustituido, un grupo hidroxilo sin sustituir o sustituido, un grupo amino sin sustituir o sustituido, un grupo mercapto sin sustituir o sustituido, un grupo sulfonilo sustituido, un grupo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro;

10 excepto donde: de R^1 a R^3 son todos átomos de hidrógeno; de R^1 a R^3 son todos grupos alquilo C_{1-8} sin sustituir; uno cualquiera de R^1 a R^3 es un átomo de hidrógeno y los dos restantes son ambos grupos alquilo C_{1-8} sin sustituir; y, uno cualquiera de R^1 a R^3 es un grupo alquilo C_{1-8} sin sustituir y los dos restantes son ambos átomos de hidrógeno;

15 R^4 representa cada uno independientemente un grupo alquilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo alqueno C_{2-8} sin sustituir o sustituido, un grupo alquino C_{2-8} sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalquilo C_{3-8} sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalqueno C_{4-8} sin sustituir o sustituido, un grupo arilo C_{6-10} sin sustituir o sustituido, un grupo heterocíclico sin sustituir o sustituido, un grupo acilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo (1-imino)alquilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo carboxilo sin sustituir o sustituido, un grupo carbamoilo sin sustituir o sustituido, un grupo hidroxilo sin sustituir o sustituido, un grupo amino sin sustituir o sustituido, un grupo mercapto sin sustituir o sustituido, un grupo sulfonilo sustituido, un grupo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro;

20 m_1 representa un número de R^4 y es un número entero de 0 a 6;

R^5 representa cada uno independientemente un grupo alquilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo alqueno C_{2-8} sin sustituir o sustituido, un grupo alquino C_{2-8} sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalquilo C_{3-8} sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalqueno C_{4-8} sin sustituir o sustituido, un grupo arilo C_{6-10} sin sustituir o sustituido, un grupo heterocíclico sin sustituir o sustituido, un grupo acilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo (1-imino)alquilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo carboxilo sin sustituir o sustituido, un grupo carbamoilo sin sustituir o sustituido, un grupo hidroxilo sin sustituir o sustituido, un grupo amino sin sustituir o sustituido, un grupo mercapto sin sustituir o sustituido, un grupo sulfonilo sustituido, un grupo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro;

25 n representa un número de R^5 y es un número entero de 0 a 5;

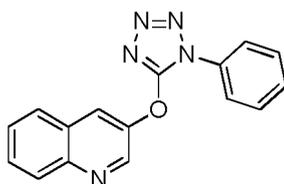
30 D representa un anillo de hidrocarburo aromático de 5 a 7 miembros que incluye tanto Y como Z o un anillo heterocíclico aromático de 5 a 7 miembros que incluye tanto Y como Z;

X representa un átomo de oxígeno;

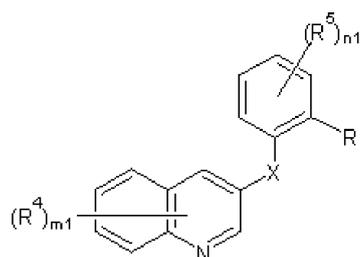
Y representa un átomo de carbono o un átomo de nitrógeno; y

Z representa un átomo de carbono o un átomo de nitrógeno,

40 a condición de que dicho compuesto no sea:



45 <3> Un compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno representado por la Fórmula (III), una sal del mismo o un compuesto de N-óxido del mismo.



Fórmula (III)

En la Fórmula (III), cada uno de R, R⁴, R⁵, m₁ y X representa el mismo significado que aquellos en la Fórmula (II) descritos anteriormente en <1>; y

5 n₁ representa un número de R⁵ y es un número entero de 0 a 4.

<4> Un fungicida agrícola que comprende, como principio activo, al menos uno seleccionado entre el grupo que consiste en el compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno, la sal del mismo, y el compuesto de N-óxido del mismo, de uno cualquiera <1> y <3>.

10 Efecto de la invención

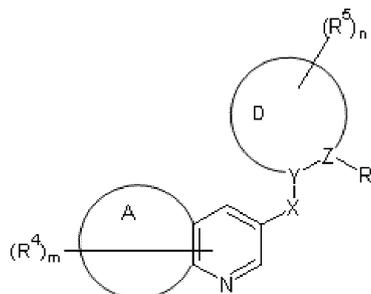
El compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno, la sal del mismo, y el compuesto de N-óxido del mismo de acuerdo con la presente invención son nuevos compuestos útiles como principio activo de un fungicida agrícola que tiene efectos fiables y es seguro de usar.

15 El fungicida agrícola de acuerdo con la presente invención es un agente que tiene excelentes efectos de control, no provoca fitotoxicidad en las plantas y tiene poca toxicidad para los seres humanos, animales domésticos y peces o para el medio ambiente.

20 Modos de realización de la invención

En lo sucesivo en el presente documento, la presente invención se clasificará en 1) un compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno representado por la Fórmula (II), y una sal del mismo o un compuesto de N-óxido del mismo, y 2) un fungicida agrícola y se describe en detalle.

25 1) Se desvela un compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno representado por la Fórmula (I), y una sal del mismo, o un compuesto de N-óxido del mismo.



Fórmula (I)

30 El compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno de acuerdo con la presente invención se representa por la Fórmula (II) (en lo sucesivo en el presente documento, a veces denominado "compuesto (II)") y se representa más preferentemente por la Fórmula (III) (en adelante en el presente documento, a veces denominado "compuesto (III)").

35 El compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno, la sal del mismo, o el compuesto de N-óxido del mismo de acuerdo con la presente invención pueden ser un hidrato, un solvato, un polimorfismo cristalino o similares. Además, puede haber presente un átomo de carbono asimétrico, estereoisómeros basados en un doble enlace o similar, o una mezcla de los mismos, en el compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno, la sal del mismo, o el compuesto de N-óxido del mismo de acuerdo con la presente invención.

40 En primer lugar, se explicará el significado de "sin sustituir" y "sin sustituir" en las Fórmulas (I), (II) y (III). La expresión "sin sustituir" en la presente memoria descriptiva significa que el grupo especificado está formado únicamente por un grupo que sirve como núcleo madre. Cuando solo se menciona el nombre del grupo que sirve como núcleo madre sin mención de "sustituido", significa "sin sustituir" a menos que se indique lo contrario.

45 Por otra parte, el término "sustituido" significa que un átomo de hidrógeno de un grupo que sirve como núcleo madre se ha sustituido con un sustituyente que tiene la misma estructura o una estructura diferente a la del núcleo madre. El "sustituyente" es un grupo diferente que está unido al grupo que sirve como núcleo madre. El "sustituyente" puede

ser uno o más. Al menos dos sustituyentes pueden ser iguales o diferentes.

Términos tales como "C₁₋₆" o similares indican que el número de átomos de carbono en un grupo que sirve como núcleo madre es de 1 a 6 o similar. El número de átomos de carbono no incluye los átomos de carbono en un sustituyente. Por ejemplo, un grupo butilo que tiene un grupo epoxi como sustituyente se clasifica como un grupo alcoxi C₂ alquilo C₄.

El "sustituyente" no está particularmente limitado siempre que sea químicamente aceptable y tenga los efectos de la presente invención.

Los ejemplos del "sustituyente" incluyen: un átomo de halógeno tal como un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un átomo de yodo; un grupo alquilo C₁₋₆ tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo o un grupo n-hexilo; un grupo cicloalquilo C₃₋₆ tal como un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclohexilo; un grupo alqueno C₂₋₆ tal como un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 1-pentenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 3-pentenilo, un grupo 4-pentenilo, un grupo 1-metil-2-butenilo, un grupo 2-metil-2-butenilo, un grupo 1-hexenilo, un grupo 2-hexenilo, un grupo 3-hexenilo, un grupo 4-hexenilo y un grupo 5-hexenilo; un grupo cicloalqueno C₃₋₆ tal como un grupo 2-ciclopropenilo, un grupo 2-ciclopentenilo o un grupo 3-ciclohexenilo; un grupo alquino C₂₋₆ tal como un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 1-metil-2-propinilo, un grupo 2-metil-3-butinilo, un grupo 1-pentinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo, un grupo 4-pentinilo, un grupo 1-metil-2-butinilo, un grupo 2-metil-3-pentinilo, un grupo 1-hexenilo o un grupo 1,1-dimetil-2-butinilo; un grupo alcoxi C₁₋₆ tal como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi o un grupo t-butoxi; un grupo alquenoiloxi C₂₋₆ tal como un grupo viniloxi, un grupo aliloxi, un grupo propeniloxi o un grupo buteniloxi; un grupo alquiniloxi C₂₋₆ tal como un grupo etiniloxi o un grupo propargiloxi; un grupo arilo C₆₋₁₀ tal como un grupo fenilo o un grupo naftilo; un grupo ariloxi C₆₋₁₀ tal como un grupo fenoxi o un grupo 1-naftoxi; un grupo aralquilo C₇₋₁₁ tal como un grupo bencilo o un grupo fenetilo; un grupo aralquiloiloxi C₇₋₁₁ tal como un grupo benciloxi o un grupo fenetiloxi; un grupo acilo C₁₋₇ tal como un grupo formilo, un grupo acetilo, un grupo propionilo, un grupo benzóilo o un grupo ciclohexilcarbonilo; un grupo aciloxi C₁₋₇ tal como un grupo formiloxi, un grupo acetiloxi, un grupo propioniloxi, un grupo benzóiloxi o un grupo ciclohexilcarboniloxi; un grupo alcóxicarbonilo C₁₋₆ tal como un grupo metóxicarbonilo, un grupo etóxicarbonilo, un grupo n-propóxicarbonilo, un grupo i-propóxicarbonilo, un grupo n-butoxicarbonilo y un grupo t-butoxicarbonilo; grupo carboxilo; un grupo hidroxilo; un grupo oxo; un grupo haloalquilo C₁₋₆ tal como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo, un grupo 1-fluoro-n-butilo o un grupo perfluoro-n-pentilo; un grupo haloalqueno C₂₋₆ tal como un grupo 2-cloro-1-propenilo o un grupo 2-fluoro-1-butenilo; un grupo haloalquino C₂₋₆ tal como un grupo 4,4-dicloro-1-butinilo, un grupo 4-fluoro-1-pentinilo o un grupo 5-bromo-2-pentinilo; un grupo haloalcoxi C₁₋₆ tal como un grupo 2-cloron-propoxi o un grupo 2,3-diclorobutoxi; un grupo haloalquenoiloxi C₂₋₆ tal como un grupo 2-cloropropeniloxi o un grupo 3-bromobuteniloxi; un grupo haloarilo C₆₋₁₀ tal como un grupo 4-clorofenilo, un grupo 4-fluorofenilo o un grupo 2,4-diclorofenilo; un grupo haloariloxi C₆₋₁₀ tal como un grupo 4-fluorofeniloxi o un grupo 4-cloro-1-naftoxi; un grupo haloacilo C₁₋₇ tal como un grupo cloroacetilo, un grupo trifluoroacetilo, un grupo tricloroacetilo o un grupo 4-clorobenzóilo; un grupo ciano; un grupo isociano; un grupo nitro; un grupo isocianato; un grupo cianato; un grupo azida; un grupo amino; un grupo alquilamino C₁₋₆ tal como un grupo metilamino, un grupo dimetilamino o un grupo dietilamino; un grupo arilamino C₆₋₁₀ tal como un grupo anilino o un grupo naftilamino; un grupo aralquilamino C₇₋₁₁ tal como un grupo bencilamino o un grupo feniletilamino; un grupo acilamino C₁₋₇ tal como un grupo formilamino, un grupo acetilamino, un grupo propanoilamino, un grupo butirilamino, un grupo i-propilcarbonilamino o un grupo benzóilamino; un grupo alcóxicarbonilamino C₁₋₆ tal como un grupo metóxicarbonilamino, un grupo etóxicarbonilamino, un grupo n-propóxicarbonilamino o un grupo i-propóxicarbonilamino; un grupo carbamoilo; un grupo carbamoilo sustituido tal como un grupo dimetilcarbamoilo, un grupo fenilcarbamoilo o un grupo N-fenil-N-metilcarbamoilo; un grupo imino-alquilo C₁₋₆ tal como un grupo iminometilo, un grupo (1-imino)etilo o un grupo (1-imino)-n-propilo; un grupo hidroxiimino alquilo C₁₋₆ tal como un grupo hidroxiiiminometilo, un grupo (1-hidroxiimino)etilo o un grupo (1-hidroxiimino)propilo; un grupo alcóxiimino C₁₋₆ alquilo C₁₋₆ tal como un grupo metoxiiminometilo o un grupo (1-metoxiimino)etilo; un grupo mercapto; un grupo isotiocianato; un grupo tiocianato; un grupo alquiltio C₁₋₆ tal como un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo n-propiltio, un grupo i-propiltio, un grupo n-butiltio, un grupo i-butiltio, un grupo s-butiltio, un grupo butiltio; un grupo alquenoiltio C₂₋₆ tal como un grupo viniltio o un grupo aliltio; un grupo alquinoiltio C₂₋₆ tal como un grupo feniltio o un grupo feniltio; un grupo heteroariltio tal como un grupo tiazoliltio o un grupo piridiltio; un grupo aralquiltio C₇₋₁₁ tal como un grupo benciltío o un grupo feniltio; un grupo (alquiltio C₁₋₆)carbonilo tal como un grupo (metiltio)carbonilo, un grupo (etiltio)carbonilo, un grupo (n-propiltio)carbonilo, un grupo (i-propiltio)carbonilo, un grupo (n-butiltio)carbonilo, un grupo (i-butiltio)carbonilo, un grupo (s-butiltio)carbonilo o un grupo (t-butiltio)carbonilo; un grupo alquilsulfínilo C₁₋₆ tal como un grupo metilsulfínilo, un grupo etilsulfínilo o un grupo t-butilsulfínilo; un grupo alquenoilsulfínilo C₂₋₆ tal como un grupo alilsulfínilo; un grupo alquinoilsulfínilo C₂₋₆ tal como un grupo propargilsulfínilo; un grupo arilsulfínilo C₆₋₁₀ tal como un grupo fenilsulfínilo; un grupo heteroarilsulfínilo tal como un grupo tiazolilsulfínilo o un grupo piridilsulfínilo; un grupo aralquilsulfínilo C₇₋₁₁ tal como un grupo bencilsulfínilo o un grupo fenilsulfínilo; un grupo alquilsulfonilo C₁₋₆ tal como

un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo o un grupo t-butilsulfonilo; un grupo alqueniilsulfonilo C₂₋₆ tal como un grupo aliilsulfonilo; un grupo alquiniilsulfonilo C₂₋₆ tal como un grupo propargilsulfonilo; un grupo arilsulfonilo C₆₋₁₀ tal como un grupo fenilsulfonilo; un grupo heteroarilsulfonilo tal como un grupo tiazoliilsulfonilo o un grupo piridilsulfonilo; un grupo aralquilsulfonilo C₇₋₁₁ tal como un grupo bencilsulfonilo o un grupo fenetilsulfonilo; un grupo heteroarilo de 5 miembros, tal como un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxiacorilo, un grupo tiadiazolilo o un grupo tetrazolilo; un grupo heteroarilo de 6 miembros tal como un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo o un grupo triazinilo; un grupo heterocíclico saturado tal como un grupo aziridinilo, un grupo epoxi, un grupo pirrolidinilo, un grupo tetrahidrofuranilo, un grupo piperidilo, un grupo piperazinilo o un grupo morfolinilo; un grupo tri-alquilsililo C₁₋₆ tal como un grupo trimetilsililo, un grupo trietilsililo o un grupo t-butildimetilsililo; un grupo trifenilsililo; y similares.

El "sustituyente" puede tener un "sustituyente" diferente.

15 [R]

R representa un grupo representado por CR¹R²R³, un grupo arilo C₆₋₁₀ sin sustituir o sustituido o un grupo ciano.

20 R¹ a R³ representan cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo alqueno C₂₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo alqueno C₂₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalquilo C₃₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalqueno C₄₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo arilo C₆₋₁₀ sin sustituir o sustituido, un grupo heterocíclico sin sustituir o sustituido, un grupo acilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo (1-imino) alquilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo carboxilo sin sustituir o sustituido, un grupo carbamilo sin sustituir o sustituido, un grupo hidroxilo sin sustituir o sustituido, un grupo amino sin sustituir o sustituido, un grupo mercapto sin sustituir o sustituido, un grupo sulfonilo sustituido, un grupo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro.

30 Sin embargo, no hay casos en los que de R¹ a R³ sean todos átomos de hidrógeno. Además, no hay casos en los que de R¹ a R³ sean todos grupos alquilo C₁₋₈ sin sustituir. Además, cuando uno cualquiera de R¹ a R³ es un átomo de hidrógeno, no hay casos en los que los dos restantes sean ambos grupos alquilo C₁₋₈ sin sustituir. Además, cuando uno cualquiera de R¹ a R³ es un grupo alquilo C₁₋₈ sin sustituir, no hay casos en que los dos restantes sean ambos átomos de hidrógeno.

35 Un "grupo alquilo C₁₋₈" es un hidrocarburo saturado que tiene de 1 a 8 átomos de carbono. El grupo alquilo C₁₋₈ puede ser una cadena lineal o una cadena ramificada. Los ejemplos del grupo alquilo C₁₋₈ incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo n-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo n-hexilo, un grupo n-heptilo, un grupo n-octilo, un grupo i-propilo, un grupo i-butilo, un grupo s-butilo, un grupo t-butilo, un grupo i-pentilo, un grupo neopentilo, un grupo 2-metilbutilo, un grupo 2,2-dimetilpropilo, un grupo i-hexilo y similares. Entre estos, se prefiere un grupo alquilo C₁₋₆.

40 De acuerdo con la invención, el "grupo alquilo C₁₋₈ sustituido" es un grupo cicloalquil C₃₋₆ alquilo C₁₋₆, un grupo cicloalquenoil C₄₋₆ alquilo C₁₋₆, un grupo haloalquilo C₁₋₆, un grupo aril C₆₋₁₀ alquilo C₁₋₆, un grupo heteroaril alquilo C₁₋₆ de 5 a 6 miembros, un grupo hidroxil alquilo C₁₋₆, un grupo alcoxi C₁₋₆ alquilo C₁₋₆, un grupo aciloxi C₁₋₇ alquilo C₁₋₆, un grupo tri alquilsiloxi C₁₋₆ alquilo C₁₋₆, un grupo arilsulfonilo C₆₋₁₀ alquilo C₁₋₆ sustituido con alquilo C₁₋₆, un grupo ciano alquilo C₁₋₆, un grupo acil C₁₋₆ alquilo C₁₋₆, un grupo 2-hidroxiimino alquilo C₂₋₆, un grupo formil alquilo C₁₋₆, un grupo carboxi alquilo C₁₋₆, un grupo alcocarbonil C₁₋₆ alquilo C₁₋₆ o un grupo azido alquilo C₁₋₆.

50 Un "grupo alqueno C₂₋₈" es un grupo hidrocarburo insaturado que incluye de 2 a 8 átomos de carbono que tiene al menos un doble enlace carbono-carbono. El grupo alqueno C₂₋₈ puede ser una cadena lineal o una cadena ramificada. Los ejemplos del grupo alqueno C₂₋₈ incluyen un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo isopropenilo, un grupo alilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 1-pentenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 3-pentenilo, un grupo 4-pentenilo, un grupo 1-hexenilo, un grupo 2-hexenilo, un grupo 3-hexenilo, un grupo 4-hexenilo, un grupo 5-hexenilo, un grupo 1-heptenilo, un grupo 6-heptenilo, un grupo 1-octenilo, un grupo 7-octenilo, un grupo 1-metil-alilo, un grupo 2-metil-alilo, un grupo 1-metil-2-butenilo, un grupo 2-metil-2-butenilo y similares. Entre estos, se prefiere un grupo alqueno C₂₋₆.

De acuerdo con la invención, el "grupo alqueno C₂₋₈ sustituido" es un grupo haloalqueno C₂₋₆ o un grupo hidroxil C₂₋₆ alqueno.

60 Un "grupo alqueno C₂₋₈" es un grupo hidrocarburo insaturado que incluye de 2 a 8 átomos de carbono que tiene al menos un triple enlace carbono-carbono. El grupo alqueno C₂₋₈ puede ser una cadena lineal o una cadena ramificada. Los ejemplos del grupo alqueno C₂₋₈ incluyen un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo propargilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 1-pentinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo, un grupo 4-pentinilo, un grupo 1-hexinilo, un grupo 1-metil-2-propinilo, un grupo 2-metil-3-butinilo, un grupo 1-metil-2-butinilo, un grupo 2-metil-3-pentinilo, un grupo 1,1-dimetil-2-butinilo y similares. Entre estos, se prefiere un grupo alqueno C₂₋₆.

De acuerdo con la invención, el "grupo alquinilo C₂₋₈ sustituido" es un grupo haloalquinilo C₂₋₆.

Un "grupo cicloalquilo C₃₋₈" es un grupo alquilo que incluye de 3 a 8 átomos de carbono que tiene un resto cíclico. Los ejemplos del grupo cicloalquilo C₃₋₈ incluyen un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo, un grupo cicloheptilo, un grupo ciclooctilo y similares. Entre estos, se prefiere un grupo cicloalquilo C₃₋₆.

De acuerdo con la invención, el "grupo cicloalquilo C₃₋₈ sustituido" es un grupo cicloalquilo C₃₋₆ en el que de 1 a 3 grupos alquilo C₁₋₆ están sustituidos.

Un "grupo cicloalquenilo C₄₋₈" es un grupo alquenilo que incluye de 4 a 8 átomos de carbono que tiene un resto cíclico. Los ejemplos del grupo cicloalquenilo C₄₋₈ incluyen un grupo 1-ciclobutenilo, un grupo 1-ciclopentenilo, un grupo 3-ciclopentenilo, un grupo 1-ciclohexenilo, un grupo 3-ciclohexenilo, un grupo 3-cicloheptenilo, un grupo 4-ciclohtenilo y similares.

De acuerdo con la invención, el "grupo cicloalquenilo C₄₋₈ sustituido" es un grupo cicloalquenilo C₄₋₆ en el que de 1 a 3 grupos alquilo C₁₋₆ están sustituidos.

Un "grupo arilo C₆₋₁₀" es un grupo arilo monocíclico o policíclico que tiene de 6 a 10 átomos de carbono. En el grupo arilo policíclico, si al menos un anillo es un anillo aromático, el o los anillos restantes pueden ser cualquiera de un anillo alicíclico saturado, un anillo alicíclico insaturado y un anillo aromático. Los ejemplos del grupo arilo C₆₋₁₀ incluyen un grupo fenilo, un grupo naftilo, un grupo azulenilo, un grupo indenilo, un grupo indanilo, un grupo tetralinilo y similares. Entre estos, se prefiere un grupo fenilo.

De acuerdo con la invención, el "grupo arilo C₆₋₁₀ sustituido" es un grupo arilo C₆₋₁₀ sustituido con alquilo C₁₋₆, un grupo arilo C₆₋₁₀ sustituido con halógeno y un grupo arilo sustituido con alcoxi C₁₋₆.

Un "grupo heterocíclico" incluye de 1 a 4 heteroátomos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre, como un átomo constituyente de un anillo. El grupo heterocíclico puede ser monocíclico o policíclico.

Los ejemplos del grupo heterocíclico incluyen un grupo heteroarilo de 5 miembros, un grupo heteroarilo de 6 miembros, un grupo heteroarilo condensado, un grupo heterocíclico saturado, un grupo heterocíclico parcialmente insaturado y similares.

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

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

Los ejemplos del grupo heteroarilo condensado incluyen: grupo indol-1-ilo, un grupo indol-2-ilo, un grupo indol-3-ilo, un grupo indol-4-ilo, un grupo indol-5-ilo, un grupo indol-6-ilo, un grupo indol-7-ilo; un grupo benzofuran-2-ilo, un grupo benzofuran-3-ilo, un grupo benzofuran-4-ilo, un grupo benzofuran-5-ilo, un grupo benzofuran-6-ilo, un grupo benzofuran-7-ilo; un grupo benzotiofen-2-ilo, un grupo benzotiofen-3-ilo, un grupo benzotiofen-4-ilo, un grupo benzotiofen-5-ilo, un grupo benzotiofen-6-ilo, un grupo benzotiofen-7-ilo; un grupo benzoimidazol-1-ilo, un grupo benzoimidazol-2-ilo, un grupo benzoimidazol-4-ilo, un grupo benzoimidazol-5-ilo, un grupo benzoxazol-2-ilo, un grupo benzoxazol-4-ilo, un grupo benzoxazol-5-ilo, un grupo benzotiazol-2-ilo, un grupo benzotiazol-4-ilo, un grupo benzotiazol-5-ilo; un grupo quinolin-2-ilo, un grupo quinolin-3-ilo, un grupo quinolin-4-ilo, un grupo quinolin-5-ilo, un grupo quinolin-6-ilo, un grupo quinolin-7-ilo, un grupo quinolin-8-ilo; y similares.

Los ejemplos del otro grupo heterocíclico incluyen: un anillo heterocíclico saturado de 3 miembros tal como un grupo aziridin-1-ilo, un grupo aziridin-2-ilo o un grupo oxiranilo; un anillo heterocíclico saturado de 5 miembros, tal como un

grupo pirrolidin-1-ilo, un grupo pirrolidin-2-ilo, un grupo pirrolidin-3-ilo, un grupo tetrahidrofuran-2-ilo, un grupo tetrahidrofuran-3-ilo o un grupo [1,3]dioxiran-2-ilo; un anillo heterocíclico saturado de 6 miembros tal como un grupo piperidin-1-ilo, un grupo piperidin-2-ilo, un grupo piperidin-3-ilo, un grupo piperidin-4-ilo, un grupo piperazin-1-ilo, un grupo piperazin-2-ilo, un grupo morfolin-2-ilo, un grupo morfolin-3-ilo o un grupo morfolin-4-ilo; un grupo 1,3-benzodioxol-4-ilo, un grupo 1,3-benzodioxol-5-ilo, un grupo 1,4-benzodioxan-5-ilo, un grupo 1,4-benzodioxan-6-ilo, un grupo 3,4-dihidro-2H-1,5-benzodioxepin-6-ilo, un grupo 3,4-dihidro-2H-1,5-benzodioxepin-7-ilo, un grupo 2,3-dihidrobenzofuran-4-ilo, un grupo 2,3-dihidrobenzofuran-5-ilo, un grupo 2,3-dihidrobenzofuran-6-ilo o un grupo 2,3-dihidrobenzofuran-7-ilo; y similares.

De acuerdo con la invención, el "grupo heterocíclico sustituido" es un grupo 4-cloro-2-piridinilo, un grupo 3-cloro-2-pirazinilo, un grupo 4-metil-2-piridinilo, un grupo 5-trifluorometil-2-pirimidinilo, un grupo 3-metil-2-quinolilo.

Un "grupo acilo C₁₋₈" es un grupo en el que un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁₋₇, un grupo alqueno C₂₋₇, un grupo alquino C₂₋₇, un grupo arilo C₆₋₇ o un grupo heterocíclico de 5 a 7 miembros está unido a un grupo carbonilo.

Los ejemplos del grupo acilo C₁₋₈ incluyen: un grupo formilo; un grupo alquilcarbonilo tal como un grupo acetilo, un grupo propionilo, un grupo n-propilcarbonilo, un grupo n-butilcarbonilo, un grupo pentanoilo, un grupo valerilo, un grupo octanoilo, un grupo i-propilcarbonilo, un grupo i-butilcarbonilo, un grupo pivaloilo o un grupo isovalerilo, preferentemente un grupo alquilcarbonilo C₁₋₆; un grupo carbonilo tal como un grupo acrililo o un grupo metacrililo, preferentemente un grupo carbonilo C₂₋₆; un grupo alquilcarbonilo tal como un grupo propiloilo, preferentemente un grupo alquilcarbonilo C₂₋₆; un grupo arilcarbonilo tal como un grupo benzoilo; un grupo carbonilo heterocíclico tal como un grupo 2-piridilcarbonilo o un grupo tienilcarbonilo; y similares.

De acuerdo con la invención, el "grupo acilo C₁₋₈ sustituido" es un grupo haloacilo C₁₋₇.

Un "grupo (1-imino)alquilo C₁₋₈" es un grupo iminometilo o un grupo en el que un grupo alquilo C₁₋₇ está unido a un grupo iminometilo. Los ejemplos del grupo (1-imino)alquilo C₁₋₈ incluyen un grupo iminometilo, un grupo (1-imino)etilo, un grupo (1-imino)propilo, un grupo (1-imino)butilo, un grupo (1-imino)pentilo, un grupo (1-imino)hexilo, un grupo (1-imino)heptilo y similares. Entre estos, se prefiere un grupo (1-imino)alquilo C₁₋₆.

De acuerdo con la invención, el "grupo (1-imino)alquilo C₁₋₈ sustituido" es un grupo (1-(alcoxi C₁₋₆)imino)alquilo C₁₋₆.

Un "grupo carboxilo sustituido" es un grupo en el que un grupo alquilo C₁₋₆, un grupo alqueno C₂₋₆, un grupo alquino C₂₋₆, un grupo arilo C₆₋₁₀, un grupo aril C₆₋₁₀ alquilo C₁₋₆ o un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros está unido a un grupo carbonilo.

De acuerdo con la invención, el "grupo carboxilo sustituido" es un grupo alcóxicarbonilo C₁₋₆, un grupo alquenoiloxicarbonilo C₂₋₆, un grupo alquinoiloxicarbonilo C₂₋₆, un grupo ariloxicarbonilo C₆₋₁₀ o un grupo aril C₆₋₁₀ alcóxicarbonilo C₁₋₆.

Un "grupo carbamoilo sustituido" es un grupo en el que un grupo alquilo C₁₋₆, un grupo alqueno C₂₋₆, un grupo alquino C₂₋₆, un grupo arilo C₆₋₁₀, un grupo aril C₆₋₁₀ alquilo C₁₋₆ o un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros está unido a un grupo carbamoilo.

De acuerdo con la invención, el "grupo carbamoilo sustituido" es un grupo mono alquilcarbamoilo C₁₋₆, un grupo di alquilcarbamoilo C₁₋₆ o un grupo mono arilcarbamoilo C₆₋₁₀.

De acuerdo con la invención, el "grupo hidroxilo sustituido" es un grupo alcoxi C₁₋₆, un grupo cicloalquil C₃₋₈ alcoxi C₁₋₆, un grupo aril C₆₋₁₀ alcoxi C₁₋₆, un grupo haloalcoxi C₁₋₆, un grupo alquenoiloxi C₂₋₆, un grupo alquinoiloxi C₂₋₆, un grupo cicloalquiloxi C₃₋₆, un grupo ariloxi C₆₋₁₀, un grupo aril C₆₋₁₀ alquiloxi C₁₋₆, un grupo aciloxi C₁₋₇, un grupo alcóxicarbonil C₁₋₆ alcoxi C₁₋₆ o un grupo tri alquilsililoxi C₁₋₆.

De acuerdo con la invención, el "grupo amino sustituido" es un grupo mono alquilamino C₁₋₆, un grupo di alquilamino C₁₋₆; un grupo mono alquilidenamino C₁₋₆, un grupo mono arilamino C₆₋₁₀, un grupo di arilamino C₆₋₁₀, un grupo aril C₆₋₁₀ alquilamino C₁₋₆, un grupo acilamino C₁₋₆ o un grupo alcóxicarbonilamino C₁₋₆.

De acuerdo con la invención, el "grupo mercapto sustituido" es un grupo alquiltio C₁₋₆, un grupo ariltio C₆₋₁₀ o un grupo aciltio C₁₋₆.

De acuerdo con la invención, el "grupo sulfonilo sustituido" es un grupo alquilsulfonilo C₁₋₆, un grupo haloalquilsulfonilo C₁₋₆, un grupo arilsulfonilo C₆₋₁₀, un grupo alcóxisulfonilo C₁₋₆, un grupo mono alquilsulfamoilo C₁₋₆, un grupo di alquilsulfamoilo C₁₋₆ o un grupo mono arilsulfamoilo C₆₋₁₀.

Los ejemplos de un "grupo halógeno" incluyen un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo y similares.

Como una combinación preferida de un grupo representado por $CR^1R^2R^3$, puede incluirse la siguiente combinación.
 R^1 es un grupo hidroxilo sin sustituir o sustituido;

R^2 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido; y

5 R^3 es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo alqueno C_{2-8} sin sustituir o sustituido, un grupo alquino C_{2-8} sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalquilo C_{3-8} sin sustituir o sustituido, un grupo arilo C_{6-10} sin sustituir o sustituido, un grupo heterocíclico C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo acilo sin sustituir o sustituido, un grupo (1-imino)alquilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo alcóxicarbonilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo hidroxilo sin sustituir o sustituido o un grupo ciano.

10 La siguiente combinación también puede incluirse como un ejemplo preferido.

R^1 es un grupo alquilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido;

R^2 es un grupo alquilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido; y

15 R^3 es un grupo alquilo C_{1-8} sustituido, un grupo alqueno C_{2-8} sin sustituir o sustituido, un grupo alquino C_{2-8} sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalquilo C_{3-8} sin sustituir o sustituido, un grupo arilo C_{6-10} sin sustituir o sustituido, un grupo heterocíclico sin sustituir o sustituido, un grupo acilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo alquilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo alcóxicarbonilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo carbamoilo sin sustituir o sustituido, un grupo sulfonilo sin sustituir o sustituido o un grupo ciano.

20 El grupo arilo C_{6-10} sin sustituir o sustituido en R puede ser el mismo que el "grupo arilo C_{6-10} " proporcionado como los ejemplos en R^1 a R^3 anteriores. Se prefiere un grupo fenilo.

[R^4]

25 R^4 representa cada uno independientemente un grupo alquilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo alqueno C_{2-8} sin sustituir o sustituido, un grupo alquino C_{2-8} sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalquilo C_{3-8} sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalqueno C_{4-8} sin sustituir o sustituido, un grupo arilo C_{6-10} sin sustituir o sustituido, un grupo heterocíclico sin sustituir o sustituido, un grupo acilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo (1-imino)alquilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo carboxilo sin sustituir o sustituido, un grupo carbamoilo sin sustituir o sustituido, un grupo hidroxilo sin sustituir o sustituido, un grupo amino sin sustituir o sustituido, un grupo mercapto sin sustituir o sustituido, un grupo sulfonilo sustituido, un grupo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro.

Los grupos representados por R^4 pueden ser los mismos que en los ejemplos proporcionados en los grupos representados por R^1 a R^3 .

35 En las Fórmulas (I), (II) y (III), m y m_1 representan el número de R^4 y son un número entero de 0 a 6.

R^4 representa preferentemente un grupo alquilo C_{1-6} , un grupo haloalquilo C_{1-6} , un grupo alqueno C_{2-6} , un grupo cicloalquilo C_{3-8} , un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi C_{1-6} o un grupo halógeno.

40 [R^5]

45 R^5 representa cada uno independientemente un grupo alquilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo alqueno C_{2-8} sin sustituir o sustituido, un grupo alquino C_{2-8} sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalquilo C_{3-8} sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalqueno C_{4-8} sin sustituir o sustituido, un grupo arilo C_{6-10} sin sustituir o sustituido, un grupo heterocíclico sin sustituir o sustituido, un grupo acilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo (1-imino)alquilo C_{1-8} sin sustituir o sustituido, un grupo carboxilo sin sustituir o sustituido, un grupo carbamoilo sin sustituir o sustituido, un grupo hidroxilo sin sustituir o sustituido, un grupo amino sin sustituir o sustituido, un grupo mercapto sin sustituir o sustituido, un sulfonilo sustituido, un grupo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro.

50 Los grupos representados por R^5 pueden ser los mismos que en los ejemplos proporcionados en los grupos representados por R^1 a R^3 .

En la Fórmula (I) y (II), n representa el número de R^5 y es un número entero de 0 a 5. En la Fórmula (III), n_1 representa el número de R^5 y es un número entero de 0 a 4.

55 R^5 preferentemente representa un grupo alquilo C_{1-6} , un grupo haloalquilo C_{1-6} , un grupo aril C_{6-10} alquilo C_{1-6} , un grupo cicloalquilo C_{3-8} , un grupo arilo C_{6-10} , un grupo acilo C_{1-7} , un grupo alcóxicarbonilo C_{1-6} , un grupo alcoxi C_{1-6} , un grupo amino, un grupo mono alquilamino C_{1-6} , un grupo di alquilamino C_{1-6} , un grupo alcóxicarbonilamino C_{1-6} , un grupo alquiltio C_{1-6} , un grupo alquilsulfonilo C_{1-6} , un grupo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro.

60 Uno cualquiera de R^1 a R^3 y uno cualquiera de R^5 , al unirse, pueden formar un anillo de 5 a 8 miembros sin sustituir o sustituido.

65 Los ejemplos del anillo de 5 a 8 miembros incluyen: un anillo de hidrocarburo aromático tal como un anillo de benceno; un anillo de cicloalqueno C_{5-8} tal como un anillo de ciclopenteno, un anillo de ciclopentadieno, un anillo de ciclohexeno, un anillo de ciclohepteno o un anillo de cicloocteno; y similares.

[A, D]

Cuando R es un grupo representado por $CR^1R^2R^3$, A representa un anillo de hidrocarburo de 5 a 7 miembros o un anillo heterocíclico de 5 a 7 miembros.

5 Los ejemplos del anillo de hidrocarburo de 5 a 7 miembros incluyen: un anillo de hidrocarburo aromático tal como un anillo de benceno; un anillo de cicloalqueno C_{5-7} tal como un anillo de ciclopenteno, un anillo de ciclohexeno, un anillo de ciclohepteno; un anillo heterocíclico aromático de 5 a 7 miembros, como un anillo de furano, un anillo de tiofeno, un anillo de pirrol, un anillo de imidazol, un anillo de pirazol, un anillo de tiazol, un anillo de oxazol, un anillo de isoxazol, un anillo de piridina, un anillo de pirazina, un anillo de pirimidina, un anillo de piridazina, un anillo de azequina o un anillo de diazepina; un anillo heterocíclico insaturado de 5 a 7 miembros, tal como un anillo de dihidro-2H-pirano, un anillo de dihidro-2H-tiopirano o un anillo de tetrahidropiridina; y similares. Entre estos, se prefiere un anillo de hidrocarburo aromático y se prefiere más un anillo de benceno.

15 Cuando R es un grupo arilo C_{6-10} sin sustituir o sustituido o un grupo ciano, A representa un anillo de benceno.

Es decir, se prefiere que el compuesto de acuerdo con la presente invención sea un compuesto (II) o (III).

20 D representa un anillo de hidrocarburo aromático de 5 a 7 miembros o un anillo heterocíclico aromático de 5 a 7 miembros. Los ejemplos del anillo de hidrocarburo de 5 a 7 miembros y el anillo heterocíclico de 5 a 7 miembros incluyen los mismos que los ejemplos proporcionados anteriormente como A y, entre estos, se prefiere más un anillo de benceno.

Es decir, se prefiere más que el compuesto de acuerdo con la presente invención sea un compuesto (III).

25 [X, Y, Z]

X representa un átomo de oxígeno.

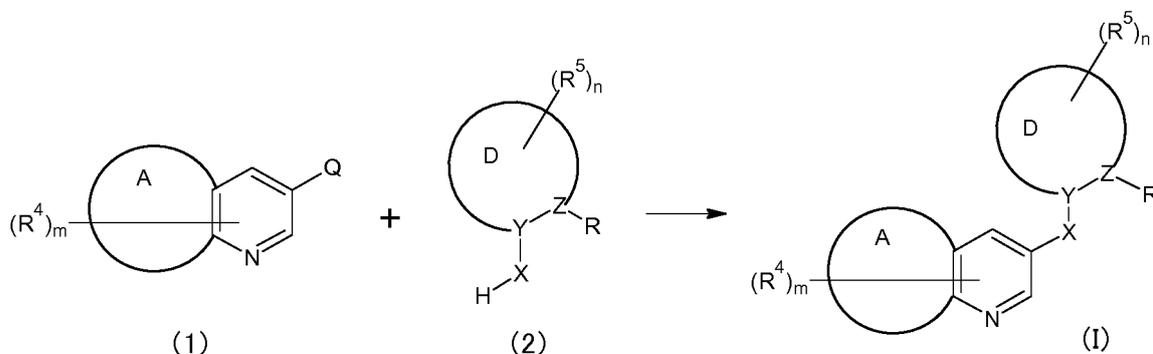
30 Y representa un átomo de carbono o un átomo de nitrógeno. Z representa un átomo de carbono o un átomo de nitrógeno. Se prefiere que Y y Z sean ambos átomos de carbono y D sea un anillo aromático que incluya tanto Y como Z.

35 Una sal o un compuesto de N-óxido de acuerdo con la presente invención no están particularmente limitado, siempre y cuando sea una sal o compuesto de N-óxido aceptable en agricultura. Los ejemplos de la sal incluyen: una sal de un ácido inorgánico tal como ácido clorhídrico o ácido sulfúrico; una sal de un ácido orgánico tal como ácido acético o ácido láctico; una sal de un metal alcalino tal como litio, sodio o potasio; una sal de un metal alcalinotérreo tal como calcio o magnesio; una sal de un metal de transición tal como hierro o cobre; una sal de una base orgánica tal como amoniaco, trietilamina, tributilamina, piridina o hidrazina; y similares.

40 (Producción del compuesto de acuerdo con la presente invención)

El compuesto de acuerdo con la presente invención puede producirse de acuerdo con los siguientes métodos de síntesis.

45 (Método de síntesis 1)

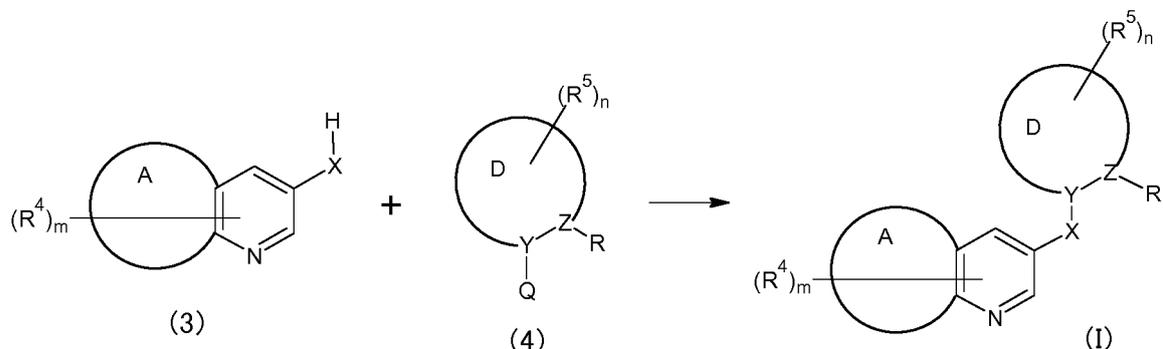


50 En las fórmulas, R, R^4 , R^5 , A, D, X, Y, Z, m y n representan el mismo significado que los descritos anteriormente. Q representa un átomo de halógeno).

El compuesto representado por la Fórmula (I) puede producirse haciendo reaccionar un compuesto representado por la Fórmula (1) y un compuesto representado por la Fórmula (2) por métodos convencionales.

De acuerdo con la presente invención, la 7,8-difluoro-3-yodo-quinolina es un producto intermedio útil.

(Método de síntesis 2)



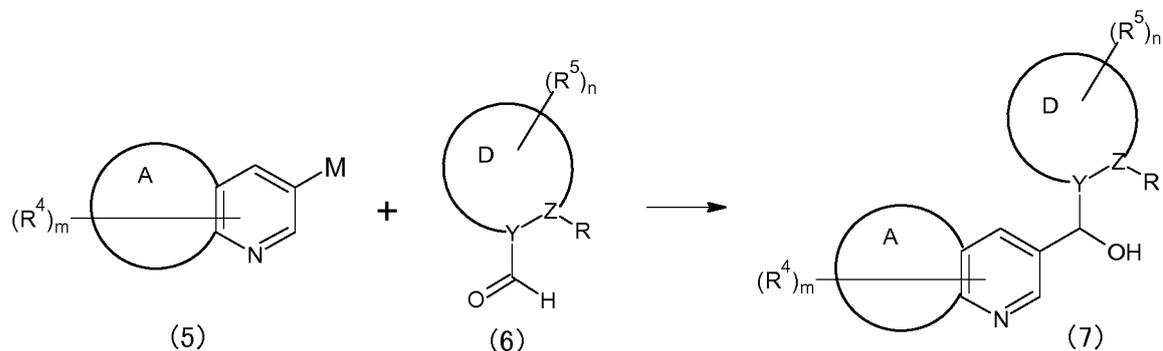
(En las fórmulas, R, R⁴, R⁵, A, D, Q, X, Y, Z, m y n representan el mismo significado que los descritos anteriormente).

10 El compuesto representado por la fórmula (I) puede producirse haciendo reaccionar un compuesto representado por la Fórmula (3) y un compuesto representado por la Fórmula (4) por métodos convencionales.

De acuerdo con la presente invención, 8-fluoro-3-hidroxiquinolina, 7,8-difluoro-3-hidroxiquinolina, 8-fluoro-3-hidroxi-2-metilquinolina o 7,8-difluoro-3-hidroxi-2-metilquinolina es un producto intermedio útil.

15

(Método de síntesis 3)



20 (En las fórmulas, R, R⁴, R⁵, A, D, X, Y, Z, m y n representan el mismo significado que los descritos anteriormente. M representa litio o magnesio).

25 Un compuesto representado por la Fórmula (5) se obtiene por litiación o complejación con magnesio usando un reactivo de alquil-litio o un reactivo de Grignard o un complejo fabricado preparado a partir de un reactivo de alquil-litio o un reactivo de Grignard, y después se añade un compuesto representado por la Fórmula (6), dando como resultado la producción de un compuesto representado por la Fórmula (7).

Los ejemplos del reactivo de alquil-litio usado en la litiación incluyen metil-litio, n-butil-litio, s-butil-litio, t-butil-litio y similares.

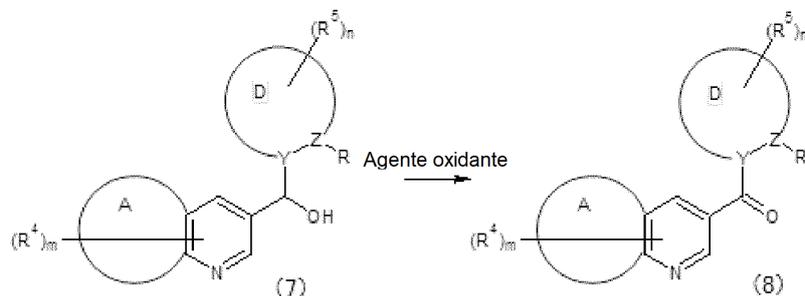
30

Los ejemplos del reactivo de Grignard utilizado en la complejación con magnesio incluyen cloruro de metilmagnesio, cloruro de etilmagnesio, cloruro de n-butilmagnesio, cloruro de i-propilmagnesio y similares. También, por ejemplo, puede usarse un complejo fabricado preparado a partir de cloruro de n-butilmagnesio y n-butil-litio.

35 Un disolvente utilizado en la litiación o la complejación con magnesio no está particularmente limitado siempre que forme un sistema de reacción anhidro sin disolver el compuesto para que reaccione con él o muestre alguna interacción particular con él. Los ejemplos adecuados de los mismos incluyen: un disolvente a base de alcano tal como pentano, hexano, heptano, ISOPAR (marca comercial registrada) E o ISOPAR (marca comercial registrada) G; un disolvente de base aromática tal como benceno, tolueno u ortoxileno; un disolvente a base de éter tal como éter dietílico o tetrahidrofurano; y una mezcla de los mismos. Entre estos, se prefiere un disolvente a base de éter tal como dietil éter o tetrahidrofurano. La reacción puede realizarse en una atmósfera de nitrógeno y en un sistema anhidro y puede prepararse a una temperatura de -10 °C a -78 °C.

40

(Método de síntesis 4)

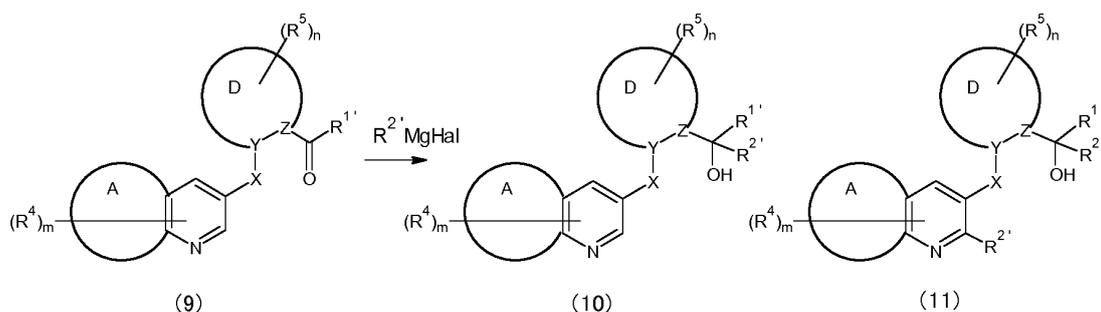


5 (En las fórmulas, R, R⁴, R⁵, A, D, Y, Z, m y n representan el mismo significado que los descritos anteriormente).

Un compuesto representado por la Fórmula (8) se produce por oxidación haciendo reaccionar un agente oxidante con un compuesto representado por la Fórmula (7). La reacción de oxidación anterior puede realizarse sin limitación particular siempre que la reacción oxide un grupo hidroxilo secundario. Por ejemplo, puede adoptarse un método de oxidación tal como una oxidación de Jones, una oxidación de ozono o una oxidación de Swern, o usando un reactivo de oxidación, tal como dióxido de manganeso o un reactivo de Dess-Martin.

10

(Método de síntesis 5)



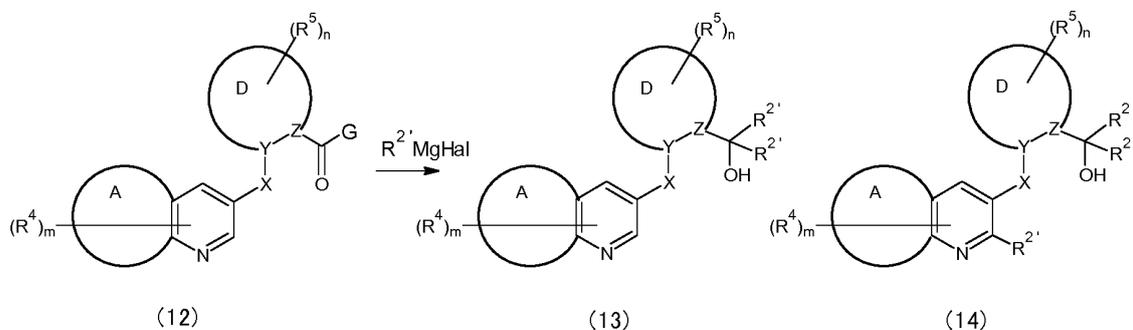
15 En las fórmulas, R⁴, R⁵, A, D, X, Y, Z, m y n representan el mismo significado que los descritos anteriormente. R¹ y R², entre los R¹ a R³ anteriores, representan un grupo alquilo sin sustituir o sustituido, un grupo alqueno sin sustituir o sustituido, un grupo alquilo sin sustituir o sustituido, un grupo arilo sin sustituir o sustituido o un anillo heterocíclico sin sustituir o sustituido. Hal representa un átomo de halógeno).

20

Un compuesto representado por la Fórmula (10) puede producirse haciendo reaccionar un equivalente de un reactivo de Grignard con un compuesto representado por la Fórmula (9). Además, un compuesto representado por la Fórmula (11) puede producirse haciendo reaccionar al menos dos equivalentes de un reactivo de Grignard con el compuesto representado por la Fórmula (9).

25

(Método de síntesis 6)



30 (En las fórmulas, R⁴, R⁵, R², A, D, X, Y, Z, m, n y Hal representan el mismo significado que los descritos anteriormente. G representa un grupo saliente, tal como un grupo alcoxi o un átomo de halógeno).

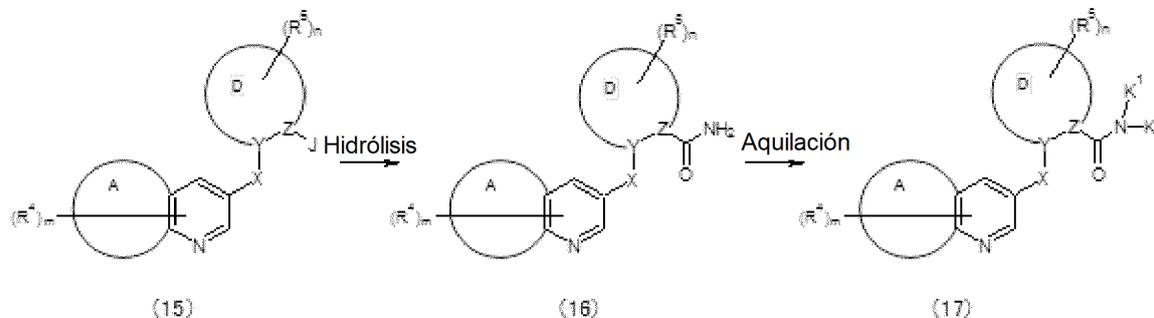
Un compuesto representado por la Fórmula (13) puede producirse haciendo reaccionar un equivalente de un reactivo de Grignard con un compuesto representado por la Fórmula (12). Además, un compuesto representado por

35

la Fórmula (14) puede producirse haciendo reaccionar al menos dos equivalentes de un reactivo de Grignard con el compuesto representado por la Fórmula (12).

(Método de síntesis 7)

5

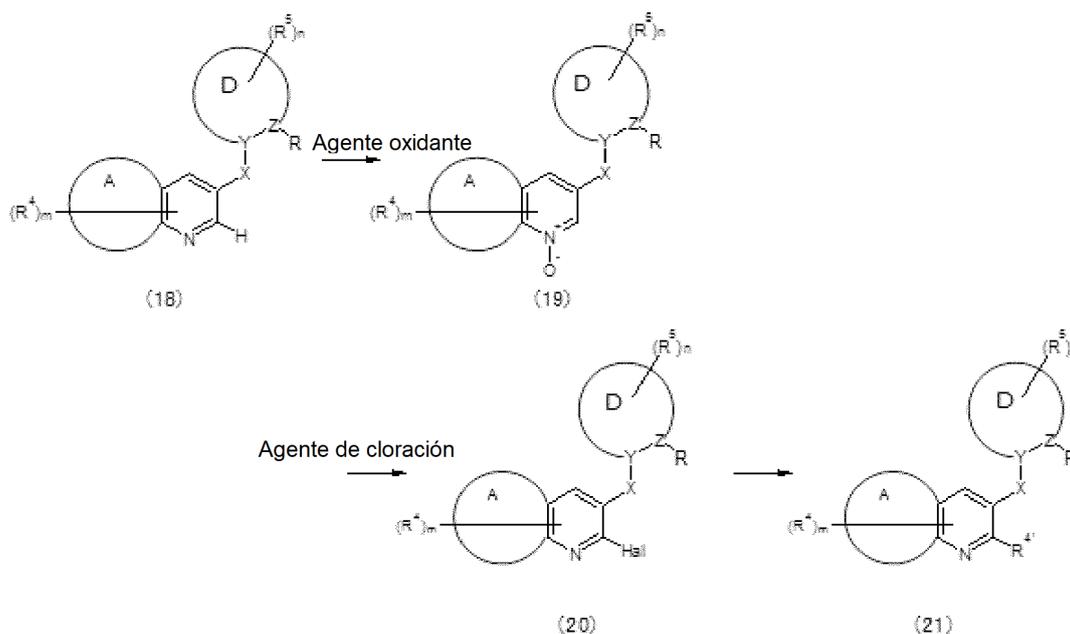


(En las fórmulas, R^4 , R^5 , A, D, X, Y, Z, m y n representan el mismo significado que los descritos anteriormente. J representa un grupo alcocarbonilo o un grupo ciano. K^1 y K^2 representan un grupo alquilo).

10

Un compuesto representado por la Fórmula (16) puede producirse por hidrólisis usando métodos convencionales. Además, un compuesto representado por la Fórmula (17) puede producirse haciendo reaccionar un agente alquilante en presencia de una base.

15 (Método de síntesis 8)



20

(En las fórmulas, R, R^4 , R^5 , A, D, X, Y, Z, m, n y Hal representan el mismo significado que los descritos anteriormente. $R^{4'}$ representa un grupo alcoxi sin sustituir o sustituido, un grupo alquilo sin sustituir o sustituido, un grupo alqueno sin sustituir o sustituido, un grupo alquilo sin sustituir o sustituido, un grupo arilo sin sustituir o sustituido o un anillo heterocíclico sin sustituir o sustituido, un grupo amino sin sustituir o sustituido o un grupo tioalquilo sin sustituir o sustituido).

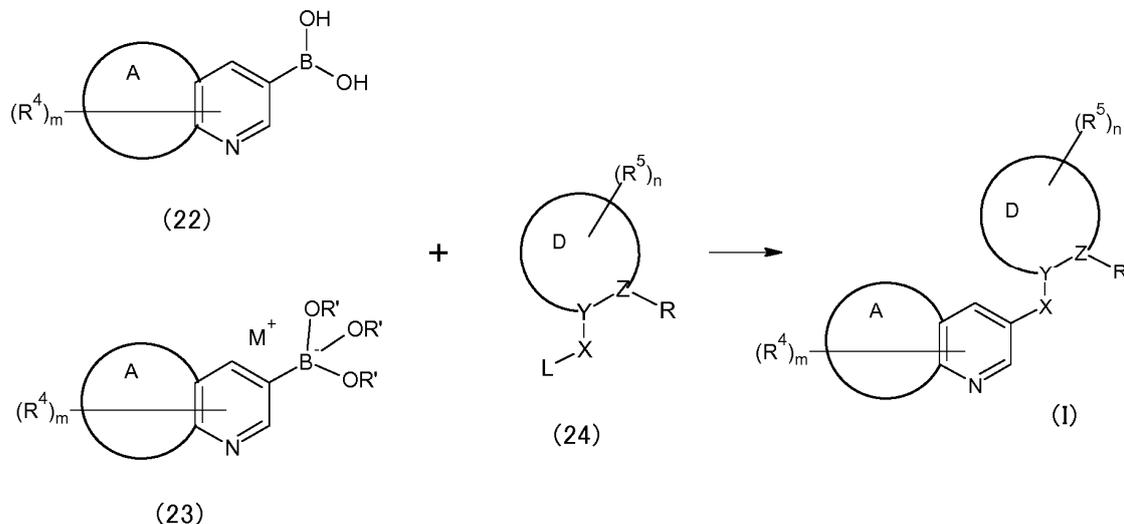
25

Un compuesto de N-óxido representado por la Fórmula (19) puede producirse oxidando un compuesto representado por la Fórmula (18) usando métodos convencionales tales como el uso de un agente oxidante. Un compuesto representado por la Fórmula (20) puede producirse haciendo reaccionar un agente halogenante convencional tal como oxiclورو de fósforo con el compuesto representado por la Fórmula (19). Y después, el compuesto representado por la Fórmula (20) se somete a una reacción de sustitución nucleófila o una reacción de acoplamiento

30

utilizando un catalizador de metal orgánico para sintetizar un compuesto representado por la Fórmula (21).

(Método de síntesis 9)



5 (En las fórmulas, R, R⁴, R⁵, A, D, X, Y, Z, m y n representan el mismo significado que los descritos anteriormente. R' representa un grupo alquilo C₁₋₈. M representa un metal alcalino tal como litio, sodio o potasio. L representa un átomo de halógeno.

10 El compuesto representado por la Fórmula (I) puede prepararse mediante una reacción de acoplamiento de Suzuki de un derivado de ácido borónico representado por la Fórmula (22) o la Fórmula (23) y un derivado de haluro representado por la Fórmula (24)

15 El compuesto de N-óxido puede prepararse mediante una reacción de oxidación convencional. Por ejemplo, en disolventes o en ausencia de disolventes, puede prepararse provocando contacto entre el compuesto representado por la Fórmula (I) y un peróxido tal como el peróxido de hidrógeno.

20 En cualquier reacción, después de que se completa la reacción, el resultado se somete a una operación normal posterior a la reacción en una química orgánica sintética y después se somete a una separación y purificación convencionales, si es necesario, para aislar eficientemente un producto deseado t

La estructura del producto deseado puede identificarse y confirmarse usando el espectro de RMN ¹H, el espectro de IR o las mediciones del espectro de masas o mediante análisis elemental o similar.

2) Fungicida agrícola

25 Un fungicida agrícola de acuerdo con la presente invención contiene, como principio activo de la misma, al menos uno seleccionado entre el grupo que consiste en el compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno, la sal del mismo y el compuesto de N-óxido del mismo.

30 El fungicida de acuerdo con la presente invención tiene una excelente capacidad fungicida sobre una amplia diversidad de hongos filamentosos, tales como bacterias que pertenecen a Oomicetos, Ascomicetos, Deuteromicetos o Basidiomicetos.

35 El fungicida de acuerdo con la presente invención puede usarse para prevenir diversas enfermedades que se producen en el cultivo de cultivos agrícolas incluyendo flores, césped y pasto a través del tratamiento con semillas, fumigación foliar, aplicación en el suelo o aplicación sumergida.

Por ejemplo, puede usarse para prevenir:

40 Remolacha azucarera: Mancha foliar por *Cercospora* (*Cercospora beticola*), Podredumbre de la raíz por *Aphanomyces* (*Aphanomyces cochlioides*), Podredumbre de la raíz (*Thanatephorus cucumeris*), Roya foliar (*Thanatephorus cucumeris*);
 Cacahuetes: Mancha foliar parda (*Mycosphaerella arachidis*), Roya foliar negra (*Mycosphaerella berkeleyi*);
 Pepinos: Mildiú blanco (*Sphaerotheca fuliginea*), Mildiú azul (*Pseudoperonospora cubensis*), Roya gomosa del tallo (*Mycosphaerella melonis*), Fusariosis (*Fusarium oxisporum*), Podredumbre por *Sclerotinia* (*Sclerotinia sclerotiorum*), Moho gris (*Botrytis cinerea*), Antracnosis (*Colletotrichum ohriculare*), Sarna (*Cladosporium cucumerinum*), Mancha foliar por *Corynespora* (*Corynespora cassicola*), Caída de almáciga (*Pythium debaryanum*, *Rhizoctonia solani Kuhn*), Mancha bacteriana (*Pseudomonas syringae pv Lecrymans*);

- Tomates: Moho gris (*Botrytis cinerea*), Moho foliar (*Cladosporium fulvum*), Roya tardía (*Phytophthora infestans*);
 Berenjenas: Moho gris (*Botrytis cinerea*), Podredumbre negra (*Corynespora melongenae*), Mildiú blanco (*Erysiphe cichoracearum*), Moho foliar (*Mycovellosiella natrassii*);
 5 Fresas: Moho gris (*Botrytis cinerea*), Mildiú blanco (*Sphaerotheca humuli*), Antracnosis (*Colletotrichum acutatum*, *Colletotrichum fragariae*), Podredumbre por Phytophthora (*Phytophthora cactorum*);
 Cebollas: Podredumbre del cuello (*Botrytis allii*), Moho gris (*Botrytis cinerea*), Roya foliar (*Botrytis squamosa*), Mildiú blanco (*Peronospora destructor*);
 Repollo: Hernia (*Plasmiodiophora brassicae*), Podredumbre blanda bacteriana (*Erwinia carotovora*), Mildiú azul (*Peronospora parasitica*);
 10 Alubias: Podredumbre del tallo (*Sclerotinia sclerotiorum*), Moho gris (*Botrytis cinerea*);
 Manzanas: Mildiú blanco (*Podosphaera leucotricha*), Sarna (*Venturia inaequalis*), Roya de la flor (*Monilinia mali*), Mancha del fruto (*Mycosphaerella pomi*), Chancro por Valsa (*Valsa mali*), Mancha por Alternaria (*Alternaria mali*), Tizón (*Gymnosporangium yamadae*), Podredumbre anular (*Botryosphaeria berengeriana*), Antracnosis (*Glomerella cingulata*, *Colletotrichum acutatum*), Mancha (*Diplocarpon mali*), Mosqueado (*Zygophiala jamaicensis*), Fumagina (*Gloeodes pomigena*);
 15 Caquis: Mildiú blanco (*Phyllactinia kակicola*), Antracnosis (*Gloeosporium kaki*), Mancha foliar angular (*Cercospora kaki*);
 Melocotones: Podredumbre parda (*Monilinia fructicola*), Sarna (*Cladosporium carpophilum*), Podredumbre por Phomopsis (*Phomopsis sp.*);
 20 Cerezas: Podredumbre parda (*Monilinia fructicola*);
 Uvas: Moho gris (*Botrytis cinerea*), Mildiú blanco (*Uncinula necator*), Podredumbre blanca de la vid (*Glomerella cingulata*, *Colletotrichum acutatum*), Mildiú azul (*Plasmopara viticola*), Antracnosis (*Elsinoe ampelina*), Roya foliar (*Pseudocercospora vitis*), Podredumbre negra (*Guignardia bidwellii*);
 Peras: Sarna (*Venturia nashicola*), Tizón (*Gymnosporangium asiaticum*), Mancha negra (*Alternaria kikuchiana*), Podredumbre anular (*Botryosphaeria berengeriana*), Mildiú blanco (*Phyllactinia mali*);
 25 Té: Roya gris (*Pestalotia theae*), Antracnosis (*Collectotrichum theae-sinensis*);
 Cítricos: Sarna (*Elsinoe fawcetti*), Moho azul (*Penicillium italicum*), Moho verde común (*Penicillium digitatum*), Moho gris (*Botrytis cinerea*), Melanosis (*Diaporthe citri*), Chancro (*Xanthomonas campestris pv. Citri*);
 30 Trigo: Mildiú blanco (*Erysiphe graminis f. sp. tritici*), Roya por Fusaria (*Gibberella zeae*), Tizón foliar (*Puccinia recondita*), Podredumbre de la raíz con pardeamiento (*Pythium iwayamae*), Moho de la nieve (*Monographella nivalis*), Cercosporodiosis (*Pseudocercospora herpotrichoides*), Mancha punteada foliar (*Septoria tritici*), Mancha de la pluma del trigo (*Leptosphaeria nodorum*), Roya de la nieve por Typhula (*Typhula incarnata*), Roya de la nieve por Sclerotinia (*Myriosclerotinia borealis*), Mal del pie del trigo (*Gaeumanomyces graminis*);
 35 Cebada: Estriado (*Pyrenophora graminea*), Mancha foliar (*Rhynchosporium secalis*), Carbón desnudo (*Ustilago tritici*, *U. nuda*);
 Arroz: Quemado del arroz (*Pyricularia oryzae*), Roya de la vaina (*Rhizoctonia solani*), Enfermedad de Bakanae (*Gibberella fujikuroi*), Mancha parda (*Cochliobolus niyabeanus*), Roya de la plántula (*Pythium graminicolum*), Roya foliar bacteriana (*Xanthomonas oryzae*), Roya bacteriana de la plántula (*Burkholderia plantarii*), Estriado pardo bacteriano (*Acidovorax avenae*), Podredumbre bacteriana del grano (*Burkholderia glumae*);
 40 Tabaco: Podredumbre del tallo por Sclerotinia (*Sclerotinia sclerotiorum*), Mildiú blanco (*Erysiphe cichoracearum*), Tulipanes: Moho gris (*Botrytis cinerea*), Agrostis: Roya de la nieve por Sclerotinia (*Sclerotinia borealis*), Roya bacteriana del brote (*Pythium aphanidennatum*);
 Pasto ovillo: Mildiú blanco (*Erysiphe graminis*);
 45 Soja: Mancha púrpura (*Cercospora kikuchii*), Mildiú azul (*Peronospora manshurica*), Podredumbre del tallo y de la raíz por Phytophthora (*Phytophthora sojae*);
 Patatas, tomates: Roya tardía (*Phytophthora infestans*);

o similares.

- 50 Además, el fungicida de acuerdo con la presente invención presenta un excelente efecto fungicida también sobre bacterias resistentes. Los ejemplos de bacterias resistentes incluyen: gérmenes de moho gris (*Botrytis cinerea*), gérmenes de la mancha marrón de la remolacha azucarera (*Cercospora beticola*), gérmenes de la sarna de la manzana (*Venturia inaequalis*), gérmenes de la sarna de la pera (*Venturia nashicola*), resistentes a un fungicida a base de benzimidazol tales como tiofanato de metilo, benomilo o carbendazim; gérmenes de moho gris (*Botrytis cinerea*) resistentes a un fungicida a base de dicarboximida (tales como vinclozolina, procimidona o iprodiona) y similares.

- 60 Los ejemplos de enfermedades en las que se prefiere más la aplicación del fungicida de acuerdo con la presente invención incluyen la sarna de manzana, el moho gris del pepino, mildiú polvoriento del trigo, tizón tardío del tomate, roya de la hoja del trigo, pudrición del cuello del arroz, enfermedad del marchitamiento pepino y similares.

Además, el fungicida de acuerdo con la presente invención es un agente con baja fitotoxicidad, baja toxicidad para peces o animales de sangre caliente y alta seguridad.

- 65 El fungicida de acuerdo con la presente invención puede usarse en una forma agroquímicamente aceptable, es decir, en forma de una formulación agroquímica, tal como un polvo dispersable en agua, gránulos, un polvo, una

emulsión, un polvo hidrosoluble, una suspensión o gránulos dispersables en agua.

Los ejemplos de un aditivo y un vehículo utilizados en la formulación de un sólido incluyen: polvo vegetal tal como harina de soja o harina de trigo; polvo fino mineral tal como diatomita, apatita, yeso, talco, bentonita, pirofilita o arcilla; un compuesto orgánico o inorgánico tal como benzoato de sodio, urea o sulfato de soda; y similares.

Los ejemplos de un disolvente utilizado en la formulación de un líquido incluyen: un hidrocarburo aromático tal como queroseno, xileno o un hidrocarburo aromático a base de petróleo; ciclohexano, ciclohexanona, dimetilformamida, dimetilsulfóxido, un alcohol, acetona, tricloroetileno, metilisobutilcetona, aceite mineral, aceite vegetal, agua y similares.

Además, en las formulaciones, con el fin de conseguir una forma uniforme y estable, puede añadirse un tensioactivo según sea necesario.

El tensioactivo que puede añadirse no está particularmente limitado. Los ejemplos del agente tensioactivo incluyen: un agente tensioactivo no iónico tal como alquilfeniléter con adición de polioxietileno, alquiléter con adición de polioxietileno, éster de ácido graso superior con adición de polioxietileno, éster de ácido graso superior de sorbitano con adición de polioxietileno, triestirilfeniléter con adición de polioxietileno; una sal de éster sulfúrico de alquilfeniléter con adición de polioxietileno, un sulfonato de alquilbenceno, una sal de éster sulfúrico de alcohol superior, un sulfonato de alquilnaftaleno, un policarboxilato, un sulfonato de lignina, un condensado de formaldehído de sulfonato de alquilnaftaleno, un copolímero de isobutileno-ácido maleico anhidro; y similares.

El polvo dispersable en agua obtenido de este modo, la emulsión, un agente fluido, el polvo hidrosoluble o los gránulos dispersables en agua se diluyen con agua a una concentración predeterminada y se usan como una solución, una suspensión o una emulsión para la pulverización sobre las plantas. Además, el polvo y los gránulos se utilizan pulverizados sobre las plantas tal cual.

La cantidad del fungicida de acuerdo con la presente invención es, normalmente, con respecto a la cantidad total de la formulación, preferentemente del 0,01 al 90 % en peso y más preferentemente del 0,05 al 85 % en peso.

La tasa de aplicación del fungicida de acuerdo con la presente invención, aunque difiere dependiendo de las condiciones climáticas, la forma de formulación, el tiempo de aplicación, el método de aplicación, el área de aplicación, la enfermedad de control diana o el cultivo diana, es, normalmente, como una cantidad de compuesto de principio activo por 1 hectárea, de 1 a 1.000 g y preferentemente de 10 a 100 g.

Cuando el polvo dispersable en agua, la emulsión, la suspensión, el polvo hidrosoluble o los gránulos dispersables en agua se diluyen con agua, la concentración aplicada es de 1 a 1.000 ppm y preferentemente de 10 a 250 ppm.

El fungicida de acuerdo con la presente invención puede mezclarse con otros fungicidas o insecticidas/acaricidas o sinergistas.

Los ejemplos representativos de otros fungicidas, insecticidas, acaricidas y reguladores del crecimiento de las plantas que pueden mezclarse y usarse con el fungicida de acuerdo con la presente invención se muestran a continuación.

Fungicida:

series de benzoimidazol tales como benomil, carbendazim, fuberidazol, tiabendazol o tiofanato de metilo;

series de dicarboximida, tales como clozolinato, iprodiona, procimidona o vinclozolina;

DMI-fungicida tal como imazalil, oxpoconazol, perfrazoato, procloraz, triflumizol, triforina, pirifenox, fenarimol, nuarimol, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, fulsilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconzol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, etaconazol, furonazol-cis, ipconazol o imibonazolazol;

series de fenilamida, tales como benalaxilo, furalaxilo, metalaxilo, metalaxil-M, oxadixilo u ofuraza;

series de aminas como aldimorf, dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidina, piperalina o espiroxamina;

series de fosforotiolatos tales como EDDP, iprobenfos, pirazofos;

series de ditiolano tales como isoprotilano;

series de carboxamida tales como benodanilo, boscalid, carboxina, fenfurano, flutolanil, furametpir, mepronil, oxicarboxina, pentiopirad o tifulzamida;

hidroxi-(2-amino)pirimidina tal como bupurimato, dimetirimol o etirimol;

Fungicida de AP (anilino pirimidina) tal como ciprodinilo, mepanipirim o pirimetanilo;

N-fenilcarbamato tal como dietofencarb; Qo1-fungicida (inhibidor de Qo) tal como azoxistrobina, picoxistrobina, piraclostrobina, kresoxim-metilo, trifloxistrobina, dimoxistrobina, metominostrobin, orisastrobina, famoxadona, fluoxastrobina, fenamidone, metominofeno, piribenbenocido;

Fungicida de PP (fenilpirrol) tal como fepiconilo, fludioxonilo;
serie de quinolina tal como quinoxifeno;

Fungicida de AH (hidrocarburo aromático) tal como bifenilo, cloroneb, diclorano, quintoceno, tecnazeno o toltfosmetilo;

- 5 MBI-R tal como ftalida, piroquilón o triciclazol;
MBI-D tal como carpropamid, diclocimet o fenoxanil;
Agente de SBI tal como fenhexamid, piributicarb o terbinafina;
fenilurea tal como pencifurón;
Qil-fungicida (inhibidor de Qi) tal como cyazofamid;
- 10 benzamida tal como zoxamida;
enopiranurón tal como blasticidina, mildiomicina;
hexopiranosilo tal como kasugamicina;
glucopirocilo tal como estreptomycinina, validamicina;
cianoacetamida tal como cimoxanilo;
- 15 carbamato tal como propamocarb, protiocarb o policarbamato;
agente de desacoplamiento tal como binapacril, dinocap, ferimzona o fluazinam;
compuesto de organoestaño tal como acetato de trifenilestaño, cloruro de trifenilestaño o hidróxido de trifenilestaño;
organofosfato tal como ácido fosfórico, tolclofos-metilo o fosetilo;
ácido ftálmico tal como techoflofalam;
- 20 benzotriazina tal como triazóxido;
bencenosulfonamida tal como flusulfamida;
piridazinona tal como diclomezina;
Fungicida de CAA (ácido carboxílico amida) tal como dimetomorf, flumorf, bentiavalicarb, iprovalicarb o mandipropamid;
- 25 tetraciclina tal como oxitetraciclina;
tiocarbamato tal como metasulfocarb; u
otros compuestos tales como etridiazol, polioxina, ácido oxolínico, hidroxiisoxazol, octinolina, siltiofam, diflumetorim, acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinil, etaboxam, ciflufenamid, proquinazid, metrafenona, fluopicólido, hidróxido de cobre(II), organocobre, azufre, ferbam, manzeb, maneb, metiram, propineb, tiuram, zineb, ziram, captan, captafol,
- 30 folpet, clorotalonilo, diclofluanid, toliifluanid, dodina, guazatina, iminoctadina, anilazina, ditianon. Cloropicrina, dazomet, metam-sodio, quinometionat, ciprofuram, siltiofam, agrobacterias o fluoroimida.

Insecticidas · acaricidas:

- 35 Insecticidas de serie organofosforados y carbamatos:
fentiión, fenitrotión, diazinón, clorpirifos, ESP, vamidotión, fetoato, dimetoato, formotión, malat'n, triclorón, feilrotión, fosmet, diclorvos, acefato, EPBP, metil paratión, oxidemeton-metil, etiión, salition, cianofos, isoxatiión, piridafentiión, fosalona, metidatiión, sulfopros, clorfenvinfos, tetraclorvinfos, dimetilvinfos, propafos, isofenfos, etiltiometon, profenosos, piraclfos, monocrotofos, Azinfos-mtilo, aldicarb, metomil, tiodicarb, carbofuano, carbosulfano,
- 40 benfuracarbo, furatiocarbo, propoxur, BPMC, MTMC, MIPC, carbarilo, pirimicarb, etiofencarb, fenoxicarb, EDDP o similares.

Insecticidas de la serie piretroide:

- 45 Permetrina, cipermetrina, deltametrina, fenvalerato, fenpropatrina, piretrina, aletrina, tetrametrina, resmetrina, dimetrina, propatrina, fenotrina, protrina, fluvalinato, ciflutrina, cihalotrina, flucitrinato, etofenprox, cicoprotrina, tralometrina, silafluofen, brofenprox, acrinatrin o similares.

Otros insecticidas de la serie de benzoilurea:

- 50 productos agroquímicos microbianos tales como diflubenzurón, clorfluazurón, hexaflumurón, triflumurón, tetrabenzurón, flufenoxurón, fluciclozurón, buprofezina, piriproxifeno, metopreno, benzoepina, diafentiurón, acetamiprid, imidacloprid, nitenpiram, fipronil, cartap, tiociclam, bensultap, sulfato e nicotina, rotenona, metaldehído, aceite de motor, BT, virus patógenos de insectos o similares.

Nematocidas:

- 55 Fenamifos, fostiazato o similares.

Acaricidas:

- 60 clorobencilato, fenisobromolato, dicofol, amitraz, BPPS, benzomato, hexitiazox, óxido de fenbutatina, polinactinas, quinometionato, CCBS, tetradifón, avermectina, milbrectina, clofentezina, cihexatina, piridabén, fempiproximato, tebufenpirad, piridifén, fenotioarb, dienoclor o similares.

Regulador del crecimiento de las plantas:

- 65 ácido abscísico, ácido indolebutírico, uniconazol, etilclozato, etefón, cloxifonaco, clormequato, extracto de clorella, peróxido de calcio, cianamida, diclorprop, gibberelina, daminozida, alcohol decílico, trinexapac-etilo, cloruro de mepiquat, paclobutrazol, parafina, cera, butóxido de piperonilo, pirafufen-etilo, flurprimidol, prohidrojasmoón, prohexadiona-calcio, bencilaminopurina, pendimetalina, forclorfenurón, hidrazida maleica de potasio, 1-

naftilacetamida,-CPA, MCPB, corrina, sulfato de oxiquinolina, etilclozato, butralina, -metilcicloprpeno, clorhidrato de aviglicina.

Descripción detallada de la invención

5

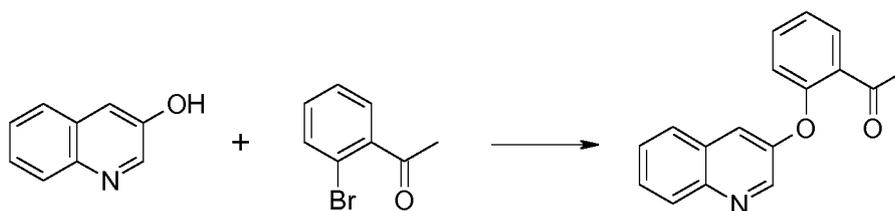
[Ejemplos]

En lo sucesivo en el presente documento, la presente invención se describe en más detalle con referencia a los ejemplos, sin embargo, la presente invención no está limitada en lo más mínimo por los siguientes ejemplos. Obsérvese que solo los ejemplos 6 a 10, 16 a 18, 20, 21 y 24 a 26 conducen a compuestos de acuerdo con la invención.

10

Ejemplo 1

15 Síntesis de 1-[2-(quinolin-3-iloxi)-fenil]-etanona

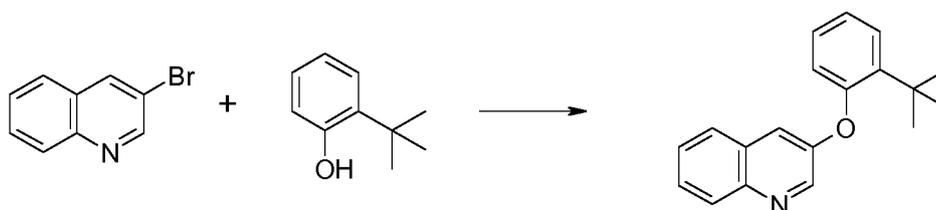


20 Se disolvieron 0,73 g de 3-quinolinol, 1,8 g de carbonato de cesio, 0,18 g de dipivaloilmetano, 2,0 g de 2-bromoacetofenona y 0,50 g de cloruro de cobre (I) en 10 ml de N-metilpirrolidona y la mezcla se agitó durante 3 horas a 130 °C. El resultado se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice y se obtuvieron 0,82 g de 1-[2-(quinolin-3-iloxi)-fenil]-etanona (Número de compuesto 1).

25 Los compuestos representados por los números de compuesto 2 a 13 se sintetizaron de la misma manera que en el Ejemplo 1.

Ejemplo 2

30 Síntesis de 3-(2-t-butil-fenoxi)-quinolina

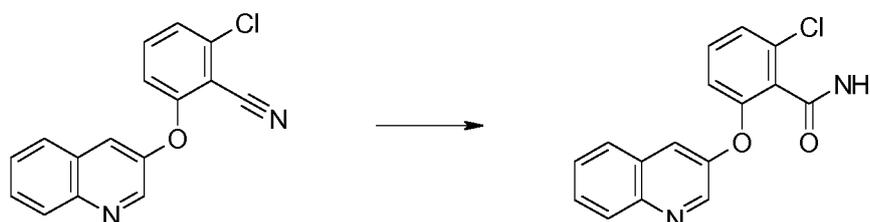


35 Se disolvieron 0,60 g de 2-t-butilfenol, 1,3 g de carbonato de cesio, 0,07 g de dipivaloilmetano, 0,42 g de 3-bromoquinolina y 0,20 g de cloruro de cobre (I) en 4 ml de N-metilpirrolidona y la mezcla se agitó durante un día a 130 °C. El resultado se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice y se obtuvieron 0,04 g de 3-(2-t-butil-fenoxi)-quinolina (número de compuesto 14).

40 Los compuestos representados por los números de compuesto 15 a 19 se sintetizaron de la misma manera que en el ejemplo 2.

Ejemplo 3

Síntesis de 2-cloro-6-(quinolin-3-iloxi)-benzamida



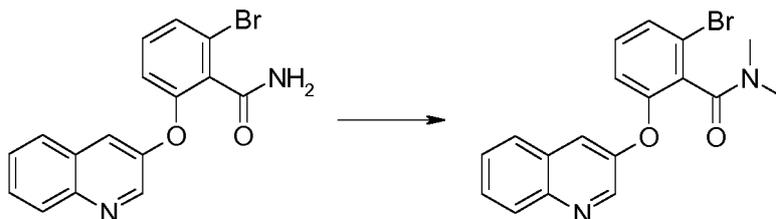
45

Se disolvieron 1,18 g de 2-cloro-6-(quinolina-3-iloxi)-benzonitrilo en 5 ml de ácido sulfúrico al 80 % y la mezcla se agitó durante 3 horas a 100 °C. Después de neutralizarse con una solución acuosa de hidróxido de sodio, el líquido se separó con acetato de etilo, la capa orgánica se concentró y se obtuvieron 1,03 g de 2-cloro-6-(quinolin-3-iloxi)-benzamida (número de compuesto 20).

5 Un compuesto representado por el número de compuesto 21 se sintetizó de la misma manera que en el Ejemplo 3.

Ejemplo 4

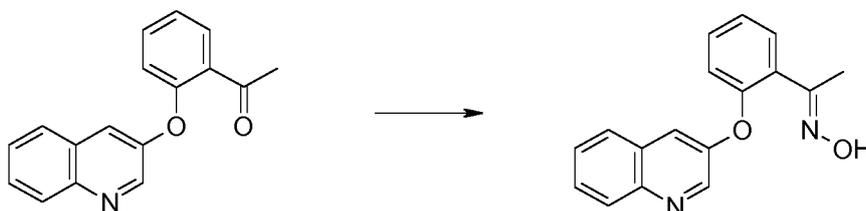
10 Síntesis de 2-bromo-N,N-dimetil-6-(quinolin-3-iloxi)-benzamida



15 Después de que se disolvieran 0,34 g de 2-bromo-6-(quinolin-3-iloxi)-benzamida en 2 ml de N-metilpirrolidona, se añadieron 47 mg de hidruro de sodio a temperatura ambiente. Después de añadir 0,21 g de yoduro de metilo a la solución de reacción, la mezcla se calentó a 100 °C y se agitó durante 4 horas. Después de separar el líquido con acetato de etilo, el disolvente se evaporó y el producto resultante se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,11 g de 2-bromo-N,N-dimetil-6-(quinolin-3-iloxi)-benzamida (número de compuesto 22).

20 Ejemplo 5

Síntesis de 1-[2-(quinolin-3-iloxi)-fenil]-etanona oxima

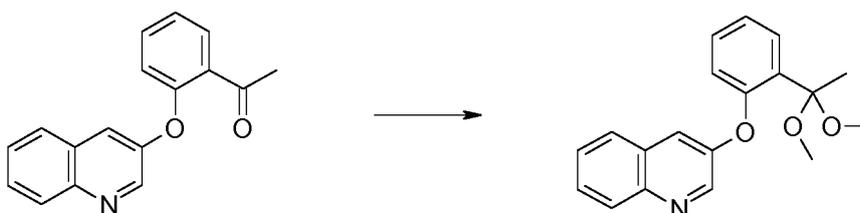


25 Se disolvieron 0,46 g de 1-[2-(quinolin-3-iloxi)-fenil]-etanona y 0,15 g de clorhidrato de hidroxilamina en 3 ml de piridina y después la mezcla se agitó durante 24 horas a temperatura ambiente. Después la mezcla de reacción se trató con ácido clorhídrico diluido y se separó con acetato de etilo, la capa orgánica se concentró para obtener 0,54 g de oxima de 1-[2-(quinolin-3-iloxi)-fenil]-etanona (número de compuesto 23).

30 Los compuestos representados por los números de compuesto 24 a 26 se sintetizaron de la misma manera que en el ejemplo 5.

Ejemplo 6

35 Síntesis de 3-[2-(1,1-dimetoxi-etil)-fenoxi]-quinolina



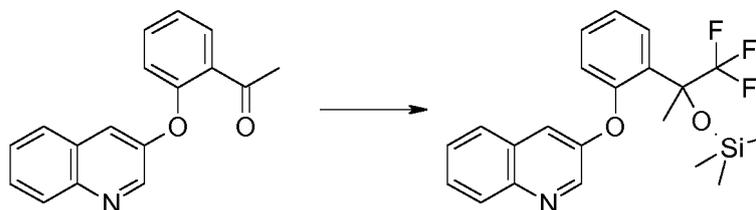
40 Después de que se disolvieran 0,13 g de 1-[2-(quinolin-3-iloxi)-fenil]-etanona y 0,06 g de ortoformiato de trimetilo en 1,5 ml de metanol, se añadieron 0,02 g de tribromuro de tetrabutilamonio y la mezcla se agitó durante 4 días a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se concentró y después se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,08 g de 3-[2-(1,1-dimetoxi-etil)-fenoxi]-quinolina (número de compuesto 27).

45

Ejemplo 7

Síntesis de 3-[2-(2,2,2-trifluoro-1-metil-1-trimetilsilaniloxi-etil)-fenoxi]-quinolina

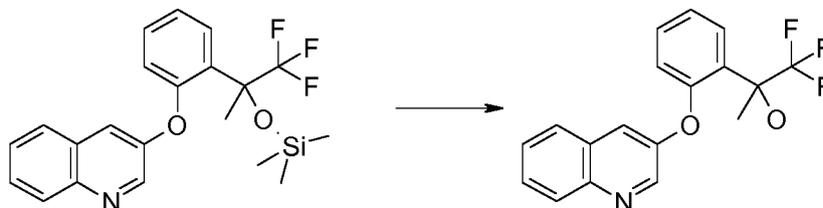
5



Después de que se disolvieran 0,26 g de 1-[2-(quinolin-3-iloxi)-fenil]-etanona y 0,16 g de (trifluorometil)trimetilsilano en 3 ml de tetrahidrofurano, se añadieron 2 gotas de fluoruro de tetrabutilamonio (solución de tetrahidrofurano 1,0 M) con enfriamiento con hielo y después a mezcla se agitó durante 4 horas. Después de que la mezcla de reacción se concentrara y se purificara mediante cromatografía en columna de gel de sílice, se obtuvieron 0,34 g de 3-[2-(2,2,2-trifluoro-1-metil-1-trimetilsilaniloxi-etil)-fenoxi]-quinolina (número de compuesto 28).

Ejemplo 8

15 Síntesis de 1,1,1-trifluoro-2-[2-(quinolin-3-iloxi)-fenil]-propan-2-ol

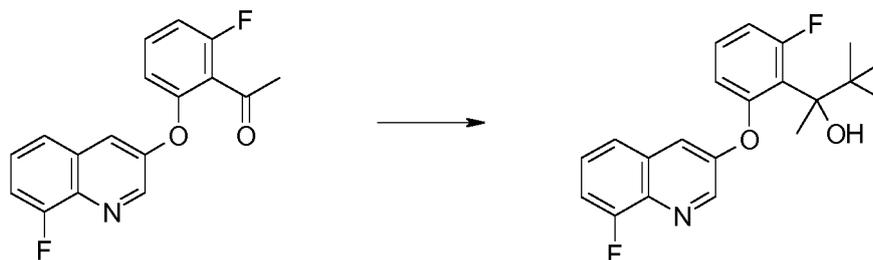


Después de que se disolvieran 0,17 g de 3-[2-(2,2,2-trifluoro-1-metil-1-trimetilsilaniloxi-etil)-fenoxi]-quinolina en 1,5 ml de tetrahidrofurano, se añadió 1 ml de fluoruro de tetrabutilamonio (solución de tetrahidrofurano 1,0 M) y la mezcla se agitó durante 16 horas. La mezcla de reacción se concentró y después se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,11 g de 1,1,1-trifluoro-2-[2-(quinolin-3-iloxi)-fenil]-propan-2-ol (número de compuesto 29).

Ejemplo 9

Síntesis de

30 2-[2-fluoro-6-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-fenil]-3,3-dimetil-butan-2-ol



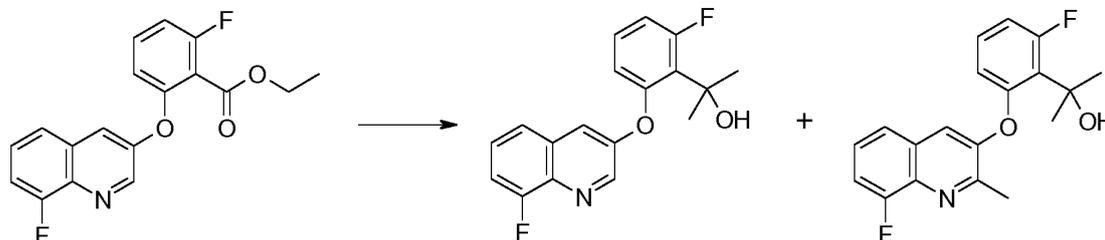
Después de que disolvieran 0,15 g de 1-[2-fluoro-6-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-fenil]-etanona en 1,5 ml de tetrahidrofurano y después de que la solución se enfriara a $-78\text{ }^{\circ}\text{C}$, se añadieron 0,3 ml de cloruro de t-butilmagnesio (solución en éter dietílico 2,0 M) gota a gota. Después de aumentar la temperatura de reacción a temperatura ambiente, la solución de reacción se trató con ácido clorhídrico diluido y después el líquido se separó con acetato de etilo. La capa orgánica se concentró y después se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,04 g de 2-[2-fluoro-6-(8-fluoro-quinolin-3-iloxi)-fenil]-3,3-dimetilbutan-2-ol (número de compuesto 30).

40 Los compuestos representados por los números de compuesto 31 a 35 se sintetizaron de la misma manera que en el Ejemplo 9.

Ejemplo 10

Síntesis de 2-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)fenil]propan-2-ol y 2-[2-fluoro-6-(8-fluoro-2-metilquinolin-3-iloxi)fenil]propan-2-ol

5



Después de que se disolvieran 0,3 g de éster etílico del ácido 2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-benzoico en 4,5 ml de tetrahidrofurano, la solución se enfrió a $-78\text{ }^{\circ}\text{C}$ y se añadieron gota a gota 0,77 ml de cloruro de metilmagnesio (solución en éter dietílico 3,0 M). Después de aumentar la temperatura de reacción a temperatura ambiente, la solución de reacción se trató con ácido clorhídrico diluido y el líquido se separó con acetato de etilo. La capa orgánica se concentró y después se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,12 g de 2-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)fenil]propan-2-ol (número de compuesto 36) y 0,05 g de 2-[2-fluoro-6-(8-fluoro-2-metilquinolin-3-iloxi)fenil]propan-2-ol (número de compuesto 37).

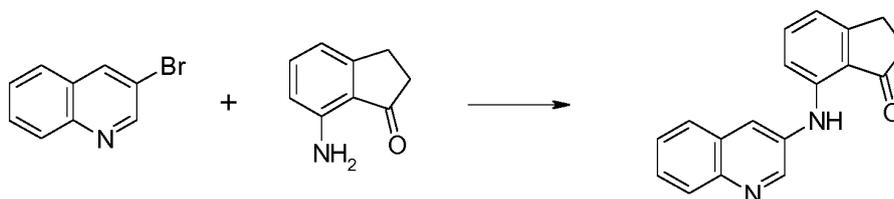
15

Los compuestos representados por los números de compuesto 38 a 49 se sintetizaron de la misma manera que en el Ejemplo 10.

Ejemplo 11

20

Síntesis de 7-(quinolin-3-ilamino)-indan-1-ona



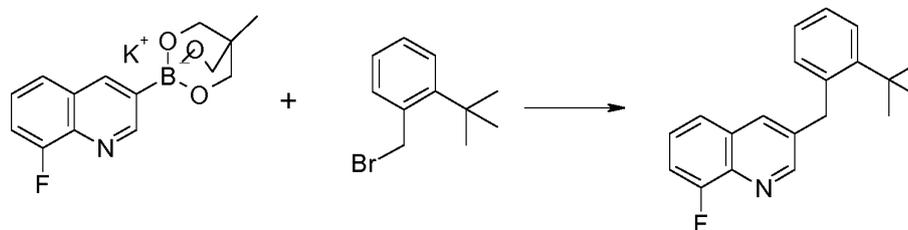
Se mezclaron 0,43 g de 3-bromoquinolina, 0,29 g de 7-aminoindan-1-ona, 0,08 g de yoduro de cobre (I), 0,41 g de carbonato de potasio y 4 ml de N-metilpirrolidona y después la mezcla se agitó durante 2 horas a $200\text{ }^{\circ}\text{C}$. La mezcla resultante se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,15 g de 7-(quinolin-3-ilamino)-indan-1-ona (número de compuesto 50).

Un compuesto representado por el número de compuesto 51 se sintetizó de la misma manera que en el Ejemplo 11.

Ejemplo 12

Síntesis de 3-(t-butil-bencil)-8-fluoroquinolina

35

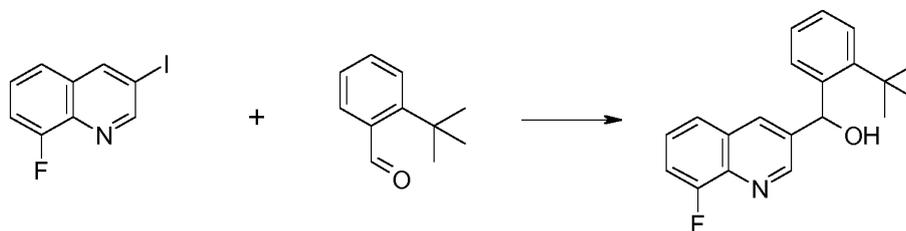


Después de que se disolvieran 0,69 g de sal de triol derivada de ácido 8-fluoroquinolina-3-bórico y 1,1,1-tris(hidroximetil)etano por un método descrito en la bibliografía (*Angew. Chem. Int. Ed.*, 2008, 47, 928-931) y 0,45 g de 1-bromometil-2-t-butilbenceno en 10 ml de tolueno, se añadieron 0,46 g de tetraquis trifenilfosfina paladio y la mezcla se agitó durante 3 horas. Después de que el disolvente de la mezcla de reacción se evaporara, el producto resultante se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 0,14 g de 3-(t-butil-bencil)-8-fluoroquinolina (número de compuesto 52).

Un compuesto representado por el número de compuesto 53 se sintetizó de la misma manera que en el Ejemplo 12.

Ejemplo 13

Síntesis de (2-t-butil-fenil)-(8-fluoro-quinolin-3-il)-metanol



5

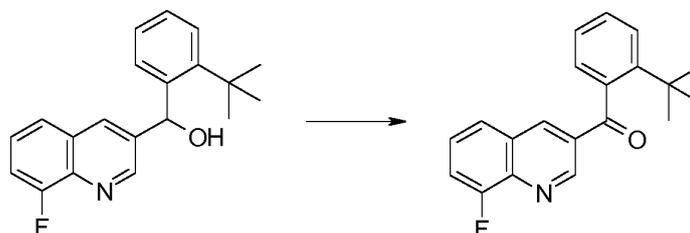
Después de que se enfriaran 3 ml de tetrahidrofurano a $-10\text{ }^{\circ}\text{C}$, se añadieron 0,91 ml de n-butil-litio (solución en hexano 2,6 M) y 1,35 ml de cloruro de n-butilmagnesio (solución en tetrahidrofurano 0,91 M). Después de 30 minutos de agitación, se añadieron 0,98 g de 8-fluoro-3-yodoquinolina y la mezcla se agitó durante 15 minutos. Se añadieron 0,49 g de 2-t-butilbenzaldehído a la solución de reacción y la mezcla se agitó durante 3 horas. Después de que se añadiera ácido clorhídrico diluido a la mezcla de reacción, el líquido se separó con acetato de etilo. Después de que se concentrara y se purificara la capa orgánica mediante cromatografía en columna de gel de sílice, se obtuvieron 0,55 g de (2-t-butil-fenil)-(8-fluoro-quinolin-3-il)metanol (número de compuesto 54).

10

15 Los compuestos representados por los números de compuesto 55 a 56 se sintetizaron de la misma manera que en el Ejemplo 13.

Ejemplo 14

20 Síntesis de (2-t-butil-fenil)-(8-fluoro-quinolin-3-il) metanona



25

Después de que se disolvieran 0,32 g de (2-t-butil-fenil)-(8-fluoro-quinolin-3-il)-metanol en 3 ml de diclorometano, se añadieron 0,51 g de reactivo Dess-Martin y la mezcla se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. Después de que se añadiera agua y después se separara el líquido con acetato de etilo, la capa orgánica se concentró y se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,21 g de (2-t-butil-fenil)-(8-fluoro-quinolin-3-il)-metanona (número de compuesto 57).

30 Los compuestos representados por los números de compuesto 58 a 59 se sintetizaron de la misma manera que en el Ejemplo 14.

Ejemplo 15

35 Síntesis de 2-cloro-3-(1,1-dimetilindan-7-iloxi) quinolina

Se disolvieron 0,2 g de 3-(1,1-dimetilindan-7-iloxi)quinolona en 5 ml de cloroformo y se añadieron 0,2 g de m-CPBA (70 %) y la mezcla se agitó durante la noche a temperatura ambiente. Después de que la mezcla de reacción se diluyera con cloroformo y se lavara con agua saturada con bicarbonato de sodio, se añadió sulfato de magnesio para secar el producto resultante. El disolvente se evaporó a presión reducida para obtener 0,2 g de 3-(1,1-dimetilindan-7-iloxi)quinolina-N-óxido.

40

El producto resultante se disolvió en oxiclورو de fósforo y se calentó a reflujo durante 4 horas. El oxiclورو de fósforo se evaporó a presión reducida y el residuo se disolvió en acetato de etilo y se lavó con agua saturada de bicarbonato de sodio. La capa orgánica se secó con sulfato de magnesio y se evaporó a presión reducida. El producto en bruto obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice y se obtuvieron 0,13 g de 2-cloro-3-(1,1-dimetilindan-7-iloxi)quinolina (número de compuesto 60).

45

Un compuesto representado por el número de compuesto 61 se sintetizó de la misma manera que en el Ejemplo 15.

50

Ejemplo 16

Síntesis de 3-(2-cianofenoxi)quinolina

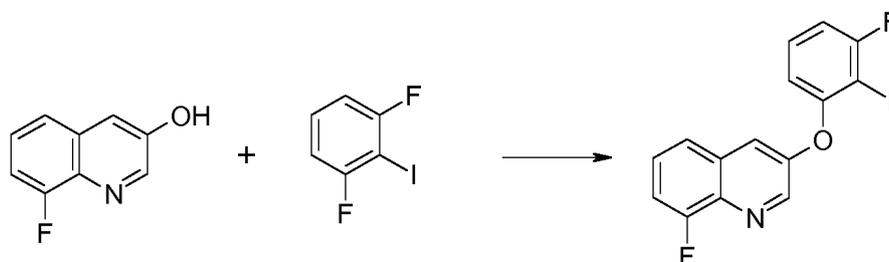
- 5 Después de que se disolvieran 0,27 g de 3-hidroxiquinolina en N-metil-2-pirrolidona, se añadieron 0,087 g de hidruro de sodio (60 % de dispersión en aceite) con enfriamiento con hielo y la mezcla se agitó durante 30 minutos. A la misma temperatura, se añadieron 0,27 g de 2-fluorobenzonitrilo y después la mezcla se agitó durante 6 horas a temperatura ambiente. Después de que la mezcla de reacción se vertiera en agua con hielo, se extrajo con acetato de etilo y se lavó con solución salina saturada, el producto resultante se secó con sulfato de magnesio. Después de
10 evaporar el disolvente a presión reducida, el producto en bruto se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 0,37 g de 3-(2-cianofenoxi)quinolina (número de compuesto 62).

Los compuestos representados por los números de compuesto 63 a 66 se sintetizaron de la misma manera que en el Ejemplo 16.

Ejemplo 17

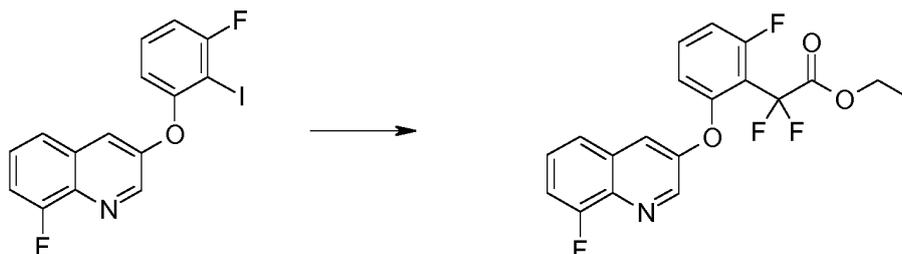
Síntesis de acetato de difluoro-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-etilo]

- 20 Etapa 1) Síntesis de 8-fluoro-3-(3-fluoro-2-yodofenoxi)-quinolina



- 25 Se añadieron 16 ml de N-metilpirrolidona a 1,06 g de 8-fluoro-3-hidroxiquinolina, 1,94 g de 2,6-difluoroyodobenceno y 1,7 g de carbonato de potasio y la mezcla se agitó durante 24 horas a 130 °C. La solución de reacción se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice y se obtuvieron 0,55 g de 8-fluoro-3-(3-fluoro-2-yodofenoxi)-quinolina.

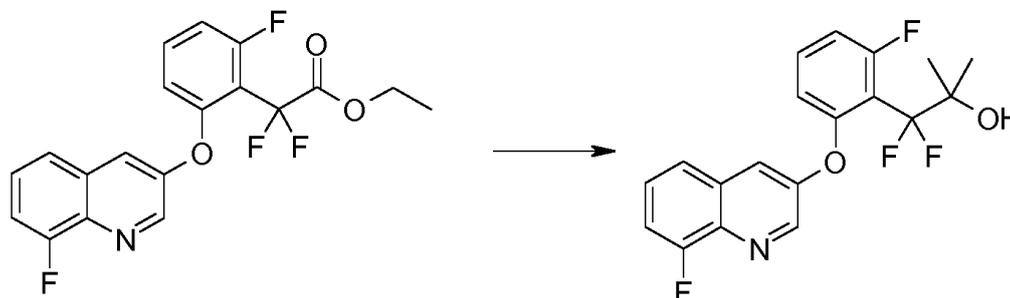
- 30 Etapa 2) Síntesis de acetato de difluoro-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-etilo]



- 35 Después de que se disolvieran 0,4 g de 8-fluoro-3-(3-fluoro-2-yodofenoxi)-quinolina en 4 ml de dimetilsulfóxido, se añadieron 0,25 g de cobre (polvo) y 0,41 g de acetato de bromodifluoroetilo a la misma y después la mezcla se agitó durante 24 horas a 40 °C. La solución de reacción se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice y se obtuvieron 0,27 g de acetato de difluoro-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-etilo] (número de compuesto 292).

Ejemplo 18

Síntesis de 1,1-difluoro-1-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-fenil]-2-metil-propan-2-ol



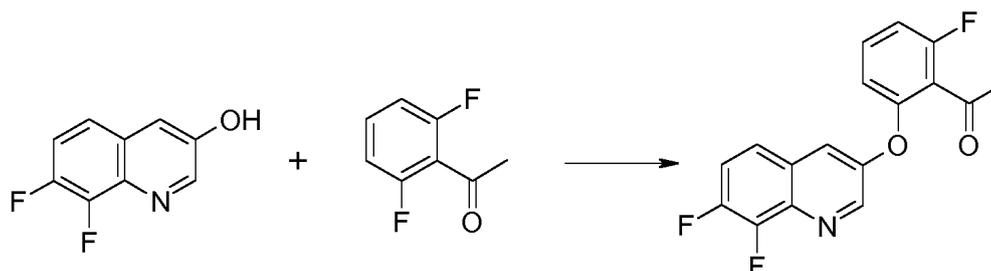
5

Se disolvieron 0,18 g de acetato de difluoro-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-etilo en 3 ml de tetrahidrofurano y se añadieron gota a gota a 0 °C 0,4 ml de cloruro de metilmagnesio (solución en tetrahidrofurano 3,0 M). Después de que se agitara la mezcla durante 2 horas a 0°C, se añadió ácido clorhídrico diluido y el líquido se separó con acetato de etilo. La capa orgánica se concentró y se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,10 g de 1,1-difluoro-1-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-fenil]-2-metil-propan-2-ol (número de compuesto 293).

10

Ejemplo 19

Síntesis de 1-[2-(7,8-difluoroquinolin-3-iloxi)-6-fluoro-fenil]etanona



15

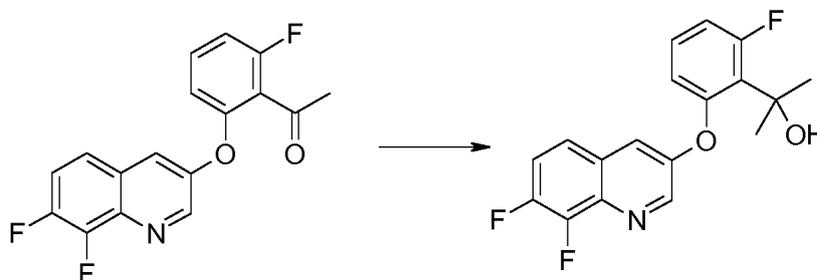
Después de que se disolvieran 0,91 g de 7,8-difluoro-3-hidroxiquinolina y 0,94 g de 2,6-difluoroacetofenona en 10 ml de dimetilformamida, se añadieron 0,9 g de carbonato de potasio. La solución de reacción se calentó a 100°C y la mezcla se agitó durante 4,5 horas. Se añadió ácido clorhídrico diluido a la solución de reacción y la solución se separó con acetato de etilo. La capa orgánica se concentró y se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,64 g de 1-[2-(7,8-difluoroquinolin-3-iloxi)-6-fluoro-fenil]-etanona (número de compuesto 391).

20

25

Ejemplo 20

Síntesis de 2-[2-(7,8-difluoroquinolin-3-iloxi)-6-fluoro-fenil]-propan-2-ol



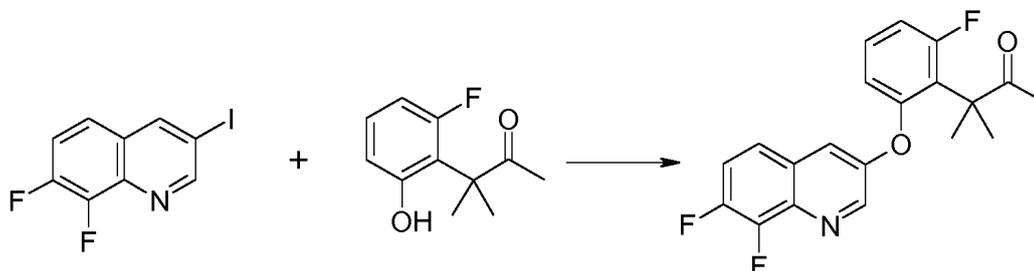
30

Después de que se disolvieran 0,64 g de 1-[2-(7,8-difluoroquinolin-3-iloxi)-6-fluoro-fenil]-etanona en 10 ml de tetrahidrofurano, el producto resultante se enfrió a 0 °C y se añadieron gota a gota 1,5 ml de cloruro de metilmagnesio (solución de tetrahidrofurano 3,0 M). Se añadió ácido clorhídrico diluido a la solución de reacción y el líquido se separó con acetato de etilo. La capa orgánica se concentró y se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,49 g de 2-[2-(7,8-difluoroquinolin-3-iloxi)-6-fluoro-fenil]-propan-2-ol (número de compuesto 124).

35

Ejemplo 21

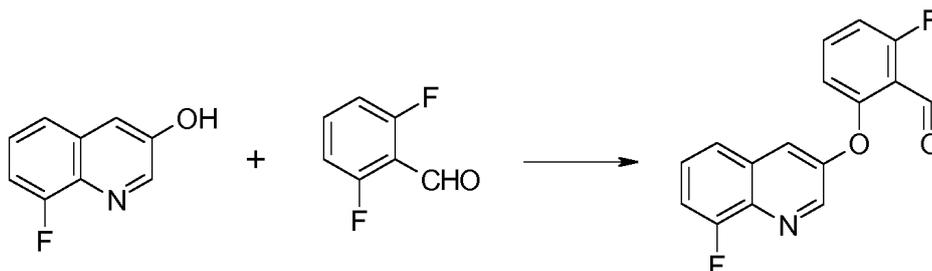
Síntesis de 3-[2-(7,8-difluoroquinolin-3-iloxi)-6-fluoro-fenil]-3-metil-butan-2-ona



10 Se añadieron 3 ml de N-metilpirrolidona a 0,78 g de 7,8-difluoro-3-yodoquinolina, 0,26 g de 3-(2-fluoro-6-hidroxifenil)-3-metil-butan-2-ona, 1,05 g de carbonato de cesio, 53 mg de dipalmitato y 0,27 g de cloruro de cobre (I). Después de 48 horas de agitación a 130°C, la solución de reacción se filtró con CELITE y el líquido se separó con acetato de etilo. La capa orgánica se concentró y se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,05 g de 3-[2-(7,8-difluoroquinolin-3-iloxi)-6-fluoro-fenil]-3-metil-butan-2-ona (número de compuesto 267).

Ejemplo 22

Síntesis de 2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-benzaldehído

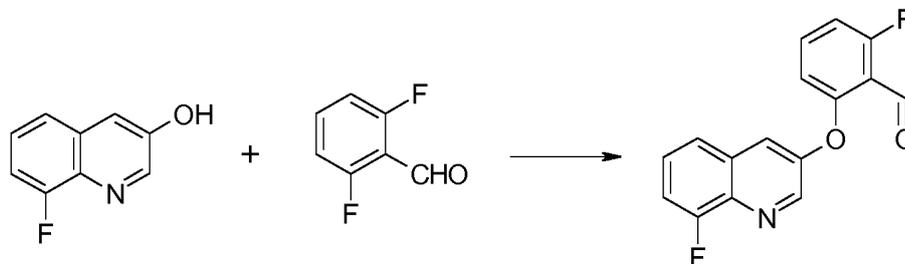


20 Después de que se añadieran 30 ml de acetonitrilo a 3,0 g de 8-fluoro-3-hidroxiquinolina, se añadieron 3,1 g de carbonato de potasio y 3,5 g de 2,6-difluoroacetofenona. Después de calentar la solución de reacción a reflujo durante 3 horas, la solución de reacción se filtró con CELITE. Después de que el filtrado se extrajera con acetato de etilo, la capa orgánica se concentró y se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 3,0 g de 2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)benzaldehído (número de compuesto 341).

Ejemplo 23

Síntesis de 1-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-fenil]-propano-1,2-diona

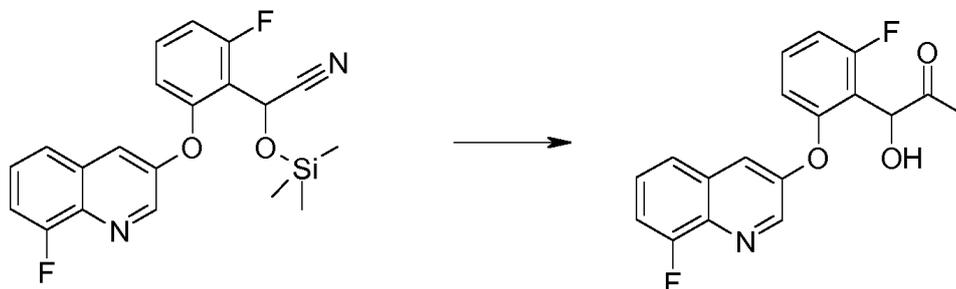
30 Etapa 1) Síntesis de [2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-fenil]-trimetilsiloxi-acetonitrilo



35 Después de que se disolvieran 3,2 g de 2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-benzaldehído en 70 ml de diclorometano y el producto resultante se enfriara a 0 °C, se añadieron 1,3 g de tetraisopropóxido de titanio. Después de que se calentara la solución de reacción a temperatura ambiente, se le añadieron 4,5 g de cianuro de trimetilsililo y la mezcla se agitó durante 2 horas. Se añadió ácido clorhídrico diluido a la solución de reacción y la solución se extrajo con diclorometano. La capa orgánica se concentró y se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 3,1 g de [2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-fenil]-trimetilsiloxi-acetonitrilo (pureza de aproximadamente

el 90 %).

Etapa 2) Síntesis de 1-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-fenil]-1-hidroxi-propan-2-ona



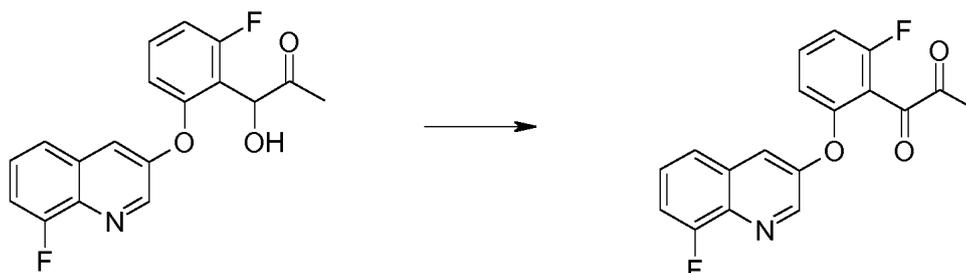
5

Se disolvieron 3,3 g de [2-fluoro-6-(8-fluoroquinolina-3-iloxi)-fenil]-trimetilsililoxi-acetonitrilo (pureza de aproximadamente el 90 %) en 50 ml de éter dietílico y se añadieron gota a gota a temperatura ambiente 5,7 ml de bromuro de metilmagnesio (solución en éter dietílico 3,0 M). Después de que la mezcla se agitara durante 1 hora a temperatura ambiente, el producto resultante se calentó a reflujo durante 3 horas y después se trató con ácido clorhídrico diluido. El resultado se sometió a extracción con acetato de etilo y después la capa orgánica se concentró para obtener 3,9 g de producto en bruto. Se añadieron 20 ml de ácido clorhídrico 2 N y 10 ml de tetrahidrofurano a 1,9 g del producto en bruto y la mezcla se agitó durante 4 horas a temperatura ambiente. La solución de reacción se extrajo con acetato de etilo y después se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,4 g de 1-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-fenil]-1-hidroxi-propan-2-ona.

10

15

Etapa 3) Síntesis de 1-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-fenil]-propano-1,2-diona



20

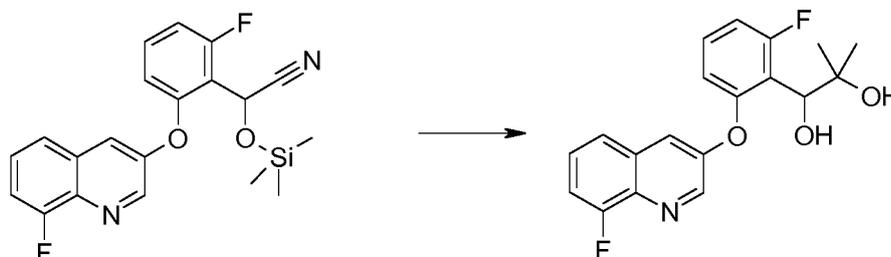
Después de que se disolvieran 0,14 g de 1-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-fenil]-1-hidroxi-propan-2-ona en 10 ml de diclorometano, se añadieron 0,91 g de reactivo de Dess-Martin a 0 °C. Después de 3 horas de agitación, la solución de reacción se concentró y se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,08 g de 1-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-fenil]-propano-1,2-diona (número de compuesto 396).

25

Ejemplo 24

Síntesis de 1-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-fenil]-2-hidroxi-2-metil-propan-1-ona

30 Etapa 1) Síntesis de 1-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-fenil]-2-hidroxi-2-metil-propano-1,2-diol



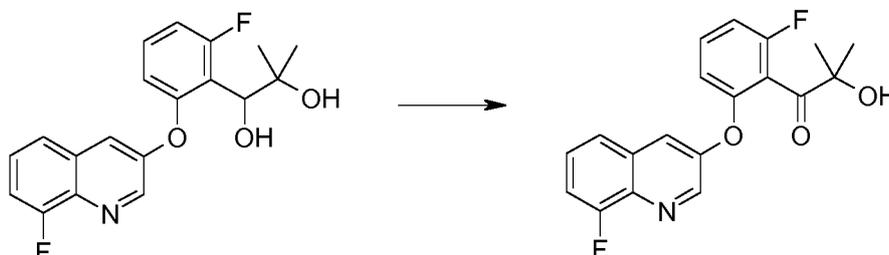
35

Se disolvieron 3,3 g de [2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-fenil]-trimetilsililoxi-acetonitrilo en 50 ml de éter dietílico y se añadieron gota a gota a temperatura ambiente 5,7 ml de bromuro de metilmagnesio (solución en éter dietílico 3,0 M). Después de agitar la mezcla durante 1 hora a temperatura ambiente, el producto resultante se calentó a reflujo durante 3 horas y después se trató con ácido clorhídrico diluido. El resultado se sometió a extracción con acetato de etilo y después la capa orgánica se concentró para obtener 3,9 g de producto en bruto. Se disolvieron 1,9 g del producto en bruto en 20 ml de tetrahidrofurano y se añadieron gota a gota a 0 °C 3,2 ml de bromuro de

metilmagnesio (solución en éter dietílico 3,0 M). Después de 3 horas de agitación a 0°C, se añadieron 20 ml de ácido clorhídrico 2 N y la mezcla se agitó durante un día a temperatura ambiente. La solución de reacción se extrajo con acetato de etilo y se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,25 g de 1-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-fenil]-2-metil-propano-1,2-diol como producto en bruto.

5

Etapa 2) Síntesis de 1-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-fenil]-2-hidroxi-2-metil-propan-1-ona

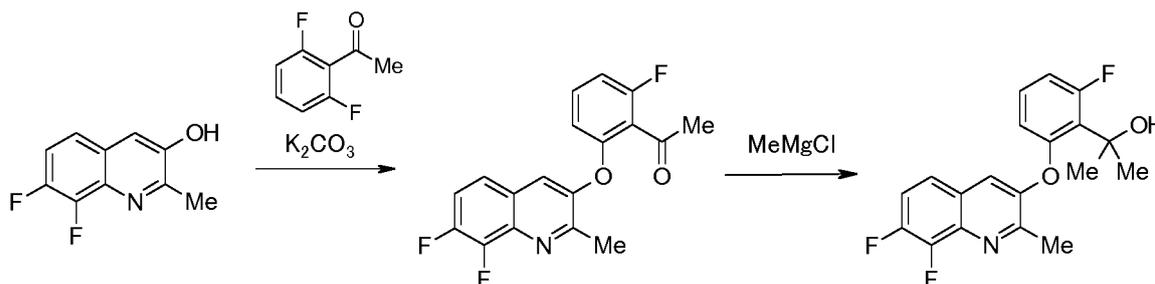


10 Se disolvieron 0,15 g de 1-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-fenil]-2-metil-propano-1,2-diol en 10 ml de diclorometano y se añadieron 0,20 g de reactivo de Dess-Martin a 0 °C. Después de 2 horas de agitación, la solución de reacción se concentró y se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,03 g de 1-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-fenil]-2-hidroxi-2-metil-propan-1-ona (número de compuesto 398).

Ejemplo 25

15

Síntesis de 2-[2-fluoro-6-(7,8-difluoro-2-metilquinolin-3-iloxi)fenil]propan-2-ol



20 Se disolvieron 26,3 g de 7,8-difluoro-3-hidroxi-2-metilquinolina en 200 ml de dimetilformamida. Se añadieron 27,2 g de 2,6-difluoroacetofenona y 24,0 g de carbonato de potasio a la solución y la mezcla se agitó durante 4 horas a 100 °C. Después de que la solución de reacción obtenida de este modo se vertiera en agua con hielo y se neutralizara con ácido clorhídrico diluido, el líquido se separó con acetato de etilo. La capa orgánica se concentró y se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 17,0 g de 1-[2-fluoro-6-(7,8-difluoro-2-metilquinolin-3-iloxi)-fenil]-etanona.

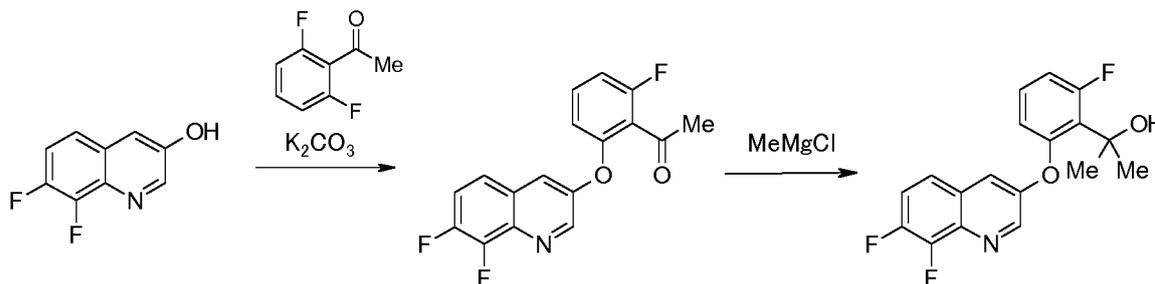
25

Después de que se disolvieran 11,0 g de 1-[2-fluoro-6-(7,8-difluoro-2-metilquinolin-3-iloxi)-fenil]-etanona obtenida, se disolvieron en 80 ml de tetrahidrofurano y se enfriaron a 0 °C, se añadieron 16,6 ml de cloruro de metilmagnesio gota a gota (solución en tetrahidrofurano 3,0 M). Después de que el producto resultante se calentara a temperatura ambiente y se agitara durante 2 horas, la solución de reacción se trató con ácido clorhídrico diluido y el líquido se separó con acetato de etilo. La capa orgánica se concentró y se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 10,0 g de 2-[2-fluoro-6-(7,8-difluoro-2-metilquinolin-3-iloxi)fenil]propan-2-ol. Se obtuvo (número de compuesto 125).

30

35 Ejemplo 26

Síntesis de 2-[2-fluoro-6-(7,8-difluoroquinolin-3-iloxi)fenil]propan-2-ol



Se disolvieron 0,5 g de 7,8-difluoro-3-hidroxiquinolina en 10 ml de dimetilformamida. Se añadieron a la solución 0,52 g de 2,6-difluoroacetofenona y 0,46 g de carbonato de potasio y la mezcla se agitó durante 2,5 horas a 100 °C. La solución de reacción obtenida de este modo se vertió en agua con hielo y después se neutralizó con ácido clorhídrico diluido, el líquido se separó con acetato de etilo. La capa orgánica se concentró y se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,38 g de 1-[2-fluoro-6-(7,8-difluoroquinolin-3-iloxi)-fenil]-etanona (número de compuesto 391).

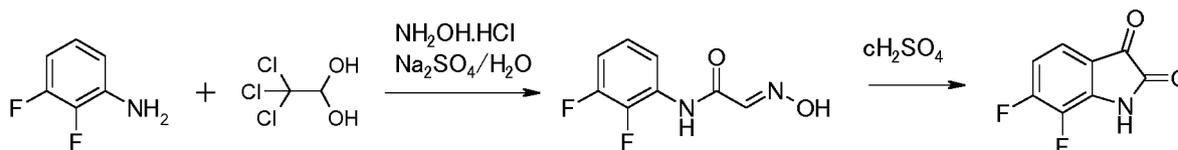
Después de que se disolvieran 0,38 g de la 1-[2-fluoro-6-(7,8-difluoroquinolin-3-iloxi)-fenil]-etanona obtenida en 5 ml de tetrahidrofurano y se enfriaran a 0 °C, se añadieron 1,4 ml de bromuro de metilmagnesio gota a gota (solución en éter dietílico 3,0 M). Después de que el producto resultante se calentara a temperatura ambiente y se agitara durante 2 horas, la solución de reacción se trató con ácido clorhídrico diluido y el líquido se separó con acetato de etilo. La capa orgánica se concentró y se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,33 g de 2-[2-fluoro-6-(7,8-difluoroquinolin-3-iloxi)fenil]propan-2-ol (número de compuesto 124).

En lo sucesivo en el presente documento, el producto intermedio de acuerdo con la presente invención se describe en más detalle con referencia a los ejemplos, sin embargo, el producto intermedio de acuerdo con la presente invención no está limitado en lo más mínimo por los siguientes ejemplos.

Ejemplo 27

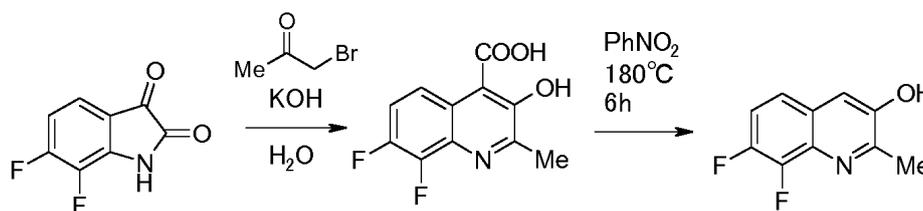
Síntesis de 7,8-difluoro-3-hidroxi-2-metilquinolina

Etapla 1) Síntesis de 6,7-difluoroisatina



Después de que se añadieran 15,7 g de 2,3-difluoroanilina a 825 ml de agua y después de que se añadieran 24,2 g de 1-hidrato de tricloroacetaldehído, 30,8 g de clorhidrato de hidroxilamina, 138,6 g de sulfato de sodio anhidro, la mezcla se agitó durante 10 horas a 50 °C. Después de que el producto resultante se enfriara a temperatura ambiente, se añadieron 44 ml de ácido clorhídrico 2 N y después la mezcla se agitó durante 30 minutos, seguido de la recogida del cristal por filtración. Después de que los cristales obtenidos de este modo se secaran y después se añadieran a ácido sulfúrico concentrado calentado a 70 °C, la mezcla se agitó durante 1 hora a 80-90°C. La solución de reacción se vertió en hielo, se sometió a extracción con acetato de etilo y después se lavó con solución salina saturada. Después de que se secara la capa orgánica con sulfato de magnesio, el disolvente se evaporó a presión reducida para obtener 26 g de un producto en bruto de 6,7-difluoroisatina.

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



Después de que se añadieran 41 g del producto en bruto de 6,7-difluoroisatina a 200 ml de agua, se añadieron 75,3 g de hidróxido de potasio (6 equivalentes) con enfriamiento con hielo y la mezcla se agitó durante 30 minutos. Se añadieron gota a gota 42 g de bromoacetofenona (1,4 equivalentes) a la suspensión mientras se mantenía la temperatura interna de la solución de reacción entre 20 y 25 °C y la mezcla se agitó adicionalmente durante la noche a temperatura ambiente. Después de neutralizar el producto resultante con ácido clorhídrico concentrado, los cristales precipitados se recogieron por filtración y se lavaron con una pequeña cantidad de agua. Los cristales obtenidos de este modo se secaron suficientemente y después se añadieron poco a poco a 100 ml de nitrobenzene calentado a 130 a 140 °C y la mezcla se agitó adicionalmente durante 1 hora a 150 °C. Después de que la solución de reacción se enfriara a temperatura ambiente, los cristales precipitados se lavaron con cloroformo para obtener 26,3 g de 7,8-difluoro-3-hidroxi-2-metilquinolina.

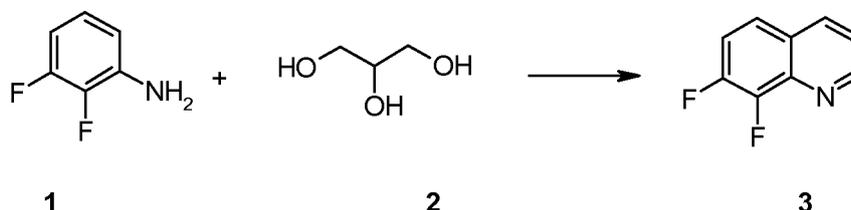
RMN ¹H (300 MHz, DMSO-d₆) δ 2,57 (s, 3H), 7,4 a 7,7 (m, 3H), 10,60 (sa, 1H).

El siguiente compuesto se produjo usando el mismo método. RMN ¹H de 8-fluoro-3-hidroxi-2-metilquinolina (300 MHz, DMSO-d₆) δ 2,56 (s, 3H), 7,2 a 7,6 (m, 4H), 10,53 (sa, 1H).

Ejemplo 28

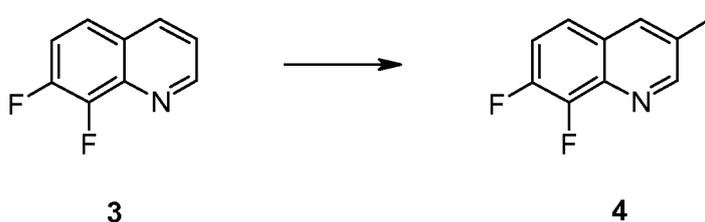
Síntesis de 7,8-difluoro-3-hidroxiquinolina

5 Etapa 1) Síntesis de 7,8-difluoroquinolina



10 En un matraz en forma de berenjena de 3 l que contenía una barra de agitación, se introdujo ácido sulfúrico al 80 % (607,7 g, 49,57 mol) y se enfrió a 0 °C y después se añadió lentamente 2,3-difluoroanilina (160,0 g, 1,24 mol). Después de la adición, la mezcla se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente, se añadió más yoduro de sodio (1,85 g, 12,3 mmol) y después la mezcla se calentó en un baño de aceite hasta que la temperatura del mismo alcanzó los 150 °C (temperatura del baño). Cuando alcanzó esta temperatura, se añadió glicerina (125,5 g, 1,36 mol) gota a gota durante un periodo de una hora y la mezcla se agitó durante 1 hora a 150 °C. La temperatura del baño se elevó adicionalmente a 180 °C y el agua se evaporó durante un periodo de 2 horas usando un aparato de destilación. Después de confirmar que el material de partida había desaparecido, la mezcla se neutralizó usando hidróxido de sodio acuoso 10 N mientras se enfriaba con un baño de agua con hielo (la temperatura interna es de 60 a 70 °C). Después de la neutralización, antes de que la temperatura interior volviera a la temperatura ambiente, el producto resultante se sometió a extracción con acetato de etilo y el extracto se secó con sulfato de magnesio, se filtró y se concentró. El producto en bruto obtenido de este modo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (hexano normal:acetato de etilo) para obtener 185,5 g de 7,8-difluoroquinolina (91 %) en forma de un sólido de color castaño.

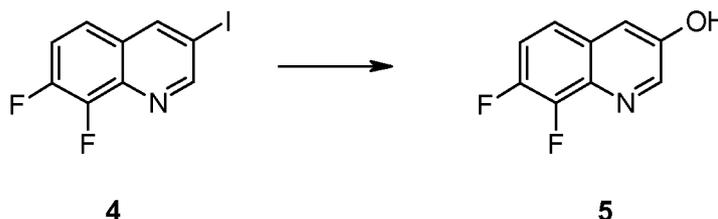
25 Etapa 2) Síntesis de 7,8-difluoro-3-yodoquinolina



30 En un matraz con forma de berenjena de 3 l que contenía una barra agitadora, se introdujeron 7,8-difluoroquinolina (185,5 g, 1,12 mol), N-yodosuccinimida (505,4 g, 2,25 mol) y ácido acético (927 ml) y la mezcla se agitó durante 30 horas a 90°C. Después de que se enfriaran, los cristales precipitados se filtraron y se secaron. Por otro lado, el filtrado se concentró a presión reducida, el ácido acético residual se neutralizó con hidrogenocarbonato de sodio y el producto resultante se sometió a extracción con acetato de etilo. Además, después de que el filtrado se secase con sulfato de magnesio, se filtrara y se concentrara, el producto en bruto obtenido de este modo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (hexano normal:acetato de etilo) para obtener 227,2 g (70 %) de 7,8-difluoro-3-yodoquinolina obtenido en forma de un sólido de color castaño combinado con los cristales obtenidos anteriormente.

¹H-RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 7,39-7,51 (m, 2H), 8,55 (m, 1H), 9,08 (d, 1H, J = 2,1 Hz).

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



45 En un matraz con forma de berenjena de 3 l que contenía una barra agitadora, se introdujeron 7,8-difluoro-3-yodoquinolina (227,2 g, 0,78 mol), dimetilsulfóxido (600 ml) y agua (600 ml) y se añadieron hidróxido de sodio (131,5 g, 2,34 mol), CuI (14,8 g, 0,078 mol) y 1,10-fenantrolina (28,1 g, 0,156 mol). La mezcla se calentó

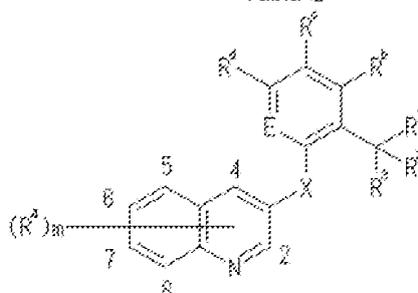
adicionalmente a 100°C en un baño de aceite y se agitó durante 24 horas. Después de que se enfriara, la capa orgánica se retiró añadiendo acetato de etilo y agua. La capa acuosa obtenida de este modo se neutralizó con ácido clorhídrico concentrado y después los cristales precipitados se filtraron y se secaron. Por otra parte, después de que el filtrado se extrajera con acetato de etilo, se secura con sulfato de magnesio, se filtra y se concentra, el producto en bruto obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (hexano normal:acetato de etilo) para obtener 133,7 g (95 %) de 7,8-difluoro-3-hidroxiquinolina en forma de un sólido de color castaño combinado con los cristales obtenidos anteriormente.

RMN-¹H (300 MHz, CD₃OD) δ 7,39-7,60 (m, 3H), 8,59 (d, 1H, J = 2,4 Hz).

- 10 El siguiente compuesto se produjo usando el mismo método. RMN-¹H de 8-fluoro-3-hidroxiquinolina (300 MHz, CDCl₃) δ 7,16 (m, 1H) δ 7,34-7,49 (m, 3H), 8,71 (d, 1H, J = 2,7 Hz), 9,90 (sa, 1H).

Los compuestos heterocíclicos que contienen nitrógeno obtenidos de los ejemplos anteriores se muestran en las Tablas 1 a 19. Además, se muestran compuestos sintetizados de la misma manera que cualquiera de los ejemplos anteriores en la Tabla 20 a la Tabla 28. Además, Et representa un grupo etilo, ⁿPr representa un grupo n-propilo, ⁱPr representa un grupo i-propilo, ^cPr representa un grupo ciclopropilo, ⁿBu representa un grupo n-butilo, ^tBu representa un grupo t-butilo, Ph representa un fenilo grupo, Bn representa un grupo bencilo y Tos representa un grupo tolueno sulfonilo. La RMN-¹H de los compuestos en cada tabla también se muestra en la Tabla 29 a la Tabla 41. Obsérvese que solo los números de compuesto 9, 13, 27-33, 36-38, 40-49, 62-130, 132, 135, 136, 138-281, 289-296, 321, 322, 425-429, 432, 433, 435-437, 439-453, a-1, a-2, a-5, a-7, a-8, a-10 a a-15, c-4, c-5, d-4 a d-40 son de acuerdo con la invención. Los otros números compuestos son compuestos de referencia.

Tabla 1



Compuesto N°	(R ¹) _m	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	E	-X-	Propiedad física
1	-	=O		-CH ₃	H	H	H	H	OH	-O-		75-76
2	-	=O		-H	H	H	H	H	OH	-O-		76-79
3	-	=O		-OEt	H	H	H	H	OH	-O-		amorfo
4	-	=O		-OEt	H	H	H	H	OF	-O-		72-74
5	-	=O		-OEt	H	H	F	H	OH	-O-		amorfo
6	-	=O		-OEt	H	F	H	H	OH	-O-		83-85
7	-	=O		-OEt	F	H	H	H	OH	-O-		amorfo
8	8-F	=O		-OEt	F	H	H	H	OH	-O-		amorfo
9	-	-F	-F	-F	H	H	H	H	OH	-O-		amorfo
10	8-F	=O		-CH ₃	F	H	H	H	OH	-O-		amorfo
11	-	=O		- ^t Bu	H	H	H	H	OH	-O-		amorfo
12	8-F	=O		- ^t Bu	F	H	H	H	OH	-O-		amorfo
13	-	-F	-F	-F	H	H	H	H	N	-O-		amorfo
14	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	H	OH	-O-		amorfo
15	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	H	OH	-O-		77-79
16	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	H	OH	-O-		80-84

Tabla 2

Compuesto N.º	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Propiedad física
17	-	-CH ₃	-CH ₃	-Et	H	H	H	OH	-O-	amorfo
18	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-Et	H	H	H	OH	-O-	amorfo
19	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ -		H	H	OH	-O-	104-106
20	-	=O		-NH ₂	Cl	H	H	OH	-O-	168-188
21	-	=O		-NH ₂	Br	H	H	OH	-O-	204-206
22	-	=O		-N(CH ₃) ₂	Br	H	H	OH	-O-	amorfo
23	-	=N-OH		-CH ₃	H	H	H	OH	-O-	125-126
24	-	=N-OCH ₃		-CH ₃	H	H	H	OH	-O-	amorfo
25	-	=N-O ⁱ Bu		-CH ₃	H	H	H	OH	-O-	amorfo
26	8-F	=N-OH		-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	171-173
27	-	-OCH ₃	-CH ₃	-OCH ₃	H	H	H	OH	-O-	amorfo
28	-	-OSi(CH ₃) ₃	-CH ₃	-CF ₃	H	H	H	OH	-O-	amorfo
29	-	-OH	-CH ₃	-CF ₃	H	H	H	OH	-O-	158-160
30	8-F	-OH	-CH ₃	- ⁱ Bu	F	H	H	OH	-O-	amorfo
31	-	-OH	-CH ₃	- ⁱ Bu	H	H	H	OH	-O-	amorfo
32	-	-OH	-CH ₃	-Et	H	H	H	OH	-O-	129-131
33	8-F	-OH	-CH ₃	-Et	H	H	H	OH	-O-	122-124
34	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ -		H	H	OH	-O-	amorfo
35	8-F	-OH	- ⁱ Bu	-CH ₂ -		H	H	OH	-O-	amorfo
36	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	amorfo
37	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	amorfo
38	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	OH	-O-	amorfo
39	2- ⁱ Bu	=O		-H	H	H	H	OH	-O-	amorfo
40	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	OF	-O-	amorfo
41	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	F	OH	-O-	amorfo
42	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	F	H	OH	-O-	amorfo

Tabla 3

Compuesto N.º	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Propiedad física
43	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	amorfo
44	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	OH	-O-	128-130
45	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	N	-O-	146-147
46	2-Et	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	OH	-O-	amorfo
47	2- ⁱ Bu	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	OH	-O-	amorfo
48	8-F	-OH	-CH ₃	-Et	F	H	H	OH	-O-	amorfo
49	8-Cl	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	amorfo
50	-	=O		-CH ₂ -		H	H	OH	-NH-	130-132
51	-	=O		-Ph	H	H	H	OH	-NH-	amorfo
52	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	OH	-CH ₂ -	108-111
53	8-F	=O		-OEt	F	H	H	OH	-CH ₃ -	amorfo
54	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	OH	-CH(OH)-	173-175
55	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ -OSi(CH ₃) ₂ - ⁱ Bu	H	H	H	OH	-CH(OH)-	140-143
56	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CH ₂ OH	H	H	H	OH	-CH(OH)-	136-138
57	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	OH	-OO-	182-183
58	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ -OSi(CH ₃) ₂ - ⁱ Bu	H	H	H	OH	-OO-	106-108
59	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ O-Tos	H	H	H	OH	-OO-	amorfo
60	2-Cl	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ -		H	H	OH	-O-	amorfo
61	1-Oxide, 8-F	-CH ₃	-CH ₃	-Et	H	H	H	OH	-O-	amorfo
62	-		≡N		H	H	H	OH	-O-	92-96
63	-		≡N		F	H	H	OH	-O-	148-151
64	-		≡N		Br	H	H	OH	-O-	167-169
65	-		≡N		Cl	H	H	OH	-O-	150-151
66	-		≡N		OMe	H	H	OH	-O-	120-122

Tabla 4

Compuesto N.º	$(R^4)_m$	R^1	R^2	R^3	R^5	R^6	R^d	E	-X-	Propiedad física
67	2-CH ₃	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	OH	-O-	amorfo
68	2-Pr	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	OH	-O-	amorfo
69	2-OCH ₃	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	OH	-O-	amorfo
70	2-OEt	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	OH	-O-	amorfo
71	1-Oxide	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	OH	-O-	154-155
72	-	-OH	-CH ₃	-OCH ₂ CH ₃	H	H	H	OH	-O-	amorfo
73	-	-OH	-CH ₃	-CO ₂ Et	H	H	H	OH	-O-	amorfo
74	8-F	-OH	-CH ₃	-Ph	F	H	H	OH	-O-	amorfo
75	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ Ph	F	H	H	OH	-O-	amorfo
76	8-F	-OH	-CH ₃	-CH=CH ₂	F	H	H	OH	-O-	amorfo
77	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ -CH=CH ₂	F	H	H	OH	-O-	amorfo
78	2-CH=CH ₂ 8-F	-OH	-CH ₃	-CH=CH ₂	F	H	H	OH	-O-	amorfo
79	2-CH ₂ OH=CH ₂ 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ -CH=CH ₂	F	H	H	OH	-O-	amorfo
80	8-F	-OH	-CH ₃	-Pr	F	H	H	OH	-O-	amorfo
81	8-F	-OH	-CH ₃	-OCH ₂ -CH ₂	F	H	H	OH	-O-	amorfo
82	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ -(4-FPh)	F	H	H	OH	-O-	amorfo
83	8-F	-OH	-CH ₃	-CH(CH ₃)-CH=CH ₂	F	H	H	OH	-O-	amorfo
84	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	OF	-O-	148-150
85	2-CH ₃ 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	OF	-O-	111-113
86	8-F	-OH	-CH ₃	- ² Pr	F	H	H	OH	-O-	amorfo
87	2- ² Pr 8-F	-OH	-CH ₃	- ² Pr	F	H	H	OH	-O-	amorfo
88	2-CH ₃ 8-F	-OH	-CH ₃	-Et	F	H	H	OH	-O-	amorfo
89	2-CH ₃ 8-F	-OH	-CH ₃	-CH=CH ₂	F	H	H	OH	-O-	amorfo
90	2-CH ₃ 8-F	-OH	-CH ₃	- ² Pr	F	H	H	OH	-O-	amorfo
91	2-CH ₃ 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ -(4-CH ₃ OPh)	F	H	H	OH	-O-	amorfo
92	2-CH ₃ 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ -(4-FPh)	F	H	H	OH	-O-	amorfo

Tabla 5

Compuesto N.º	$(R^4)_m$	R^1	R^2	R^3	R^5	R^6	R^d	E	-X-	Propiedad física
93	2-CH ₃ 8-Cl	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	96-98
94	2,8-(CH ₃) ₂	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	amorfo
95	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	120-123
96	8-F	-OH	-CH ₃	-Et	Cl	H	H	OH	-O-	39-42
97	2-CH ₃ 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	amorfo
98	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Br	H	H	OH	-O-	107-110
99	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	Cl	H	OH	-O-	124-126
100	2-CH ₃ 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Br	H	H	OH	-O-	93-94
101	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	CH ₃	H	OH	-O-	amorfo
102	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Cl	F	H	OH	-O-	135-137
103	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	amorfo
104	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	F	H	OH	-O-	122-124
105	2-CH ₃ 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	amorfo
106	2-CH ₃ 7-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	98-100
107	2-CH ₃	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	amorfo
108	2-CH ₃	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	amorfo
109	-	-OCH ₃	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	93-94
110	8-CH ₃ 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Cl	F	H	OH	-O-	138-140
111	-	-OH	-CH ₃	-CF ₃	F	H	H	OH	-O-	amorfo
112	-	-OH	-CF ₃	-CF ₃	H	H	H	OH	-O-	170-172
113	-	-OSi(CH ₃) ₃	-CF ₃	-CF ₃	F	H	H	OH	-O-	amorfo
114	-	-OH	-CF ₃	-CF ₃	F	H	H	OH	-O-	130-132
115	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Cl	F	H	OH	-O-	115-116
116	5,8-F ₂	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	154-155
117	2-CH ₃ 5,8-F ₂	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	124-126
118	2-CH ₃ 7-Cl	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	amorfo

Tabla 6

Compuesto N.º	(R ¹) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Propiedad física
119	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	F	H	OH	-O-	amorfo
120	5-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	80-92
121	2-CH ₃ , 5-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	95-97
122	8-F	-OH	-CF ₃	-CF ₃	F	H	H	OH	-O-	151-153
123	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	CH ₃	H	OH	-O-	118-120
124	78-F ₂	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	78-80
125	2-CH ₃ , 78-F ₂	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	106-110
126	7-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	amorfo
127	2-CH ₃ , 48-F ₂	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	130-132
128	2-CH ₃ , 7-F	-OH	-CH ₃	-Et	F	H	H	OH	-O-	130-132 T _m 15530
129	8-F	-OSi(CH ₃) ₃	-CH ₃	-CN	F	H	H	OH	-O-	
130	8-F	-OH	-CH ₃	-COCH ₃	F	H	H	OH	-O-	
131	-	-OCH ₃	-H	-O(CH ₂) ₂ -		H	H	OH	-O-	amorfo
132	-	-OCH ₃	-H	-CH ₃	H	H	H	OH	-O-	amorfo
133	-	-OEt	-H	-O(CH ₂) ₂ -		H	H	OH	-O-	amorfo
134	-	-O ⁱ Pr	-H	-O(CH ₂) ₂ -		H	H	OH	-O-	amorfo
135	-	-O ^t Bu	-H	-CH ₃	H	H	H	OH	-O-	amorfo
136	-	-OH	-H	- ⁱ Bu	H	H	H	OH	-O-	amorfo
137	-	-OH	-H	-O(CH ₂) ₂ -		H	H	OH	-O-	amorfo
138	8-F	-OH	-H	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	149-151
139	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	- ⁱ Bu	F	H	H	OH	-O-	104-106
140	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	amorfo
141	8-F	-OH	-H	-CH ₃	Cl	F	H	OH	-O-	139-141
142	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	F	H	OH	-O-	amorfo
143	8-F	-OH	-H	- ⁱ Pr	Cl	H	H	OH	-O-	amorfo
144	8-F	-OH	-H	-COCH ₃ -CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	103-104

Tabla 7

Compuesto N.º	(R ¹) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Propiedad física
145	8-F	-OH	-H	- ⁱ Bu	Cl	H	H	OH	-O-	amorfo
146	8-F	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	amorfo
147	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	amorfo
148	8-F	-OH	-H	-CH ₃	Br	H	H	OH	-O-	amorfo
149	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Br	H	H	OH	-O-	amorfo
150	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	CH ₃	H	H	OH	-O-	amorfo
151	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	112-114
152	2-CH ₃ , 8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	amorfo
153	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	CN	H	H	OH	-O-	amorfo
154	8-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Br	H	H	OH	-O-	amorfo
155	8-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-CH ₃	OCH ₃	H	H	OH	-O-	amorfo
156	8-F	-OCH ₂ CH=CH ₂	-H	-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	amorfo
157	8-F	-OH	-H	-Et	Cl	H	H	OH	-O-	amorfo
158	8-F	-OSi(CH ₃) ₃	-H	-CF ₃	Cl	H	H	OH	-O-	115-117
159	8-F	-OH	-H	-CF ₃	Cl	H	H	OH	-O-	174-176
160	8-F	-OCH ₂ Ph	-H	-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	amorfo
161	8-F	-OH	-H	-Ph	Cl	H	H	OH	-O-	amorfo
162	8-F	-OH	-H	-CH=CH ₂	Cl	H	H	OH	-O-	88-100
163	8-F	-OH	-H	- ⁱ Bu	Cl	H	H	OH	-O-	amorfo
164	8-F	-OH	-H	-O#CH	Cl	H	H	OH	-O-	amorfo
165	8-F	-OSi(CH ₃) ₃	-H	-CN	Cl	H	H	OH	-O-	amorfo
166	8-F	-OH	-H	-CH ₃	NO ₂	H	H	OH	-O-	112-114
167	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	NO ₂	H	H	OH	-O-	amorfo
168	8-F	-OCH ₃	-H	-CO ₂ CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	amorfo
169	8-F	-OH	-H	-CN	Cl	H	H	OH	-O-	174-175
170	8-F	-OSi(CH ₃) ₃	-H	-COCH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	amorfo

Tabla 8

Compuesto N°	(R ⁴) _n	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	E	-X-	Propiedad física
171	8-F	-OH	-H	-COOCH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
172	8-F	-OCH ₃	-H	-COOCH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
173	8-F	-OH	-H	-O(CH ₂) ₂ OH	Cl	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
174	8-F	-OH	-H	-CH ₂ Ph	Cl	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
175	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₂ Ph	Cl	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
176	8-F	-OH	-H	-CH ₃	Br	F	H	OH	-O-	-O-	148-150
177	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Br	F	H	OH	-O-	-O-	amorfo
178	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-CH ₃	Cl	F	H	OH	-O-	-O-	130-131
179	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-CH ₃	Br	F	H	OH	-O-	-O-	119-121
180	8-F	-OCH ₃	-H	-O(CH ₂) ₂ OH	Cl	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
181	8-F	-OH	-H	-CO ₂ CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
182	8-F	-OH	-H	-CH ₂ CN	Cl	H	H	OH	-O-	-O-	123-125
183	2-CH ₃ , 8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	F	H	OH	-O-	-O-	124-126
184	2-CH ₃ , 8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Br	F	H	OH	-O-	-O-	108-110
185	8-F	-OH	-H	-CH ₃	CF ₃	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
186	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	CF ₃	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
187	-	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	-O-	77-80
188	-	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
189	-	-OH	-H	-CH ₃	H	H	H	CF	-O-	-O-	amorfo
190	-	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CF	-O-	-O-	amorfo
191	-	-OH	-H	-CF ₃	H	H	H	OH	-O-	-O-	157-159
192	-	-OH	-H	-CH ₃	Cl	F	H	OH	-O-	-O-	133-135
193	-	-OH	-H	-CF ₃	F	H	H	OH	-O-	-O-	129-131
194	5,8-F ₂	-OH	-H	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	-O-	115-118
195	8-F	-OH	-H	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	-O-	114-115
196	8-F	-OH	-H	-CF ₃	F	H	H	OH	-O-	-O-	100-101

Tabla 9

Compuesto N°	(R ⁴) _n	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	E	-X-	Propiedad física
197	7,8-F ₂	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	-O-	99-102
198	7,8-F ₂	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
199	2-CH ₃ , 7,8-F ₂	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	-O-	135-136
200	2-CH ₃ , 7,8-F ₂	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	-O-	127-129
201	7-F	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	-O-	92-94
202	2-CH ₃ , 7-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	-O-	98-100
203	7-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
204	8-F	-OH	-H	-CON(OCH ₃) ₂	Cl	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
205	8-F	-OH	-H	-CH ₃	I	H	H	OH	-O-	-O-	116-118
206	2-CH ₃ , 4,8-F ₂	-OH	-H	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
207	8-F	-N(CH ₃) ₂	-H	-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	-O-	10 ³ , 58,96
208	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	I	H	H	OH	-O-	-O-	61-63
209	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
210	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	COOCH ₃	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
211	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	SCH ₃	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
212	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	SO ₂ CH ₃	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
213	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	OCF ₃	H	H	OH	-O-	-O-	
214	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	^o Pr	H	H	OH	-O-	-O-	
215	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Ph	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
216	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	N(CH ₃) ₂	H	H	OH	-O-	-O-	
217	8-F	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	F	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
218	8-F	-OEt	-H	-OEt	F	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
219	8-F	-OH	-H	-H	Cl	H	H	OH	-O-	-O-	141-143
220	8-F	-OCH ₃	-H	-H	Cl	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
221	8-F	-OCH ₂ CH ₂ CH ₃	-H	-H	Cl	H	H	OH	-O-	-O-	amorfo
222	8-F	-OH	-H	-H	Br	H	H	OH	-O-	-O-	142-144

Tabla 10

Compuesto N.º	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^a	R ^c	R ^d	E	-X-	Propiedad física
223	8-F	-OCH ₃	-H	-H	Br	H	H	OH	-O-	amorfo
224	8-F	-NH ⁺ Bu	-H	-H	Cl	H	H	OH	-O-	amorfo
225	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CH ₂ OH	H	H	H	OH	-O-	amorfo
226	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CH ₂ O-Tos	H	H	H	OH	-O-	amorfo
227	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ OH	H	H	H	OH	-O-	amorfo
228	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ OH	H	H	H	OH	-O-	106-108
229	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CHO	H	H	H	OH	-O-	121-123
230	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CH(OH) ₂ OH	H	H	H	OH	-O-	amorfo
231	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CH=CH-OH	H	H	H	OH	-O-	153-169
232	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CN	H	H	H	OH	-O-	amorfo
233	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -COOCH ₃	H	H	H	OH	-O-	107-109
234	-	-CH ₃	-CH ₃	-CHO	H	H	H	OH	-O-	amorfo
235	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CH ₂ OH	F	H	H	OH	-O-	amorfo
236	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CH ₂ OH	H	H	H	OH	-O-	130-131
237	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CH ₂ OH	F	H	H	OH	-O-	136-138
238	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CHO	H	H	H	OH	-O-	146-148
239	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CHO	F	H	H	OH	-O-	156-158
240	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -COOCH ₃	F	H	H	OH	-O-	147-148
241	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ OH	H	H	H	OH	-O-	amorfo
242	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ OH	H	H	H	OH	-O-	120-122
243	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ -O(CH ₂) ₂ OH	H	H	H	OH	-O-	amorfo
244	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OH	H	H	H	OH	-O-	amorfo
245	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CHO	H	H	H	OH	-O-	93-96
246	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	H	H	H	OH	-O-	amorfo
247	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CH(OCH ₃) ₂	H	H	H	OH	-O-	amorfo
248	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CH(OCH ₃) ₂	H	H	H	OH	-O-	amorfo

Tabla 11

Compuesto N.º	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^a	R ^c	R ^d	E	-X-	Propiedad física
249	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -OOH	H	H	H	OH	-O-	131-134
250	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -COOCH ₃	H	H	H	OH	-O-	123-125
251	2-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ OH	H	H	H	OH	-O-	amorfo
252	2-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OH	H	H	H	OH	-O-	amorfo
253	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH(OH)CH ₂ OH	H	H	H	OH	-O-	amorfo
254	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH(OH)Et	H	H	H	OH	-O-	amorfo
255	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH(OH)-O(CH ₂) ₂ -CH ₃	H	H	H	OH	-O-	amorfo
256	2-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CH(OH) ₂ OH	H	H	H	OH	-O-	amorfo
257	2-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -COOCH ₃	H	H	H	OH	-O-	amorfo
258	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OH	H	H	H	OH	-O-	amorfo
259	2-CH ₃ , 8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OH	H	H	H	OH	-O-	amorfo
260	-	-CH ₃	-CH ₃	-COOCH ₃	H	H	H	OH	-O-	amorfo
261	2-CH ₃ , 8-F	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ COOCH ₃	H	H	H	OH	-O-	amorfo
262	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-COOCH ₃	F	H	H	OH	-O-	amorfo
263	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ OH	F	H	H	OH	-O-	amorfo
264	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ OH	F	H	H	OH	-O-	133-141
265	-	-CH ₃	-CH ₃	-COOCH ₃	F	H	H	OH	-O-	amorfo
266	7-F	-CH ₃	-CH ₃	-COOCH ₃	F	H	H	OH	-O-	aceite viscoso
267	7,8-F ₂	-CH ₃	-CH ₃	-COOCH ₃	F	H	H	OH	-O-	aceite viscoso
268	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH(OH)CH ₂ OH	H	H	H	OH	-O-	aceite viscoso
269	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-COOCH ₃	H	H	H	OH	-O-	aceite viscoso
270	2-CH ₃ , 8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CN	H	H	H	OH	-O-	aceite viscoso
271	-	-CH ₃	-CH ₃	-CN	H	H	H	OH	-O-	amorfo
272	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CN	H	H	H	OH	-O-	126-128
273	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CONH ₂	H	H	H	OH	-O-	172-175
274	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CON(CH ₃) ₂	H	H	H	OH	-O-	164-166

Tabla 12

Compuesto N°	(R ¹) _m	R ¹	R ²	R ²	R ³	R ³	R ⁴	E	-X-	Propiedad física
275	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CO ₂ CH ₃	F	H	H	CH	-O-	175-177
276	-	-H	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	93-98
277	-	-H	-CH ₃	-Et	H	H	H	CH	-O-	amorfo
278	-	-H	-CH ₃	-Pr	H	H	H	CH	-O-	amorfo
279	-	-H	-CH ₃	- ⁿ Bu	H	H	H	CH	-O-	n _D ²⁰ 1.5215
280	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-COOCH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorfo
281	-	-H	-H	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	131-132
282	-	-H	-H	-H	H	H	H	CH	-O-	46-48
283	-	-H	-H	-H	F	H	H	CH	-O-	74-75
284	8-F	-H	-H	-H	F	H	H	CH	-O-	82-83
285	-	-CH(OH)-CH(OH)-				H	H	CH	-O-	106-108
286	-	-(CH ₂) ₄ -				H	H	CH	-O-	amorfo
287	-	-(CH ₂) ₅ -				H	H	CH	-O-	66-70
288	-	-CH(OH)-CH ₂ CH ₂ -				H	H	CH	-O-	67-68
289	-	-F	-F	-CO ₂ Et	F	H	H	CH	-O-	106-109
290	-	-F	-F	-CH ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	129-131
291	-	-F	-F	-C(CH ₂) ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	80-101
292	8-F	-F	-F	-CO ₂ Et	F	H	H	CH	-O-	n _D ²⁰ 1.5400
293	8-F	-F	-F	-C(CH ₂) ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	114-116
294	8-F	-F	-F	-COOCH ₃	F	H	H	CH	-O-	60-63
295	8-F	-F	-F	-COO(CH ₂) ₂ CH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorfo
296	2-CH ₃ , 8-F	-F	-F	-COOCH ₃	F	H	H	CH	-O-	104-108
297	8-F	-(CH ₂) ₂ -		-OCH ₂ Ph	F	H	H	CH	-O-	amorfo
298	8-F	-(CH ₂) ₂ -		-OH	F	H	H	CH	-O-	128-130
299	-	-(CH ₂) ₂ -		-OCH ₂ Ph	F	H	H	CH	-O-	81-93
300	-	-(CH ₂) ₂ -		-OH	F	H	H	CH	-O-	123-124

Tabla 13

Compuesto N°	(R ¹) _m	R ¹	R ²	R ²	R ³	R ³	R ⁴	E	-X-	Propiedad física
301	8-F	-(CH ₂) ₂ -		-CH	Cl	H	H	CH	-O-	
302	2-CH ₃ , 8-F	-(CH ₂) ₂ -		-CH	Cl	H	H	CH	-O-	
303	8-F	-(CH ₂) ₂ -		-OCH ₂ Ph	Cl	H	H	CH	-O-	
304	2-CH ₃ , 8-F	-(CH ₂) ₂ -		-OCH ₂ Ph	Cl	H	H	CH	-O-	
305	-	-CH ₃		-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	72-74
306	2-Cl	-CH ₃		-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	amorfo
307	2-OH	-CH ₃		-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	135-139
308	8-F	-O-CH ₂ -		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorfo
309	-	-(CH ₂) ₂ -		-C(CH ₂) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	86-88
310	8-F	-(CH ₂) ₂ -		-CN	F	H	H	CH	-O-	142-144
311	2-CH ₃ , 8-F	-(CH ₂) ₂ -		-CN	F	H	H	CH	-O-	132-134
312	8-F	-(CH ₂) ₂ -		-COOCH ₃	F	H	H	CH	-O-	
313	2-CH ₃ , 8-F	-(CH ₂) ₂ -		-COOCH ₃	F	H	H	CH	-O-	
314	2-CH ₃ , 8-F	=N-OH		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	168-170
315	8-F	=N-OH		-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	155-158
316	8-F	=N-OH		-CH ₃	Br	H	H	CH	-O-	145-147
317	8-F	=N-OH		-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	188-202
318	2-CH ₃ , 7-F	=N-OCH ₃		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	n _D ²⁰ 1.5712
319	2-CH ₃ , 7-F	=N-OEt		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	n _D ²⁰ 1.5623
320	-	=N-O ⁿ Bu		-H	F	H	H	CH	-O-	105-107
321	8-F	=N			F	H	H	CH	-O-	184-185
322	-	Ph			H	H	H	CH	-O-	85-86
323	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-CH ₂ -	148-149
324	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-CH ₂ -	114-116
325	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-CH ₂ -	158-161
326	-	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₂) ₂ -CH ₂ OH	H	H	H	CH	-CH ₂ -	115-117

Tabla 14

Compuesto N°	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Propiedad física
327	8-F	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-CH ₂ -	151-153
328	8-F	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	Cl	H	H	CH	-CH ₂ -	amorfo
329	8-F	=O		-OEt	H	H	H	CH	-CH ₂ -	amorfo
330	-	=O		-OEt	F	H	H	CH	-CH ₂ -	amorfo
331	7-F	=O		-OEt	F	H	H	CH	-CH ₂ -	aceite viscoso
332	8-F	=O		-H	Cl	H	H	CH	-CH ₂ -	111-112
333	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-CO-	192-193
334	-	-OH	-H	-CH ₂ CH ₃	H	H	H	CH	-CO-	amorfo
335	8-F	=O(CH ₃) ₂		-H	F	H	H	CH	-CO-	43-45
336	-	-OCH ₂ CH ₂ O-		-H	H	H	H	CH	-CO-	134-136
337	-	-CH ₃		-H	H	H	H	CH	-CO-	92-95
338	-	-CH ₃		-CH ₃	H	H	H	CH	-CO-	125-128
339	-	=O(CH ₃) ₂		-H	H	H	H	CH	-CO-	amorfo
340	-		-CH=CH-CH=CH-			H	H	CH	-CO-	aceite viscoso
341	8-F	=O		-H	F	H	H	CH	-CO-	173-181
342	-	=O		-H	H	H	H	CH	-CO-	120-122
343	-	=O		-CH=CH ₂	H	H	H	CH	-CO-	amorfo
344	8-F	-H	-H	-O(CH ₂) ₂ CH ₃	H	H	H	CH	-CO-	amorfo
345	-	-H	-H	-CH ₂ N ₃	H	H	H	CH	-CO-	amorfo
346	-	-H	-H	-Ph	Cl	H	H	CH	-CO-	115-117
347	-	-H	-H	-O(CH ₂) ₂ CH ₃	F	H	H	CH	-CO-	amorfo
348	8-F	-H	-H	-O(CH ₂) ₂ CH ₃	F	H	H	CH	-CO-	88-92
349	8-F	-OCH ₂ CH ₂ O-		-H	F	H	H	CH	-CHKOH-	153-161
350	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-CHKOH-	amorfo
351	-	-OH ₂		-H	H	H	H	CH	-H	amorfo
352	-	=O		-CO ₂ Et	H	H	H	CH	-O-	amorfo

Tabla 15

Compuesto N°	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Propiedad física
353	8-F	=O		-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorfo
354	8-F	=O		-CH ₃	Br	H	H	CH	-O-	146-148
355	8-F	=O		-CH ₃	Br	H	H	CH	-O-	amorfo
356	8-F	=O		-CH ₃	F	H	H	CF	-O-	103-104
357	8-F	=O		*3	F	H	H	CH	-O-	amorfo
358	2-CH ₃ , 8-F	=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	96-100
359	2-CH ₃ , 8-F	=O		-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorfo
360	2-CH ₃ , 8-F	=O		-CH ₃	Br	H	H	CH	-O-	amorfo
361	8-F	=O		-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	amorfo
362	2,4-(CH ₃) ₂ , 8-F	=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	164-65
363	8-F	=O		-Pr	Cl	H	H	CH	-O-	amorfo
364	8-F	=O		-O(CH ₂) ₂ CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorfo
365	8-F	=O		-tBu	Cl	H	H	CH	-O-	amorfo
366	2-CH ₃ , 8-Cl	=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	100-102
367	2,8-(CH ₃) ₂	=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorfo
368	8-F	=O		-Ph	Cl	H	H	CH	-O-	amorfo
369	8-F	=O		-CH=CH ₂	Cl	H	H	CH	-O-	77-79
370	8-F	=O		-C≡CH	Cl	H	H	CH	-O-	121-123
371	8-F	=O		-tBu	Cl	H	H	CH	-O-	amorfo
372	8-F	=O		-CH ₂ Cl	F	H	H	CH	-O-	113-116
373	8-F	=O		-CHCl ₂	F	H	H	CH	-O-	amorfo
374	8-F	=O		-CO ₂	F	H	H	CH	-O-	amorfo
375	8-F	=O		-COCH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorfo
376	8-F	=O		-O(CH ₂) ₂ OH	Cl	H	H	CH	-O-	amorfo
377	8-F	=O		-Pr	Cl	H	H	CH	-O-	amorfo
378	8-F	=O		-CH ₃	Br	F	H	CH	-O-	132-135

Tabla 16

Compuesto N.º	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Propiedad física
379	2-CH ₃ , 8-F	=O		-CH ₃	Cl	F	H	OH	-O-	126-128
380	2-CH ₃ , 8-F	=O		-CH ₃	Br	F	H	OH	-O-	126-128
381	-	=O		-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	38-40
382	2-CH ₃ , 6-F	=O		-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	amorfo
383	2-CH ₃ , 7-F	=O		-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	amorfo
384	8-F	=O		-CH ₂ -COCH ₃	F	H	H	OH	-O-	amorfo
385	-	=O		-CF ₃	F	H	H	OH	-O-	100-104
386	-	=O		-CH ₃	Cl	F	H	OH	-O-	112-124
387	5,8-F ₂	=O		-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	46-48
388	5-F	=O		-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	amorfo
389	2-CH ₃ , 7-Cl	=O		-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	amorfo
390	8-F	=O		-CF ₃	F	H	H	OH	-O-	amorfo
391	7,8-F ₂	=O		-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	126-130
392	7,8-F ₂	=O		-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	105-107
393	2-CH ₃ , 8-F	=O		-COCH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	113-114
394	7-F	=O		-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	97-99
395	3-CH ₃ , 8-F	=O		-COCH ₃	F	H	H	OH	-O-	169-170
396	8-F	=O		-COCH ₃	F	H	H	OH	-O-	96-98
397	2-CH ₃ , 8-F	=O		-O(CH ₂) ₂ OH	F	H	H	OH	-O-	amorfo
398	8-F	=O		-O(CH ₂) ₂ OH	F	H	H	OH	-O-	amorfo
399	8-F	=O		-O(CH ₂) ₂ OH)-CH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	118-119
400	2-CH ₃ , 4,8-F ₂	=O		-CH ₃	F	H	H	OH	-O-	155-156
401	-	=O		-NHPh	H	H	H	OH	-O-	amorfo
402	-	=O		-COCH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	amorfo
403	-	=O		-OCH ₃	Br	H	H	OH	-O-	amorfo
404	8-F	=O		-OEt	H	Cl	H	OH	-O-	88-90

Tabla 17

Compuesto N.º	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Propiedad física
405	8-F	=O		-OEt	H	CH ₃	H	OH	-O-	88-90
406	8-F	=O		-OCH ₃	Cl	H	H	OH	-O-	n _D ²⁰ 1,6008
407	8-F	=O		-CPr	Cl	H	H	OH	-O-	n _D ²⁰ 1,5809
408	8-F	=O		-O-CH ₂ Ph	Cl	H	H	OH	-O-	114-116
409	8-F	=O		-OEt	F	CH ₃	H	OH	-O-	amorfo
410	8-F	=O		-OEt	Cl	H	H	OH	-O-	amorfo
411	8-F	=O		-O-C(CH ₃) ₂ -CO ₂ Et	Cl	H	H	OH	-O-	n _D ²² 1,5411
412	8-F	=O		-H	Cl	F	H	OH	-O-	153-155
413	8-F	=O		-H	Cl	H	H	OH	-O-	133-135
414	8-F	=O		-H	Br	H	H	OH	-O-	111-114
415	8-F	=O		-H	Bn	H	H	OH	-O-	92-94
416	8-F	=O		-H	NO ₂	H	H	OH	-O-	106-109
417	8-F	=O		-H	Br	F	H	OH	-O-	140-142
418	8-F	=O		-H	OF ₂	H	H	OH	-O-	125-127
419	-	=O		-H	Cl	H	H	OH	-O-	82-85
420	-	=O		-H	Cl	F	H	OH	-O-	136-138
421	5,8-F ₂	=O		-H	F	H	H	OH	-O-	116-121
422	5-F	=O		-H	F	H	H	OH	-O-	80-84
423	7,8-F ₂	=O		-H	Cl	H	H	OH	-O-	142-144
424	7-F	=O		-H	Cl	H	H	OH	-O-	122-123
425	2-CH ₃ , 8-F	-F	-F	-O(CH ₂) ₂ OH	F	H	H	OH	-O-	110-112
426	2-CH ₃ , 8-F	-F	-F	-CH(CH ₃)OH	F	H	H	OH	-O-	163-165
427	3-CH ₃ , 8-F	-F	-F	-CH(CH ₃)OCH ₃	F	H	H	OH	-O-	amorfo
428	2-CH ₃ , 8-F	-F	-F	-O(CH ₂) ₂ OH	F	H	H	OH	-O-	amorfo
429	2-CH ₃ , 8-F	-F	-F	-CH(CH ₃)OCH ₂ CO ₂ H	F	H	H	OH	-O-	141-143
430	8-F	-CH ₂ -		-CO ₂ Et	F	H	H	OH	-O-	amorfo

Tabla 18

Compuesto N.º	(R ¹) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Propiedad física
431	8-F	-CH ₂	-CH ₂	-O(CH ₂) ₂ CH	F	H	H	CH	-O-	amorfo
432	8-F	-CH ₂	-CH ₂	-CN	F	H	H	CH	-O-	110-112
433	8-F	-NHCO ₂ ^t Bu	-CH ₂	-CH ₂	F	H	H	CH	-O-	127-129
434	8-F	-CH ₂	-CH ₂	-NHCO ₂ ^t Bu	F	H	H	CH	-O-	132-134
435	8-F	-NH ₂	-CH ₂	-CH ₂	F	H	H	CH	-O-	amorfo
436	8-F	-NHCOCH ₃	-CH ₂	-CH ₂	F	H	H	CH	-O-	144-146
437	8-F	-NHCOCF ₃	-CH ₂	-CH ₂	F	H	H	CH	-O-	amorfo
438	-	-OCH ₂ CH ₂ O-	-H	-H	H	H	H	CH	-CH(OH)-	80-83
439	2-CH ₃ , 7,8-F ₂	-OCH ₃	-CH ₂	-CH ₂	F	H	H	CH	-O-	97-98
440	2-CH ₃ , 8-F	-OCH ₃	-CH ₂	-CH ₂	F	H	H	CH	-O-	94-95
441	2-CH ₃ , 7-F	-OCH ₃	-CH ₂	-CH ₂	F	H	H	CH	-O-	104-106
442	8-F	-N(CH ₂) ₂	-H	-CN	Cl	H	H	CH	-O-	amorfo
443	8-F	-NHCOCH ₃	-H	-CN	Cl	H	H	CH	-O-	amorfo
444	8-F	-N(Bn)COCH ₃	-CH ₂	-CH ₂	F	H	H	CH	-O-	195-197
445	8-F	Pirrolidin-1-il	-H	-CH ₂	F	H	H	CH	-O-	102, 203, 5580
446	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₂	NHCO ₂ ^t Bu	H	H	CH	-O-	amorfo
447	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₂	NH ₂	H	H	CH	-O-	amorfo
448	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₂	NCH ₃	H	H	CH	-O-	amorfo
449	2-CH ₃ , 8-F	-CH ₂	-CH ₂	-SO ₂ CH ₃	F	H	H	CH	-O-	138-141
450	7,8-F ₂	-CH ₂	-CH ₂	-SO ₂ CH ₃	F	H	H	CH	-O-	157-160
451	2-CH ₃ , 7,8-F ₂	-CH ₂	-CH ₂	-SO ₂ CH ₃	F	H	H	CH	-O-	172-175

Tabla 19

Compuesto N.º	(R ¹) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Propiedad física
452	8-F	-CH ₂	-CH ₂	-SO ₂ Et	F	H	H	CH	-O-	150-152
453	8-F	-CH ₂	-H	-SO ₂ CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorfo

*1: "-O(N-CH₂CH₂CH₂)-"
 *2: "3-Fluoro-quinolin-3-iloil"

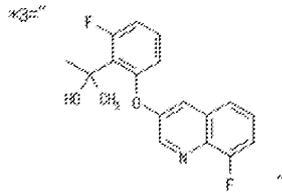
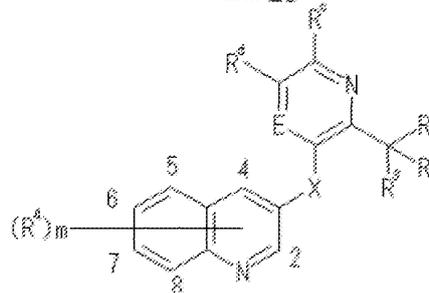
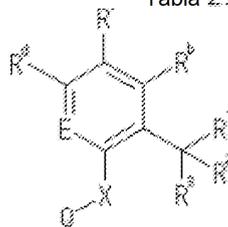


Tabla 20



Compuesto N.º	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	E	-X-	Propiedad física
a-1	-		≡N		H	H	CH	-O-	148-150
a-2	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	CH	-O-	amorfo
a-3	8-F		=O	-H	H	H	CH	-O-	138-140
a-4	2-Bu, 8-F		=O	-H	H	H	CH	-O-	150-151
a-5	8-F	-OH	-CH ₃	-Bu	H	H	CH	-O-	110-112
a-6	8-F		=O	-Bu	H	H	CH	-O-	90-91
a-7	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	CH	-O-	amorfo
a-8	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	CH	-O-	amorfo
a-9	2-CH ₃ , 8-F		=O	-CH ₃	H	H	CH	-O-	133-134
a-10	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-Bu	H	H	CH	-O-	133-136
a-11	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CN	H	H	CH	-O-	
a-12	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CO ₂ Et	H	H	CH	-O-	
a-13	8-F	-F	-F	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	CH	-O-	
a-14	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	CH	-O-	
a-15	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-COCH ₃	H	H	CH	-O-	

Tabla 21



Compuesto N.º	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	E	-X-	Propiedad física
b-1		-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	aceite viscoso
b-2		-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	133-135
b-3		-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	aceite viscoso
b-4		-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	aceite viscoso
b-5		-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	aceite viscoso
b-6			=O	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	aceite viscoso

Tabla 22

Compuesto N.º	Q	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Propiedad física
5-7		-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	aceite viscoso
5-8		-OH	-CH ₃	- ⁱ Bu	F	H	H	CH	-O-	aceite viscoso
5-9		-OH	H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	aceite viscoso
5-10		-OCH ₃	H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	aceite viscoso
5-11		=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	aceite viscoso
5-12		-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	aceite viscoso
5-13		-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ CH	H	H	H	CH	-O-	aceite viscoso
5-14		-OH	H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	aceite viscoso

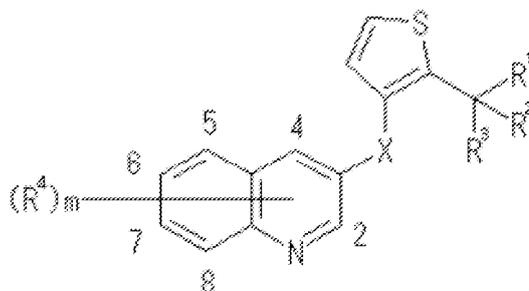
Tabla 23

Compuesto N.º	Q	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Propiedad física
5-15		-OCH ₃	H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	aceite viscoso
5-16		-OH	-CH ₃	- ⁱ Bu	F	H	H	CH	-O-	amorfo
5-17		=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	78-80
5-18		-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	101-102
5-19		=OCH ₂		H	F	H	H	CH	-O-	aceite viscoso
5-20		=OCH ₂		H	F	H	H	CH	-O-	amorfo
5-21		=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	aceite viscoso
5-22		-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	aceite viscoso

Tabla 24

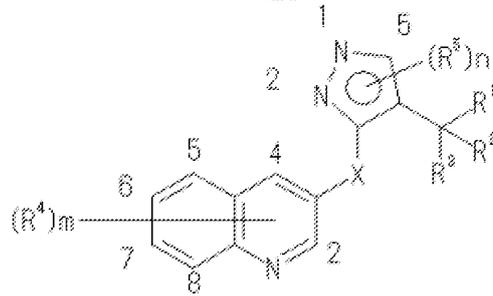
Compuesto N.º	O	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	Propiedad física
b-23		=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	aceite viscoso
b-24		-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	87-88
b-25		-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	
b-26		-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	

Tabla 25



Compuesto N.º	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	-X-	Propiedad física
c-1	8-F	=O		-OCH ₃	-O-	
c-2	8-F	=O		H	-O-	135-137
c-3	8-F	=O		-CH ₃	-O-	138-139
c-4	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	-O-	129-131
c-5	8-F	-OH	H	-CH ₃	-O-	96-98

Tabla 26



Compuesto N.º	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	(R ⁵) _n	X	Propiedad física
d-1	8-F		H	-OCH ₃	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-2	8-F		H	-H	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-3	8-F		H	-CH ₃	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-4	8-F	-OH	-H	-CH ₃	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	160-162
d-5	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	n _D ²⁰ 1.5056
d-6	8-F	-OH	-H	-Pr	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-7	8-F	-OH	-H	-iPr	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-8	8-F	-OH	-H	-CF ₃	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-9	8-F	-OH	-H	-O(CH ₂) ₂ OH	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-10	8-F	-OH	-H	-O(CH ₂) ₂ -COOCH ₃	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-11	8-F	-OH	-H	-O(CH ₂) ₂ -CO ₂ CH ₃	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	

Tabla 27

Compuesto N.º	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	(R ⁵) _n	X	Propiedad física
d-12	8-F	-OH	-H	-CH ₂ Ph	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-13	8-F	-OH	-H	-CH=CH ₂	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-14	8-F	-OH	-H	-C≡CH	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-15	8-F	-OH	-H	-COOCH ₃	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-16	2-CH ₃ 8-F	-OH	-H	-CH ₃	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-17	2-CH ₃ 8-F	-OH	-H	-Pr	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-18	2-CH ₃ 8-F	-OH	-H	-iPr	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-19	2-CH ₃ 8-F	-OH	-H	-CF ₃	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-20	2-CH ₃ 8-F	-OH	-H	-O(CH ₂) ₂ OH	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-21	2-CH ₃ 8-F	-OH	-H	-CH=CH ₂	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-22	2-CH ₃ 8-F	-OH	-H	-C≡CH	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-23	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	2-CH ₃ 5-Cl	-O-	
d-24	8-F	-OH	-CH ₃	-Pr	2-CH ₃ 5-Cl	-O-	
d-25	8-F	-OH	-CH ₃	-iPr	2-CH ₃ 5-Cl	-O-	
d-26	8-F	-OH	-CH ₃	-CF ₃	2-CH ₃ 5-Cl	-O-	
d-27	8-F	-OH	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ OH	2-CH ₃ 5-Cl	-O-	
d-28	8-F	-OH	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -COOCH ₃	2-CH ₃ 5-Cl	-O-	
d-29	8-F	-OH	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CO ₂ CH ₃	2-CH ₃ 5-Cl	-O-	
d-30	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ Ph	2-CH ₃ 5-Cl	-O-	
d-31	8-F	-OH	-CH ₃	-CH=CH ₂	2-CH ₃ 5-Cl	-O-	
d-32	8-F	-OH	-CH ₃	-C≡CH	2-CH ₃ 5-Cl	-O-	
d-33	8-F	-OH	-CH ₃	-COOCH ₃	2-CH ₃ 5-Cl	-O-	
d-34	2-CH ₃ 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	2-CH ₃ 5-Cl	-O-	
d-35	2-CH ₃ 8-F	-OH	-CH ₃	-Pr	2-CH ₃ 5-Cl	-O-	

Tabla 28

Compuesto N.º	(R ¹) _m	R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	-X-	Propiedad física
d-36	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-Pr	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-37	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CF ₃	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-38	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-OCH ₂ OH	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-39	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH=CH ₂	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-40	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-C≡CH	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	

Tabla 29

Compuesto N.º	RMN- ¹ H
3	1,16 (t, 3H), 4,23 (c, 2H), 7,13 (d, 1H), 7,29-7,64 (m, 6H), 8,02 (m, 1H), 8,08 (d, 1H), 8,83 (d, 1H).
5	1,19 (t, 3H), 4,24 (c, 2H), 6,80 (m, 1H), 7,01 (m, 1H), 7,43 (d, 1H), 7,50-7,71 (m, 3H), 8,04-8,16 (m, 2H), 8,83 (a, 1H).
7	1,22 (t, 3H), 4,31 (c, 2H), 6,79 (d, 1H), 6,99 (t, 1H), 7,38 (m, 1H), 7,51-7,72 (m, 4H), 8,11 (d, 1H), 8,81 (d, 1H).
8	1,20 (t, 3H), 4,32 (c, 2H), 6,85 (d, 1H), 7,03 (t, 1H), 7,30-7,54 (m, 5H), 8,85 (d, 1H).
9	7,03 (d, 1H), 7,27 (d, 1H), 7,30-7,77 (m, 6H), 8,12 (d, 1H), 8,81 (d, 1H).
10	2,61 (s, 3H), 6,79 (m, 1H), 7,01 (t, 1H), 7,31-7,43 (m, 2H), 7,47-7,50 (m, 2H), 7,58 (m, 1H), 8,83 (d, 1H).
11	1,28 (s, 9H), 6,97 (d, 1H), 7,17-7,26 (m, 2H), 7,26 (m, 1H), 7,52 (t, 1H), 7,56 (d, 1H), 7,63 (m, 1H), 7,69 (d, 1H), 8,09 (d, 1H), 8,77 (d, 1H).
12	1,28 (s, 9H), 6,76 (d, 1H), 6,98 (t, 1H), 7,27-7,50 (m, 4H), 7,59 (m, 1H), 8,87 (d, 1H).
13	7,13 (m, 1H), 7,54 (m, 1H), 7,69 (m, 1H), 7,79 (m, 1H), 7,96-3,04 (m, 2H), 3,14 (d, 1H), 8,25 (a, 1H), 8,33 (d, 1H).
14	1,35 (d, 9H), 6,82 (d, 1H), 7,03-7,14 (m, 2H), 7,38-7,56 (m, 5H), 8,02 (d, 1H), 8,73 (s, 1H).
17	0,71 (t, 3H), 1,39 (s, 6H), 1,84 (c, 2H), 6,90 (m, 1H), 7,12-7,23 (m, 2H), 7,41 (d, 1H), 7,43-7,68 (m, 4H), 8,10 (d, 1H), 8,80 (a, 1H).
18	0,66 (t, 3H), 1,37 (s, 6H), 1,85 (c, 2H), 6,64 (d, 1H), 6,84-6,93 (m, 2H), 7,07 (m, 1H), 7,15-7,26 (m, 2H), 7,41-7,47 (m, 2H), 8,82 (d, 1H).
22	2,98 (s, 3H), 3,12 (s, 3H), 6,88 (d, 1H), 7,20 (t, 1H), 7,41 (d, 1H), 7,54 (t, 1H), 7,63-7,73 (m, 3H), 8,10 (d, 1H), 8,79 (d, 1H).
24	2,19 (s, 3H), 3,89 (s, 3H), 7,08 (d, 1H), 7,26 (m, 1H), 7,36-7,43 (m, 2H), 7,48-7,55 (m, 2H), 7,59-7,67 (m, 2H), 8,09 (d, 1H), 8,81 (d, 1H).
25	1,18 (s, 9H), 2,18 (s, 3H), 7,05 (d, 1H), 7,26 (m, 1H), 7,35-7,64 (m, 6H), 8,08 (d, 1H), 8,80 (d, 1H).
27	1,73 (s, 3H), 3,17 (s, 6H), 6,98 (d, 1H), 7,19 (t, 1H), 7,29 (m, 1H), 7,48-7,68 (m, 4H), 7,82 (dd, 1H), 8,08 (d, 1H), 8,79 (d, 1H).
28	0,20 (s, 9H), 1,76 (d, 1H), 4,57 (a, 1H), 6,62 (d, 1H), 6,92 (m, 1H), 7,15 (m, 1H), 7,33 (m, 1H), 7,33 (m, 1H), 7,46-7,51 (m, 2H), 7,70 (s, 1H), 8,83 (a, 1H).
30	1,06 (s, 9H), 1,76 (d, 1H), 4,57 (a, 1H), 6,62 (d, 1H), 6,92 (m, 1H), 7,15 (m, 1H), 7,33 (m, 1H), 7,46-7,51 (m, 2H), 7,70 (s, 1H), 8,83 (a, 1H).
31	1,03 (s, 9H), 1,60 (s, 1H), 1,68 (s, 3H), 6,86 (m, 1H), 7,13-7,24 (m, 2H), 7,51-7,71 (m, 5H), 8,11 (d, 1H), 8,79 (d, 1H).
34	1,70 (s, 3H), 2,22-2,37 (m, 2H), 2,43 (a, 1H), 2,91 (m, 1H), 3,08 (m, 1H), 6,72 (d, 1H), 7,07 (d, 1H), 7,24 (t, 1H), 7,32 (m, 1H), 7,45-7,49 (m, 2H), 7,59 (m, 1H), 8,88 (d, 1H).
35	1,07 (s, 9H), 2,13 (m, 1H), 2,65 (m, 1H), 2,93-2,99 (m, 3H), 6,69 (d, 1H), 7,03 (d, 1H), 7,19 (t, 1H), 7,33 (m, 1H), 7,45-7,52 (m, 2H), 7,67 (m, 1H), 8,85 (d, 1H).

Tabla 30

Compuesto N.º	RMN- ¹ H
36	1,75 (d, 6H), 3,79 (d, 1H), 6,69 (m, 1H), 6,958 (m, 1H), 7,20 (m, 1H), 7,35 (m, 1H), 7,45-7,51 (m, 2H), 7,59 (d, 1H), 8,83 (d, 1H).
37	1,76 (d, 6H), 2,80 (s, 3H), 3,87 (a, 1H), 6,58 (d, 1H), 6,93 (m, 1H), 7,19 (m, 1H), 7,29-7,45 (m, 4H).
38	1,70 (s, 6H), 3,01 (a, 1H), 6,87 (d, 1H), 7,15-7,25 (m, 2H), 7,54 (t, 1H), 7,60-7,71 (m, 4H), 8,12 (d, 1H), 3,81 (d, 1H).
39	1,28 (s, 9H), 7,03 (s, 1H), 7,36 (d, 1H), 7,52-7,72 (m, 4H), 7,95 (d, 1H), 8,13 (d, 1H), 8,87 (d, 1H), 10,42 (s, 1H).
40	1,64 (s, 6H), 2,53 (s, 1H), 7,12 (m, 1H), 7,21-7,32 (m, 2H), 7,50-7,67 (m, 4H), 8,11 (d, 1H), 8,85 (d, 1H).
41	1,70 (s, 6H), 2,77 (s, 1H), 6,56 (m, 1H), 6,86 (m, 1H), 7,54-7,75 (m, 5H), 8,13 (d, 1H), 8,80 (d, 1H).
42	1,68 (s, 6H), 2,88 (s, 1H), 6,84-6,97 (m, 2H), 7,44 (m, 1H), 7,52-7,57 (m, 2H), 7,62-7,71 (m, 2H), 8,12 (d, 1H), 8,79 (d, 1H).

ES 2 691 726 T3

Compuesto N.º	RMN-1H
43	1,77 (d, 6H), 4,00 (d, 1H), 6,66 (m, 1H), 6,90 (m, 1H), 3,18 (m, 1H), 3,53-7,73 (m, 4H), 8,12 (d, 1H), 8,79 (d, 1H).
46	1,43 (t, 3H), 1,72 (s, 6H), 2,95 (s, 1H), 3,14 (c, 2H), 6,80 (d, 1H), 7,16-7,25 (m, 2H), 7,43-7,48(m, 2H), 7,60-7,67 (m, 3H), 8,07 (d, 1H).
47	0,94 (t, 3H), 1,16 (m, 2H), 1,72 (s, 6H), 1,87 (m, 2H), 2,92 (s, 1H), 3,10 (t, 2H), 6,81 (d, 1H), 7,14-7,23 (m, 2H), 7,43-7,48 (m, 2H), 7,59-7,67 (m, 3H), 8,07 (d, 1H).
48	0,93 (t, 3H), 1,72 (d, 3H), 1,95 (m, 1H), 2,08 (m, 1H), 3,87 (d, 1H), 6,68 (d, 1H), 6,95 (m, 1H), 7,21 (m, 1H), 7,36 (m, 1H), 7,44-7,51 (m, 2H), 7,59 (m, 1H), 8,82 (d, 1H).
49	1,75 (d, 6H), 3,76 (d, 1H), 6,69 (m, 1H), 6,94 (m, 1H), 7,20 (m, 1H), 7,47 (m, 1H), 7,59-7,66 (m, 2H), 7,78 (dd, 1H), 8,90 (d, 1H).
51	6,81-6,84 (m, 1H), 7,39-7,64 (m, 8H), 7,72-7,76 (m, 3H), 7,99 (d, 1H), 8,07 (d, 1H), 8,89 (d, 1H), 10,29 (s, 1H).
53	1,19 (t, 3H), 4,25 (c, 2H), 4,31 (s, 2H), 7,04 (d, 1H), 7,32-7,53 (m, 5H), 7,86 (s, 1H), 8,84 (d, 1H).
59	0,94 (s, 6H), 1,26 (s, 6H), 2,45 (s, 3H), 3,91 (s, 2H), 7,03 (m, 1H), 7,28-7,37 (m, 3H), 7,40 (m, 1H), 7,53 (d, 1H), 7,61 (t, 1H), 7,80-7,88 (m, 4H), 8,16 (d, 1H), 8,40 (d, 1H), 9,27 (d, 1H).
60	1,37 (s, 6H), 1,98 (t, 1H), 2,98 (t, 1H), 6,72 (d, 1H), 7,08 (d, 1H), 7,17 (t, 1H), 7,47-7,65 (m, 3H), 8,02 (dd, 1H).
61	6,96 (m, 1H), 7,16-7,32 (m, 2H), 7,39-7,49 (m, 3H), 7,57 (m, 1H), 7,99 (d, 1H), 8,45 (a, 1H).
67	1,72 (s, 6H), 2,77 (s, 3H), 3,01 (a, 1H), 6,79 (d, 1H), 7,13-7,25 (m, 2H), 7,43-7,49 (m, 2H), 7,59-7,67 (m, 3H), 8,05 (d, 1H).
68	1,43 (d, 6H), 1,73 (s, 6H), 3,01 (s, 1H), 3,64 (m, 1H), 6,78 (d, 1H), 7,12-7,25 (m, 2H), 7,41-7,46 (m, 2H), 7,58-7,65 (m, 3H), 8,08 (d, 1H).
69	1,70 (s, 3H), 3,57 (s, 1H), 4,11 (s, 3H), 6,83 (d, 1H), 7,11-7,23 (m, 2H), 7,38 (t, 1H), 7,54-7,62 (m, 4H), 7,88 (d, 1H).

Tabla 31

Compuesto N.º	RMN-1H
70	1,35 (t, 3H), 1,71 (s, 6H), 3,61 (s, 1H), 4,56 (c, 2H), 6,84 (d, 1H), 7,11-7,20 (m, 2H), 7,39 (t, 1H), 7,53-7,63 (m, 4H), 7,85 (d, 1H).
72	1,26 (s, 3H), 1,36 (s, 3H), 1,76 (s, 3H), 2,17 (s, 1H), 4,01 (s, 1H), 6,89 (d, 1H), 7,17-7,28 (m, 2H), 7,54 (t, 1H), 7,60-7,71 (m, 4H), 8,11 (d, 1H), 8,78 (d, 1H).
73	1,15 (t, 3H), 1,86 (s, 3H), 3,80 (s, 1H), 3,94-4,08 (m, 2H), 6,95 (d, 1H), 7,23-7,37 (m, 2H), 7,49-7,55 (m, 2H), 7,61-7,71 (m, 3H), 8,10 (d, 1H), 8,72 (d, 1H).
74	2,04 (s, 3H), 4,27 (s, 1H), 6,60 (d, 1H), 6,94-7,04 (m, 3H), 7,10-7,46 (m, 8H), 8,31 (d, 1H).
75	1,84 (d, 3H), 3,12 (d, 1H), 3,36 (d, 1H), 4,17 (d, 1H), 6,50 (d, 1H), 6,89-7,50 (m, 11H), 8,51 (d, 1H).
76	1,83 (d, 3H), 3,92 (d, 1H), 5,01 (d, 1H), 5,16 (d, 1H), 6,25 (dd, 1H), 6,69 (d, 1H), 6,95 (dd, 1H), 7,22 (m, 1H), 7,33 (m, 1H), 7,47-7,50 (m, 2H), 7,56 (d, 1H), 8,76 (d, 1H).
77	1,74 (d, 3H), 2,62 (m, 1H), 2,89 (m, 1H), 3,87 (d, 1H), 5,10 (d, 1H), 5,78 (m, 1H), 6,69 (d, 1H), 6,94 (dd, 1H), 7,19 (m, 1H), 7,33 (m, 1H), 7,48-4,50 (m, 2H), 7,58 (d, 1H), 8,82 (d, 1H).
78	1,84 (d, 3H), 3,97 (d, 1H), 5,03 (d, 1H), 5,17 (d, 1H), 5,71 (dd, 1H), 6,27 (dd, 1H), 6,58 (d, 1H), 6,76 (dd, 1H), 6,93 (dd, 1H), 7,16-7,42 (m, 5H), 7,46 (d, 1H).
79	1,73 (d, 3H), 2,62 (m, 1H), 2,86 (m, 1H), 3,89-3,95 (m, 3H), 5,07-5,20 (m, 4H), 5,82 (m, 1H), 6,18 (m, 1H), 6,64 (d, 1H), 6,94 (dd, 1H), 7,16-7,41 (m, 5H).
80	0,95 (d, 3H), 0,99 (d, 3H), 1,67 (d, 3H), 2,30 (m, 1H), 3,81 (d, 1H), 6,67 (d, 1H), 6,94 (m, 1H), 7,17 (m, 1H), 7,33 (m, 1H), 7,45-7,51 (m, 2H), 7,61 (d, 1H), 8,81 (d, 1H).
81	1,75 (s, 3H), 1,85 (d, 3H), 4,00 (d, 1H), 4,77 (s, 1H), 4,95 (s, 1H), 6,68 (d, 1H), 6,95 (m, 1H), 7,22 (m, 1H), 7,35 (m, 1H), 7,48-7,51 (m, 2H), 7,57 (d, 1H), 8,72 (d, 1H).
82	1,81 (d, 3H), 3,09 (d, 1H), 3,35 (d, 1H), 4,13 (s, 1H), 6,57 (d, 1H), 6,80-7,04 (m, 6H), 7,10-7,51 (m, 4H), 8,65 (d, 1H).
83	1,00 (d, 3H), 1,67-1,70 (m, 3H), 2,84 (t, 2/3H), 2,95 (t, 1/3H), 3,72 (d, 1/3H), 3,94 (d, 2/3H), 4,97-5,10 (m, 2H), 5,78-5,95 (m, 1H), 6,68 (d, 1H), 6,90-6,96 (m, 1H), 7,16-7,25 (m, 1H), 7,31-7,38 (m, 1H), 7,47-7,50 (m, 2H), 7,59-7,62 (m, 1H), 8,81-8,83 (m, 1H).
86	0,39-0,45 (m, 3H), 0,55 (m, 1H), 1,51 (dd, 1H), 1,73 (d, 3H), 3,74 (d, 1H), 6,68 (m, 1H), 6,95 (m, 1H), 7,22 (m, 1H), 7,35 (m, 1H), 7,47-7,50 (m, 2H), 7,59 (d, 1H), 8,82 (d, 1H).
87	0,40-0,51 (m, 3H), 0,59 (m, 1H), 1,05 (m, 2H), 1,38 (m, 2H), 1,55 (m, 1H), 1,76 (d, 3H), 2,54 (m, 1H), 4,08 (d, 1H), 6,62 (d, 1H), 6,91 (dd, 1H), 7,13-7,40 (m, 4H), 7,45 (s, 1H).
88	0,95 (t, 3H), 1,73 (d, 3H), 1,98 (m, 1H), 2,08 (m, 1H), 2,79 (s, 3H), 3,96 (d, 1H), 6,58 (d, 1H), 6,92 (m, 1H), 7,19 (m, 1H), 7,29-7,46 (m, 4H).
89	1,74 (d, 3H), 2,76 (s, 3H), 3,99 (d, 1H), 5,02 (d, 1H), 5,18 (d, 1H), 6,28 (m, 1H), 6,58 (d, 1H), 6,94 (m, 1H), 7,21 (m, 1H), 7,29-7,42 (m, 4H).

ES 2 691 726 T3

Compuesto N.º	RMN- ¹ H
90	0,39-0,47 (m, 3H), 0,58 (m, 1H), 1,50 (m, 1H), 1,74 (d, 3H), 2,80 (s, 3H), 3,85 (d, 1H), 6,59 (d, 1H), 6,95 (m, 1H), 7,1 8 (m, 1H), 7,28-7,46 (m, 4H).

Tabla 32

Compuesto N.º	RMN- ¹ H
91	1,83 (d, 3H), 2,63 (s, 3H), 3,06 (d, 1H), 3,30 (d, 1H), 3,67 (s, 3H), 4,21 (a, 1H), 6,43 (d, 1H), 6,63 (d, 2H), 6,89-6,96 (m, 3H), 7,16 (m, 1H), 7,27-7,41 (m, 4H).
92	1,82 (d, 3H), 2,64 (s, 3H), 3,10 (d, 1H), 3,34 (d, 1H), 4,25 (a, 1H), 6,45 (d, 1H), 6,81-7,02 (m, 6H), 7,17 (m, 1H), 7,26-7,42 (m, 3H).
94	1,78 (d, 6H), 2,74 (s, 3H), 2,81 (s, 3H), 4,23 (d, 1H), 6,52 (d, 1H), 6,86 (dd, 1H), 7,10 (m, 1H), 7,37 (t, 1H), 7,48-7,51 (m, 3H).
97	1,81 (s, 6H), 2,82 (s, 3H), 4,02 (s, 1H), 6,80 (dd, 1H), 7,17 (m, 1H), 7,26-7,32 (m, 3H), 7,37-7,40 (m, 2H).
101	1,68 (s, 6H), 2,40 (s, 3H), 6,82 (d, 1H), 7,07 (m, 1H), 7,2-7,6 (m, 5H), 8,86 (d, 1H).
103	1,82 (s, 6H), 4,1 2 (s, 1H), 6,86 (dd, 1H), 7,15 (m, 1H), 7,28 (m, 1H), 7,47-7,56 (m, 2H), 7,62-7,70 (m, 2H), 8,10 (d, 1H), 8,77 (d, 1H).
105	1,76 (d, 3H), 2,76 (s, 3H), 3,93 (d, 1H), 6,58 (d, 1H), 6,92 (m, 1H), 7,13-7,27 (m, 2H), 7,35-7,42 (m, 2H), 8,02 (m, 1H).
107	1,78 (d, 6H), 2,75 (s, 3H), 6,55 (m, 1H), 6,89 (m, 1H), 7,14 (m, 1H), 7,4-7,7 (m, 4H), 8,05 (dd, 1H).
108	1,82 (s, 6H), 2,77 (s, 3H), 4,18 (s, 1H), 6,77 (dd, 1H), 7,13 (m, 1H), 7,25-7,35 (m, 2H), 7,46 (m, 1H), 7,59-7,64 (m, 2H), 8,04 (d, 1H).
111	2,62 (s, 3H), 6,75 (d, 1H), 6,96 (t, 1H), 7,36 (m, 1H), 7,55 (t, 1H), 7,61 (d, 1H), 7,65-7,76 (m, 2H), 8,12 (d, 1H), 8,79 (d, 1H).
113	0,20 (s, 9H), 6,73 (d, 1H), 6,97 (m, 1H), 7,36 (m, 1H), 7,54-7,77 (m, 4H), 8,1 2 (d, 1H), 8,71 (d, 1H).
118	1,76 (d, 3H), 2,74 (s, 3H), 3,92 (d, 1H), 6,55 (m, 1H), 6,91 (m, 1H), 7,17 (m, 1H), 7,41-7,51 (m, 2H), 7,57 (d, 1H), 8,04 (d, 1H).
119	1,77 (d, 6H), 3,88 (d, 1H), 6,63 (m, 1H), 7,04 (m, 1H), 7,53-7,59 (m, 2H), 7,65-7,73 (m, 2H), 8,12 (d, 1H), 8,79 (d, 1H).
126	1,77 (d, 6H), 3,97 (d, 1H), 6,64 (m, 1H), 6,91 (m, 1H), 7,17 (dt, 1H), 7,36 (dt, 1H), 7,63 (d, 1H), 7,68-7,77 (m, 2H), 8,80 (d, 1H).
131	2,17-2,25 (m, 2H), 2,83-2,93 (m, 1H), 3,16-3,27 (m, 1H), 3,33 (s, 3H), 4,88 (t, 1H), 6,84 (d, 1H), 7,14 (d, 1H), 7,30 (d, 1H), 7,48-7,54 (m, 2H), 7,59-7,68 (m, 2H), 8,10 (d, 1H), 8,85 (d, 1H).
132	1,44 (d, 3H), 3,25 (s, 3H), 4,73 (c, 1H), 6,96-6,99 (m, 1H), 7,26-7,33 (m, 2H), 7,41 (d, 1H), 7,51 (t, 1H), 7,58-7,66 (m, 3H), 8,10 (d, 1H), 8,82 (d, 1H).
133	0,99 (t, 3H), 2,16-2,25 (m, 1H), 2,88-2,92 (m, 1H), 3,16-3,25 (m, 1H), 3,35-3,43 (m, 1H), 3,48-3,56 (m, 1H), 4,97 (dd, 1H), 6,87 (d, 1H), 7,13 (d, 1H), 7,29 (t, 1H), 7,46-7,52 (m, 2H), 7,58-7,67 (m, 2H), 8,09 (d, 1H), 8,84 (d, 1H).
134	0,74 (t, 3H), 1,35-1,43 (m, 2H), 2,17-2,25 (m, 2H), 2,89 (m, 1H), 3,22 (m, 1H), 3,29 (m, 1H), 3,44 (m, 1H), 4,98 (m, 1H), 6,85 (d, 1H), 7,13 (d, 1H), 7,29 (t, 1H), 7,46-7,52 (m, 2H), 7,58-7,67 (m, 2H), 8,10 (d, 1H), 8,84 (d, 1H).

Tabla 33

Compuesto N.º	RMN- ¹ H
135	0,87 (t, 3H), 1,43 (d, 3H), 1,54 (m, 2H), 3,23 (m, 2H), 4,31 (m, 1H), 6,95 (m, 1H), 7,26-7,30 (m, 2H), 7,39 (d, 1H), 7,51 (m, 1H), 7,59-7,66 (m, 3H), 3,10 (d, 1H), 8,32 (d, 1H).
136	1,00 (s, 9H), 1,99 (a, 1H), 4,89 (d, 1H), 6,91 (d, 1H), 7,23 (m, 1H), 7,48 (d, 1H), 7,53 (d, 1H), 7,60-7,68 (m, 4H), 3,10 (d, 1H), 3,80 (d, 1H).
137	2,11 (m, 1H), 2,49 (m, 1H), 2,85 (a, 1H), 2,91 (m, 1H), 3,20 (m, 1H), 5,50 (m, 1H), 6,76 (d, 1H), 7,11 (d, 1H), 7,26 (t, 1H), 7,52 (t, 1H), 7,55-7,71 (m, 3H), 8,13 (d, 1H), 8,82 (s, 1H).
140	1,60 (d, 3H), 3,24 (s, 3H), 4,36 (c, 1H), 6,78 (d, 1H), 7,01 (t, 1H), 7,25-7,35 (m, 2H), 7,42-7,50 (m, 3H), 3,83 (d, 1H).
142	1,61 (d, 3H), 3,18 (s, 3H), 5,03 (c, 1H), 6,94 (dd, 1H), 7,15 (t, 1H), 7,27-7,37 (m, 2H), 7,41-7,49 (m, 2H), 3,81 (d, 1H).
143	0,44-0,67 (m, 4H), 1,62 (m, 1H), 2,86 (d, 1H), 4,57 (t, 1H), 6,84 (dd, 1H), 7,20 (t, 1H), 7,26 (m, 1H), 7,34 (m, 1H), 7,47-7,50 (m, 2H), 7,61 (d, 1H), 8,86 (d, 1H).
145	1,10 (s, 9H), 3,32 (d, 1H), 5,18 (d, 1H), 6,76 (dd, 1H), 7,14 (t, 1H), 7,24 (m, 1H), 7,37 (m, 1H), 7,47-7,53 (m, 2H), 7,71 (d, 1H), 8,83 (d, 1H).
146	1,65 (d, 3H), 2,99 (d, 1H), 5,50 (m, 1H), 6,81 (d, 1H), 7,15-7,27 (m, 2H), 7,36 (m, 1H), 7,48-7,50 (m, 2H), 7,60 (m, 1H), 3,86 (d, 1H).

ES 2 691 726 T3

Compuesto N.º	RMN- ¹ H
147	1,62 (d, 3H), 3,20 (s, 3H), 5,07 (c, 1H), 6,91 (dd, 1H), 7,22-7,35 (m, 3H), 7,41-7,49 (m, 3H), 8,81 (d, 1H).
143	1,65 (d, 3H), 3,00 (d, 1H), 5,47 (m, 1H), 6,34 (d, 1H), 7,10 (t, 1H), 7,30-7,51 (m, 4H), 7,61 (d, 1H), 8,86 (d, 1H).
149	1,61 (d, 3H), 3,19 (s, 3H), 5,06 (c, 1H), 6,96 (d, 1H), 7,17 (t, 1H), 7,28 (m, 1H), 7,43-7,51 (m, 4H), 3,81 (d, 1H).
150	1,50 (d, 3H), 2,54 (s, 3H), 3,16 (s, 3H), 4,92 (c, 1H), 6,84 (d, 1H), 7,08 (d, 1H), 7,21 (t, 1H), 7,26-7,34 (m, 2H), 7,38-7,46 (m, 2H), 8,84 (d, 1H).
152	1,61 (d, 3H), 2,33 (s, 3H), 3,16 (s, 3H), 5,05 (c, 1H), 6,85 (dd, 1H), 7,21-7,32 (m, 4H), 7,34-7,40 (m, 2H).
153	1,63 (d, 3H), 3,29 (s, 3H), 4,97 (c, 1H), 7,18 (d, 1H), 7,32-7,51 (m, 5H), 7,61 (d, 1H), 8,83 (d, 1H).
154	1,62 (d, 3H), 3,22 (s, 3H), 4,09 (s, 3H), 5,08 (c, 1H), 6,91 (d, 1H), 6,97 (m, 1H), 7,13 (t, 1H), 7,25 (m, 1H), 7,41-7,47 (m, 3H), 8,76 (d, 1H).
155	1,58 (d, 3H), 3,20 (s, 3H), 3,90 (s, 3H), 4,09 (s, 3H), 5,00 (c, 1H), 6,58 (d, 1H), 6,78 (d, 1H), 6,95 (d, 1H), 7,21-7,28 (m, 2H), 7,39-7,4 (m, 2H), 8,78 (a, 1H).
156	1,63 (d, 3H), 3,82 (d, 2H), 4,98 (dd, 1H), 5,15 (dd, 1H), 5,21 (c, 1H), 5,70 (m, 1H), 6,92 (dd, 1H), 7,24-7,33 (m, 3H), 7,39-7,49 (m, 3H), 8,82 (d, 1H).
157	1,02 (t, 3H), 1,92-2,08 (m, 2H), 2,84 (d, 1H), 5,23 (m, 1H), 6,80 (dd, 1H), 7,18 (t, 1H), 7,24 (m, 1H), 7,35 (m, 1H), 7,45-7,51 (m, 2H), 7,60 (m, 1H), 8,84 (d, 1H).

Tabla 34

Compuesto N.º	RMN- ¹ H
160	1,65 (d, 3H), 4,33 (d, 1H), 4,38 (d, 1H), 5,25 (d, 1H), 6,93 (dd, 1H), 7,13 (m, 5H), 7,25-7,42 (m, 6H), 8,79 (d, 1H).
161	6,56 (d, 1H), 6,78 (m, 1H), 7,2-7,5 (m, 11H), 8,50 (d, 1H).
163	0,35 (t, 3H), 1,2-1,4 (m, 4H), 1,9-2,1 (m, 2H), 2,90 (d, 1H), 5,31 (m, 1H), 6,80 (dd, 1H), 7,1-7,6 (m, 6H), 8,83 (d, 1H).
164	2,25 (m, 1H), 3,53 (d, 1H), 6,07 (dd, 1H), 6,36 (m, 1H), 7,2-7,7 (m, 6H), 3,85 (d, 1H).
165	0,13 (s, 9H), 6,45 (s, 1H), 6,94 (d, 1H), 7,29-7,38 (m, 3H), 7,48-7,50 (m, 2H), 7,59 (m, 1H), 8,86 (d, 1H).
167	1,62 (d, 3H), 3,20 (s, 3H), 5,03 (c, 1H), 6,91 (dd, 1H), 7,21-7,34 (m, 3H), 7,42-7,47 (m, 3H), 8,31 (d, 1H).
168	3,51 (s, 3H), 3,65 (s, 3H), 5,44 (s, 1H), 6,89 (m, 1H), 7,2-7,6 (m, 6H), 8,78 (d, 1H).
170	0,02 (s, 9H), 2,26 (s, 3H), 5,52 (s, 1H), 6,86 (dd, 1H), 7,2-7,6 (m, 6H), 8,75 (d, 1H).
171	2,22 (s, 3H), 4,13 (d, 1H), 5,66 (d, 1H), 6,91 (m, 1H), 7,3-7,6 (m, 6H), 3,76 (d, 1H).
172	2,34 (s, 3H), 3,46 (s, 3H), 5,28 (s, 1H), 6,9 (m, 1H), 7,2-7,26 (m, 6H), 8,81 (d, 1H).
173	1,26 (s, 3H), 1,45 (s, 3H), 3,67 (d, 1H), 5,27 (d, 1H), 6,83 (d, 1H), 7,1-7,5 (m, 6H), 7,66 (sa, 1H), 8,82 (d, 1H).
174	2,97 (d, 1H), 3,31 (m, 2H), 5,59 (m, 1H), 6,75 (d, 1H), 7,13-7,49 (m, 11H), 8,77 (a, 1H).
175	3,19 (s, 3H), 3,28-3,44 (m, 2H), 5,18 (t, 1H), 6,82 (d, 1H), 7,11-7,49 (m, 11H), 8,67 (a, 1H).
177	1,60 (d, 3H), 3,17 (s, 3H), 5,04 (c, 1H), 6,97 (dd, 1H), 7,13 (t, 1H), 7,26-7,36 (m, 2H), 7,42-7,49 (m, 2H), 8,81 (d, 1H).
180	1,23 (s, 3H), 1,40 (s, 3H), 3,20 (s, 3H), 4,87 (s, 1H), 6,94 (d, 1H), 7,26-7,35 (m, 3H), 7,45-7,48 (m, 3H), 8,75 (d, 1H).
181	3,59 (d, 1H), 3,70 (s, 3H), 5,79 (d, 1H), 6,8-6,95 (m, 1H), 7,2-7,6 (m, 6H), 8,77 (d, 1H).
185	1,71 (t, 3H), 3,06 (m, 1H), 5,34 (m, 1H), 7,08 (d, 1H), 7,32-7,41 (m, 2H), 7,49-7,52 (m, 3H), 7,67 (dd, 1H), 3,86 (d, 1H).
186	1,67 (d, 3H), 3,16 (s, 3H), 4,85 (c, 1H), 7,21 (d, 1H), 7,32 (m, 1H), 7,41-7,47 (m, 4H), 7,58 (d, 1H), 8,30 (d, 1H).
188	1,63 (d, 3H), 3,23 (s, 3H), 5,10 (c, 1H), 6,89 (dd, 1H), 7,18-7,29 (m, 2H), 7,45 (d, 1H), 7,52 (t, 1H), 7,60-7,69 (m, 2H), 8,10 (d, 1H), 8,78 (d, 1H).
189	1,48 (d, 3H), 1,97 (d, 1H), 5,17 (m, 1H), 7,15 (m, 1H), 7,24-7,35 (m, 2H), 7,45-7,52 (m, 2H), 7,58-7,63 (m, 2H), 8,09 (d, 1H), 8,87 (d, 1H).
190	1,61 (d, 3H), 2,69 (m, 1H), 5,43 (m, 1H), 7,09 (t, 1H), 7,27-7,34 (m, 2H), 7,52 (t, 1H), 7,60-7,67 (m, 2H), 8,10 (d, 1H), 8,87 (d, 1H).
198	1,61 (d, 3H), 2,83 (s, 3H), 3,16 (s, 3H), 5,04 (c, 1H), 6,84 (dd, 1H), 7,19-7,36 (m, 5H).

ES 2 691 726 T3

Tabla 35

Compuesto N.º	RMN- ¹ H
200	1,62 (d, 3H), 3,22 (s, 3H), 5,09 (c, 1H), 6,87 (dd, 1H), 7,1-7,4 (m, 3H), 7,46 (d, 1H), 7,6-7,8 (m, 2H), 8,78 (d, 1H).
204	1,78 (s, 3H), 3,74 (s, 3H), 4,14 (d, 1H), 5,85 (d, 1H), 6,93 (m, 1H), 7,2-7,5 (m, 6H), 8,78 (d, 1H).
206	1,77 (d, 1H), 2,71 (s, 3H), 5,52 (m, 1H), 6,24 (dd, 1H), 6,83 (m, 1H), 7,07 (m, 1H), 7,42-7,77 (m, 2H), 7,80 (m, 1H).
207	1,52 (dd, 3H), 2,29 (s, 6H), 3,95 (c, 1H), 6,78 (d, 1H), 6,97 (m, 1H), 7,23-7,34 (m, 2H), 7,43-7,47 (m, 3H), 8,84 (d, 1H).
209	1,60 (d, 3H), 3,19 (s, 3H), 3,92 (s, 3H), 4,82 (c, 1H), 7,0-7,1 (m, 1H), 7,2-7,5 (m, 6H), 8,84 (d, 1H).
210	1,59 (d, 3H), 2,59 (s, 3H), 3,23 (s, 3H), 4,76 (c, 1H), 6,99 (dd, 1H), 7,11 (dd, 1H), 7,2-7,5 (m, 5H), 5,85 (d, 1H).
211	1,60 (d, 3H), 2,51 (s, 3H), 3,23 (s, 3H), 5,04 (c, 1H), 6,78 (dd, 1H), 7,12 (d, 1H), 7,2-7,5 (m, 5H), 8,83 (d, 1H).
212	1,74 (d, 3H), 3,24 (s, 3H), 3,26 (s, 3H), 5,48 (c, 1H), 7,2-7,5 (m, 5H), 8,00 (d, 1H), 5,51 (d, 1H).
215	1,60 (d, 3H), 3,02 (s, 3H), 4,48 (c, 1H), 7,02 (dd, 1H), 7,12 (dd, 1H), 7,2-7,55 (m, 10H), 8,85 (d, 1H).
217	3,42 (s, 6H), 5,65 (s, 1H), 6,79 (d, 1H), 7,01 (t, 1H), 7,29-7,37 (m, 2H), 7,45-7,48 (m, 3H), 8,86 (d, 1H).
218	1,11 (t, 6H), 3,49 (m, 2H), 3,74 (m, 2H), 5,73 (s, 1H), 6,80 (d, 1H), 7,01 (t, 1H), 7,27-7,36 (m, 2H), 7,43-7,49 (m, 3H), 8,86 (d, 1H).
220	3,35 (s, 3H), 4,66 (s, 2H), 6,92 (dd, 1H), 7,29-7,35 (m, 3H), 7,44-7,46 (m, 3H), 8,88 (d, 1H).
221	3,99 (m, 2H), 4,70 (s, 2H), 5,00 (d, 1H), 5,17 (d, 1H), 5,78 (m, 1H), 6,93 (dd, 1H), 7,28-7,35 (m, 3H), 7,44-7,49 (m, 3H), 8,83 (d, 1H).
223	3,36 (s, 3H), 4,66 (s, 2H), 6,96 (d, 1H), 7,22 (t, 1H), 7,33 (m, 1H), 7,45-7,52 (m, 3H), 8,88 (d, 1H).
224	0,83 (t, 3H), 1,30 (m, 2H), 1,40 (m, 2H), 2,60 (t, 2H), 3,99 (s, 2H), 6,90 (d, 1H), 7,20-7,37 (m, 3H), 7,44-7,50 (m, 3H), 3,87 (d, 1H).
225	0,99 (s, 6H), 1,48 (s, 6H), 1,63 (d, 1H), 3,57 (d, 1H), 6,93 (d, 1H), 7,14-7,26 (m, 2H), 7,44-7,71 (m, 5H), 8,09 (d, 1H), 3,77 (a, 1H).
226	0,95 (s, 6H), 1,42 (s, 6H), 2,43 (s, 3H), 4,01 (s, 2H), 6,37 (d, 1H), 7,11 (m, 1H), 7,20 (m, 1H), 7,28 (d, 2H), 7,40-7,54 (m, 3H), 7,59-7,74 (m, 4H), 8,10 (d, 1H), 8,68 (d, 1H).
227	1,23 (s, 6H), 1,52 (s, 6H), 2,49 (s, 1H), 6,94 (d, 1H), 7,18-7,26 (m, 2H), 7,49-7,68 (m, 5H), 8,10 (d, 1H), 8,77 (d, 1H).
230	0,87 (s, 3H), 1,04 (s, 3H), 1,22 (d, 3H), 1,52 (d, 6H), 1,68 (d, 1H), 4,08 (m, 1H), 6,94 (m, 1H), 7,15-7,26 (m, 2H), 7,46-7,54 (m, 2H), 7,59-7,68 (m, 3H), 8,10 (d, 1H), 8,78 (d, 1H).
232	1,38 (s, 6H), 1,65 (s, 6H), 6,95 (m, 1H), 7,19-7,31 (m, 2H), 7,47 (d, 1H), 7,52 (m, 1H), 7,60-7,69 (m, 3H), 8,10 (d, 1H), 8,75 (d, 1H).

Tabla 36

Compuesto N.º	RMN- ¹ H
234	1,49 (s, 6H), 6,92 (m, 1H), 7,19-7,33 (m, 2H), 7,48-7,71 (m, 5H), 8,02 (d, 1H), 8,72 (d, 1H), 9,72 (s, 1H).
235	1,06 (s, 6H), 1,57 (s, 6H), 3,64 (d, 1H), 6,73 (d, 1H), 6,87 (m, 1H), 7,15 (m, 1H), 7,81-7,55 (m, 2H), 7,61-7,73 (m, 2H), 8,10 (d, 1H), 8,75 (d, 1H).
243	1,08 (s, 6H), 1,52 (s, 6H), 2,26 (s, 2H), 6,88 (m, 1H), 7,17 (m, 1H), 7,36 (s, 2H), 7,50-7,70 (m, 4H), 8,81 (d, 1H), 8,91 (d, 1H).
244	1,02 (a, 1H), 1,46 (s, 6H), 2,19 (t, 2H), 3,56 (m, 2H), 6,90 (d, 1H), 7,13-7,24 (m, 2H), 7,43 (d, 1H), 7,49-7,54 (m, 2H), 7,60-7,70 (m, 2H), 8,10 (d, 1H), 8,81 (d, 1H).
246	1,06 (d, 3H), 1,50 (d, 6H), 1,96 (dd, 1H), 2,15 (dd, 1H), 3,83 (m, 1H), 6,89 (dd, 1H), 7,13-7,26 (m, 2H), 7,46-7,55 (m, 2H), 7,59-7,70 (m, 3H), 8,11 (d, 1H), 8,82 (d, 1H).
247	1,47 (s, 6H), 2,21 (d, 2H), 3,16 (s, 6H), 4,19 (t, 1H), 6,87 (dd, 1H), 7,13-7,20 (m, 2H), 7,44 (m, 1H), 7,49 (t, 1H), 7,54-7,70 (m, 3H), 8,10 (d, 1H), 8,81 (d, 1H).
248	0,99 (s, 6H), 1,49 (s, 6H), 3,43 (s, 6H), 3,95 (s, 1H), 6,93 (d, 1H), 7,12-7,24 (m, 2H), 7,42 (d, 1H), 7,48-7,67 (m, 4H), 8,09 (d, 1H), 8,78 (d, 1H).
251	1,26 (s, 6H), 1,56 (s, 6H), 2,48 (s, 1H), 2,79 (s, 1H), 6,88 (m, 1H), 7,19-7,30 (m, 3H), 7,43 (t, 1H), 7,56-7,61 (m, 3H), 8,02 (d, 1H).
252	0,97 (t, 1H), 1,47 (s, 6H), 2,19 (t, 2H), 2,84 (s, 3H), 3,57 (m, 1H), 6,83 (dd, 1H), 7,11-7,23 (m, 2H), 7,37 (s, 1H), 7,41-7,46 (m, 2H), 7,56-7,62 (m, 2H), 8,02 (d, 1H).
253	1,09 (d, 3H), 1,40 (s, 3H), 1,45 (s, 3H), 1,72 (sa, 1H), 4,54 (m, 1H), 6,89 (dd, 1H), 7,1-7,3 (m, 2H), 7,4-7,7 (m, 5H), 8,09 (d, 1H), 8,77 (d, 1H).
254	0,91 (t, 3H), 1,2-1,5 (m, 5H), 1,6-1,7 (m, 1H), 4,1-4,2 (m, 1H), 6,90 (dd, 1H), 7,1-7,3 (m, 2H), 7,4-7,7 (m, 5H), 8,10 (d, 1H), 8,77 (d, 1H).

ES 2 691 726 T3

Compuesto N.º	RMN- ¹ H
255	1,43 (s, 3H), 1,49 (s, 3H), 1,57 (s, 3H), 1,75 (d, 1H), 4,8-5,0 (m, 3H), 6,91 (dd, 1H), 7,1-7,3 (m, 2H), 7,4-7,7 (m, 5H), 8,10 (d, 1H), 8,31 (d, 1H).
256	0,89 (s, 3H), 1,05-1,10 (m, 6H), 1,23 (a, 6H), 2,31 (s, 3H), 4,09 (m, 1H), 6,88 (d, 1H), 7,18-7,26 (m, 3H), 7,42 (t, 1H), 7,55-7,64 (m, 3H), 8,01 (d, 1H).
257	1,24 (s, 6H), 1,53 (a, 6H), 1,88 (s, 3H), 2,83 (s, 3H), 6,37 (d, 1H), 7,13-7,26 (m, 3H), 7,41-7,46 (m, 2H), 7,56-7,60 (m, 2H), 8,03 (d, 1H).
253	1,11 (a, 1H), 1,45 (s, 6H), 2,37 (t, 2H), 3,55 (m, 2H), 6,90 (m, 1H), 7,15-7,34 (m, 3H), 7,42-7,46 (m, 3H), 7,53 (d, 1H), 8,84 (d, 1H).
259	0,98 (a, 1H), 1,46 (s, 6H), 2,17 (t, 2H), 2,86 (s, 3H), 3,57 (m, 2H), 6,86 (d, 1H), 7,15-7,30 (m, 3H), 7,36-7,37 (m, 3H), 7,45 (m, 1H).
260	1,51 (s, 6H), 2,11 (s, 3H), 6,91 (dd, 1H), 7,2-7,3 (m, 2H), 7,5-7,7 (m, 5H), 8,11 (d, 1H), 8,71 (d, 1H).
261	1,47 (s, 6H), 2,28 (t, 2H), 2,84 (s, 3H), 3,66 (s, 3H), 4,04 (t, 2H), 6,84 (m, 1H), 7,12-7,28 (m, 3H), 7,30-7,45 (m, 4H).

Tabla 37

Compuesto N.º	RMN- ¹ H
262	1,59 (s, 6H), 2,18 (s, 3H), 6,72 (m, 1H), 6,96 (m, 1H), 7,2-7,6 (m, 5H), 8,73 (d, 1H).
263	1,3 (s, 6H), 1,63 (s, 6H), 6,74 (d, 1H), 6,91 (m, 1H), 7,18 (m, 1H), 7,5-7,8 (m, 4H), 8,10 (d, 1H), 8,75 (d, 1H).
265	1,60 (s, 6H), 2,18 (s, 3H), 6,70 (d, 1H), 6,92 (m, 1H), 7,20 (m, 1H), 7,5-7,8 (m, 2H), 8,10 (d, 1H), 8,69 (d, 1H).
266	1,59 (d, 6H), 2,18 (s, 3H), 6,68 (d, 2H), 6,92 (dd, 1H), 6,96-7,24 (m, 1H), 7,31-7,37 (m, 1H), 7,55 (d, 1H), 7,67-7,75 (m, 2H), 8,69 (d, 1H).
267	1,59 (d, 6H), 2,18 (s, 3H), 6,70 (d, 1H), 6,96 (dd, 1H), 7,19-7,25 (m, 1H), 7,40-7,49 (m, 2H), 7,53 (d, 1H), 8,75 (d, 1H).
268	0,87 (d, 3H), 1,39 (s, 3H), 1,44 (s, 3H), 1,85 (s, 1H), 4,50 (m, 1H), 6,91 (d, 1H), 7,16-7,33 (m, 3H), 7,43-7,52 (m, 3H), 8,81 (d, 1H).
269	1,51 (s, 6H), 2,14 (s, 3H), 6,92 (d, 1H), 7,22-7,36 (m, 3H), 7,44-7,48 (m, 2H), 7,50-7,58 (m, 2H), 8,73 (d, 1H).
270	1,38 (s, 6H), 2,86 (s, 3H), 6,88 (d, 1H), 7,13-7,43 (m, 5H), 7,50-7,56 (m, 2H).
271	1,89 (s, 6H), 6,93 (d, 1H), 7,20 (m, 1H), 7,31 (m, 1H), 7,54 (t, 1H), 7,63-7,73 (m, 2H), 8,12 (d, 1H), 8,83 (d, 1H).
277	0,32 (t, 3H), 1,20 (t, 3H), 1,64 (m, 1H), 3,04 (m, 1H), 6,98 (m, 1H), 7,19-7,26 (m, 2H), 7,32-7,39 (m, 2H), 7,49 (t, 1H), 7,52-7,65 (m, 2H), 8,10 (d, 1H), 8,83 (a, 1H).
278	0,79 (d, 3H), 0,94 (d, 3H), 1,21 (d, 3H), 1,78-1,90 (m, 1H), 2,80-2,90 (m, 1H), 6,94-6,99 (m, 1H), 7,18-7,4 (m, 2H), 7,35 (d, 1H), 7,49 (t, 1H), 7,58-7,65 (m, 3H), 8,09 (d, 1H), 8,93 (a, 1H).
280	2,24 (s, 3H), 2,72 (s, 3H), 4,13 (d, 1H), 5,51 (d, 1H), 6,69 (d, 1H), 7,02 (t, 1H), 7,2-7,6 (m, 5H).
286	1,73-1,82 (m, 4H), 2,66-2,70 (m, 2H), 2,82-2,84 (m, 2H), 6,82 (d, 1H), 6,98 (d, 1H), 7,13 (t, 1H), 7,31 (d, 1H), 7,48-7,76 (m, 4H), 8,07-8,14 (m, 2H), 8,83 (d, 1H).
289	1,26 (t, 3H), 4,25 (c, 2H), 6,73 (d, 1H), 7,01 (t, 1H), 7,41 (m, 1H), 7,56 (t, 1H), 7,63 (d, 1H), 7,66-7,75 (m, 2H), 8,12 (d, 1H), 8,74 (d, 1H).
295	3,13 (s, 3H), 3,63 (s, 3H), 6,76 (d, 1H), 7,03 (m, 1H), 7,31-7,52 (m, 4H), 7,60 (dd, 1H), 8,78 (d, 1H).
297	1,01 (m, 2H), 1,31 (m, 2H), 4,53 (s, 2H), 6,79 (d, 1H), 6,98 (t, 1H), 7,08-7,11 (m, 2H), 7,16-7,18 (m, 3H), 7,23-7,49 (m, 5H), 8,37 (d, 1H).
306	1,66 (s, 3H), 2,93 (d, 1H), 2,99 (d, 1H), 6,74 (d, 1H), 6,95 (t, 1H), 7,26-7,36 (m, 2H), 7,46-7,48 (m, 2H), 7,54 (d, 1H), 8,85 (d, 1H).
328	3,45 (s, 6H), 4,54 (s, 2H), 5,93 (s, 1H), 7,04 (d, 1H), 7,17 (t, 1H), 7,27 (m, 1H), 7,31 (m, 1H), 7,43 (m, 1H), 7,50 (m, 1H), 7,85 (s, 1H), 8,36 (d, 1H).
329	1,27 (t, 3H), 4,26 (c, 2H), 4,60 (s, 2H), 7,27-7,52 (m, 6H), 7,81 (s, 1H), 7,99 (d, 1H), 8,88 (d, 1H).
330	1,18 (t, 3H), 4,24 (c, 2H), 4,30 (s, 2H), 7,01-7,07 (m, 2H), 7,35 (m, 1H), 7,51 (t, 1H), 7,67 (t, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,85 (s, 1H), 8,07 (d, 1H), 8,78 (d, 1H).

Tabla 38

Compuesto N.º	RMN- ¹ H
331	1,15 (t, 3H), 4,09 (c, 2H), 4,28 (s, 2H), 7,02-7,07 (m, 2H), 7,27-7,40 (m, 2H), 7,68-7,83 (m, 2H), 8,16 (d, 1H), 8,78 (d, 1H).
334	5,28-5,61 (m, 2H), 5,83-6,12 (m, 2H), 7,18-7,42 (m, 4H), 7,54-8,10 (m, 4H), 8,47 (dd, 1H), 9,02 (d, 1H).
339	1,55 (d, 3H), 1,68 (d, 3H), 6,14 (s, 1H), 7,32-7,41 (m, 2H), 7,51-7,63 (m, 3H), 7,81-7,88 (m, 2H), 8,16 (d, 1H), 8,44 (d, 1H), 9,24 (d, 1H).

ES 2 691 726 T3

Compuesto N.º	RMN- ¹ H
340	7,52-7,67 (m, 5H), 7,83-7,88 (m, 2H), 7,96 (m, 1H), 8,08 (d, 1H), 8,18-8,21 (m, 2H), 8,53 (d, 1H), 9,42 (d, 1H).
343	5,94 (dd, 1H), 6,22 (dd, 1H), 6,89 (dd, 1H), 7,54-7,87 (m, 7H), 8,14 (m, 1H), 8,47 (d, 1H), 9,28 (d, 1H).
344	1,66 (s, 3H), 3,02 (s, 2H), 4,50 (m, 1H), 4,70 (m, 1H), 7,31-7,71 (m, 7H), 8,50 (m, 1H), 9,33 (d, 1H).
345	3,07 (t, 2H), 3,58 (t, 2H), 7,35-7,71 (m, 5H), 7,84-7,91 (m, 2H), 8,19 (d, 1H), 8,50 (d, 1H), 9,36 (d, 1H).
347	1,64 (s, 3H), 3,53 (s, 2H), 4,40 (m, 1H), 4,64 (m, 1H), 7,17 (dd, 1H), 7,26-7,42 (m, 2H), 7,63 (m, 1H), 7,82-7,90 (m, 2H), 8,18 (m, 1H), 8,46 (d, 1H), 9,30 (d, 1H).
350	1,67 (d, 3H), 1,75 (d, 3H), 2,60 (sa, 1H), 5,04 (sa, 1H), 6,54 (s, 1H), 7,02-7,10 (m, 2H), 7,18-7,55 (m, 5H), 8,04 (s, 1H), 8,85 (d, 1H).
351	3,94-4,00 (m, 2H), 5,12-5,26 (m, 3H), 5,75 (d, 1H), 6,09 (m, 1H), 6,49 (dd, 1H), 7,10 (m, 1H), 7,38-7,53 (m, 3H), 7,69-7,76 (m, 3H), 8,00 (d, 1H), 8,12 (d, 1H), 9,48 (d, 1H).
352	1,17 (t, 3H), 4,20 (c, 2H), 6,94 (d, 1H), 7,31 (t, 1H), 7,55-7,61 (m, 2H), 7,67-7,77 (m, 3H), 3,04 (d, 1H), 8,14 (d, 1H), 8,80 (a, 1H).
353	2,61 (s, 3H), 6,90 (d, 1H), 7,28-7,38 (m, 3H), 7,45-7,51 (m, 2H), 7,58 (m, 1H), 8,86 (d, 1H).
355	2,61 (s, 3H), 6,93 (d, 1H), 7,23-7,37 (m, 2H), 7,43-7,49 (m, 3H), 7,57 (s, 1H), 8,82 (a, 1H).
359	2,61 (s, 3H), 2,74 (s, 3H), 6,78 (dd, 1H), 7,24-7,46 (m, 5H), 7,46 (s, 1H).
360	1,24 (d, 6H), 3,16 (sep, 1H), 6,88 (d, 1H), 7,2-7,6 (m, 6H), 8,81 (d, 1H).
361	2,60 (s, 3H), 6,93 (dd, 1H), 7,21 (t, 1H), 7,35 (m, 1H), 7,47-7,51 (m, 3H), 3,83 (d, 1H).
363	1,06 (m, 2H), 1,25 (m, 2H), 2,29 (m, 1H), 6,96 (dd, 1H), 7,29-7,38 (m, 3H), 7,43-7,53 (m, 3H), 8,83 (d, 1H).
364	2,00 (s, 3H), 5,79 (s, 1H), 6,06 (s, 1H), 6,90 (d, 1H), 7,26-7,37 (m, 3H), 7,45-7,51 (m, 2H), 7,57 (m, 1H), 8,78 (a, 1H).
365	1,33 (s, 9H), 6,90 (dd, 1H), 7,26-7,37 (m, 3H), 7,46-7,51 (m, 2H), 7,54 (m, 1H), 8,81 (d, 1H).
367	2,62 (s, 3H), 2,65 (s, 3H), 2,80 (s, 3H), 6,59 (d, 1H), 6,92 (t, 1H), 7,26-7,39 (m, 2H), 7,48-7,51 (m, 3H).
368	6,95 (d, 1H), 7,2-7,7 (m, 10H), 7,87 (m, 1H), 8,64 (d, 1H).
371	0,91 (s, 3H), 1,38 (m, 2H), 1,70 (m, 2H), 2,89 (t, 2H), 6,83 (d, 1H), 7,2-7,6 (m, 6H), 3,82 (d, 1H).
373	6,66 (s, 1H), 6,76 (d, 1H), 7,04 (t, 1H), 7,36-7,56 (m, 4H), 7,73 (d, 1H), 8,84 (d, 1H).

Tabla 39

Compuesto N.º	RMN- ¹ H
374	6,79 (d, 1H), 7,04 (t, 1H), 7,35-7,56 (m, 4H), 7,74 (s, 1H), 8,82 (d, 1H).
375	2,46 (s, 3H), 6,86 (d, 1H), 7,2-7,7 (m, 6H), 8,80 (d, 1H).
376	1,57 (s, 6H), 2,7 (sa, 1H), 6,89 (dd, 1H), 7,2-7,7 (m, 6H), 8,82 (d, 1H).
377	1,24 (d, 6H), 3,16 (sep, 1H), 6,88 (d, 1H), 7,2-7,6 (m, 6H), 8,81 (d, 1H).
382	2,59 (s, 3H), 2,69 (s, 3H), 6,69 (d, 1H), 6,99 (t, 1H), 7,25 (m, 1H), 7,33-7,41 (m, 3H), 8,00 (m, 1H).
383	2,61 (s, 3H), 2,69 (s, 3H), 6,62 (d, 1H), 6,97 (t, 1H), 7,24-7,37 (m, 2H), 7,48 (s, 1H), 7,61-7,69 (m, 2H).
384	2,15 (s, 3H), 5,11 (s, 2H), 6,78 (d, 1H), 7,03 (t, 1H), 7,33-7,53 (m, 4H), 7,64 (d, 1H), 8,84 (d, 1H).
388	2,61 (s, 3H), 6,80 (d, 1H), 7,02 (m, 1H), 7,22 (m, 1H), 7,39 (m, 1H), 7,58 (m, 1H), 7,79 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 8,81 (d, 1H).
389	2,60 (s, 3H), 2,69 (s, 3H), 6,67 (d, 1H), 6,98 (t, 1H), 7,32-7,45 (m, 3H), 7,58 (d, 1H), 8,03 (s, 1H).
390	6,76 (d, 1H), 7,04 (t, 1H), 7,40 (m, 1H), 7,47-7,57 (m, 3H), 7,75 (s, 1H), 8,82 (d, 1H).
397	1,53 (sa, 6H), 2,73 (s, 3H), 6,67 (d, 1H), 6,99 (t, 1H), 7,2-7,7 (m, 5H).
398	1,53 (d, 6H), 6,98 (t, 1H), 7,3-7,7 (m, 5H), 8,81 (d, 1H).
401	6,97 (d, 1H), 7,10 (t, 1H), 7,26-7,38 (m, 3H), 7,46-7,75 (m, 7H), 8,14 (d, 1H), 8,35 (d, 1H), 8,91 (d, 1H), 9,36 (s, 1H).
402	3,94 (s, 3H), 6,87 (d, 1H), 7,24-7,35 (m, 2H), 7,56 (t, 1H), 7,61-7,73 (m, 3H), 8,11 (d, 1H), 8,79 (d, 1H).
400	3,89 (s, 3H), 6,92 (d, 1H), 7,26 (t, 1H), 7,43 (d, 1H), 7,54 (t, 1H), 7,61-7,74 (m, 3H), 8,11 (d, 1H), 8,79 (d, 1H).
409	1,19 (t, 3H), 2,33 (d, 3H), 4,27 (c, 2H), 6,78 (d, 1H), 7,29-7,35 (m, 2H), 7,44-7,48 (m, 3H), 8,84 (d, 1H).
410	1,41 (s, 9H), 6,97 (d, 1H), 7,28-7,38 (m, 3H), 7,45-7,49 (m, 3H), 8,85 (d, 1H).
427	1,33 (d, 3H), 2,80 (s, 3H), 3,38 (s, 3H), 4,00 (m, 1H), 6,77 (d, 1H), 7,03 (m, 1H), 7,25-7,45 (m, 5H).
428	1,02 (t, 3H), 1,36 (s, 3H), 1,79 (c, 2H), 2,18 (s, 1H), 2,79 (s, 3H), 6,75 (d, 1H), 7,03 (m, 1H), 7,28-7,45 (m, 5H).
430	1,03 (t, 3H), 1,28 (m, 2H), 1,68 (m, 2H), 3,90 (c, 2H), 6,79 (d, 1H), 6,97 (t, 1H), 7,26-7,35 (m, 2H), 7,40-7,50 (m, 3H), 8,83 (d, 1H).

ES 2 691 726 T3

Compuesto N.º	RMN- ¹ H
431	0,66-0,87 (m, 2H), 1,1 2-1,19 (m, 2H), 1,26-1,29 (m, 8H), 1,99 (s, 1H), 6,67 (d, 1H), 6,89 (m, 1H), 7,18 (m, 1H), 7,34 (m, 1H), 7,47-7,50 (m, 2H), 7,62 (m, 1H), 8,82 (d, 1H).
435	1,82 (d, 6H), 5,28 (a, 2H), 6,62 (d, 1H), 6,87 (dd, 1H), 7,1 9 (m, 1H), 7,33 (m, 1H), 7,43-7,51 (m, 2H), 7,68 (m, 1H), 8,79 (d, 1H).
437	1,93 (d, 6H), 6,72 (m, 1H), 6,91-6,98 (m, 2H), 7,19-7,38 (m, 2H), 7,43-7,52 (m, 2H), 7,53 (m, 1H), 8,83 (d, 1H).
442	2,46 (s, 6H), 5,22 (s, 1H), 6,8-7,0 (m, 1H), 7,2-7,5 (m, 5H), 7,67 (dd, 1H), 8,84 (d, 1H).

Tabla 40

Compuesto N.º	RMN- ¹ H
443	2,07 (s, 3H), 6,78 (d, 1H), 6,80 (sa, 1H), 7,00 (d, 1H), 7,2-7,6 (m, 5H), 7,78 (m, 1H), 8,88 (d, 1H).
445	1,54 (dd, 3H), 1,61-1,69 (m, 4H), 2,34-2,39 (m, 2H), 2,54-2,59 (m, 2H), 3,92 (c, 1H), 6,79 (m, 1H), 6,97 (m, 1H), 7,22-7,33 (m, 2H), 7,39 (m, 1H), 7,43-7,47 (m, 2H), 8,83 (d, 1H).
446	1,47 (d, 3H), 1,54 (s, 9H), 3,29 (s, 3H), 4,97 (c, 1H), 6,67 (d, 1H), 7,2-7,5 (m, 5H), 8,04 (d, 1H), 8,66 (sa, 1H), 8,85 (d, 1H).
447	1,50 (d, 3H), 3,26 (s, 3H), 4,88 (sa, 2H), 4,93 (c, 2H), 6,33 (dd, 1H), 6,52 (dd, 1H), 7,07 (t, 1H), 7,2-7,5 (m, 4H), 8,84 (d, 1H).
448	1,47 (d, 3H), 2,89 (d, 3H), 3,23 (s, 3H), 4,94 (c, 2H), 5,78 (sa, 1H), 6,30 (dd, 1H), 6,51 (d, 1H), 7,19 (t, 1H), 7,24-7,43 (m, 5H), 8,84 (d, 1H).
449	2,11 (a, 6H), 2,84 (s, 3H), 2,92 (s, 3H), 6,68 (m, 1H), 6,96 (m, 1H), 7,27-7,44 (m, 4H), 7,49 (d, 1H).
450	2,11 (d, 6H), 2,91 (s, 3H), 6,74 (m, 1H), 6,97 (m, 1H), 7,29-7,51 (m, 3H), 7,67 (m, 1H), 8,82 (d, 1H).
451	2,1 6 (a, 6H), 2,81 (s, 3H), 2,92 (s, 3H), 6,65 (d, 1H), 6,98 (m, 1H), 7,26-7,42 (m, 3H), 7,50 (s, 1H).
452	1,38 (t, 3H), 2,11 (s, 6H), 3,08 (c, 2H), 6,76 (d, 1H), 6,98 (m, 1H), 7,30-7,38 (m, 2H), 7,47-7,54 (m, 2H), 7,70 (d, 1H), 8,84 (d, 1H).
453	1,99 (d, 3H), 2,95 (s, 3H), 5,20 (c, 1H), 6,84 (m, 1H), 7,23-7,55 (m, 5H), 7,78 (m, 1H), 8,83 (d, 1H).
a-2	1,67 (s, 6H), 6,00 (s, 1H), 7,54-7,61 (m, 2H), 7,66-7,74 (m, 2H), 8,1 4 (d, 1H), 8,38 (t, 1H), 8,80 (d, 1H).
a-7	1,66 (s, 6H), 2,81 (s, 3H), 6,02 (s, 1H), 7,19-7,43 (m, 6H), 8,40 (d, 1H).
a-8	1,65 (s, 6H), 5,96 (s, 1H), 7,25-7,39 (m, 3H), 7,48-7,58 (m, 3H), 8,41 (m, 1H), 8,85 (d, 1H).
b-1	1,18 (s, 6H), 1,50 (s, 6H), 1,75-1,93 (m, 4H), 2,73 (t, 2H), 2,84 (s, 1H), 2,89 (t, 2H), 6,82 (dd, 1H), 6,96 (d, 1H), 7,06-7,20 (m, 2H), 7,49 (dd, 1H), 8,10 (d, 1H).
b-3	1,27 (s, 6H), 1,60 (d, 6H), 1,76-1,94 (m, 4H), 2,49 (s, 1H), 2,74 (t, 2H), 2,90 (t, 2H), 6,62 (d, 1H), 6,79-6,86 (m, 1H), 6,97 (d, 1H), 7,06-7,1 5 (m, 1H), 8,1 0 (d, 1H).
b-4	1,19 (s, 6H), 1,50 (s, 6H), 2,11-2,21 (m, 2H), 2,83 (s, 1H), 2,90 (t, 2H), 2,95 (t, 2H), 6,81 (dd, 1H), 7,08-7,21 (m, 3H), 7,50 (dd, 1H), 8,08 (d, 1H).
b-5	1,19 (s, 6H), 1,50 (s, 6H), 1,62-1,73 (m, 4H), 1,83-1,90 (m, 2H), 2,70-2,73 (m, 2H), 2,92 (s, 1H), 3,00-3,04 (m, 2H), 6,84 (dd, 1H), 7,01 (d, 2H), 7,07-7,20 (m, 2H), 7,48 (dd, 1H), 8,00 (d, 1H).
b-6	1,76-1,95 (m, 4H), 2,59 (s, 3H), 2,75 (t, 2H), 2,91 (t, 2H), 6,63 (d, 1H), 6,88 (t, 1H), 7,03 (d, 1H), 7,24-7,32 (m, 1H), 8,16 (d, 1H).
b-7	1,74 (d, 6H), 1,74-1,95 (m, 4H), 2,76 (t, 2H), 2,92 (t, 2H), 4,26 (d, 1H), 6,55 (dd, 1H), 6,79-6,86 (m, 1H), 7,05 (d, 1H), 7,07-7,1 5 (m, 1H), 8,18 (d, 1H).
b-8	1,03 (s, 9H), 1,71 (d, 3H), 1,74-1,95 (m, 4H), 2,75 (t, 2H), 2,91 (t, 2H), 5,00 (s, 1H), 6,53 (d, 1H), 6,77-6,84 (m, 1H), 7,06 (s, 1H), 7,08-7,26 (m, 1H), 8,20 (d, 1H).
b-9	1,63 (d, 3H), 1,76-1,95 (m, 4H), 2,75 (t, 2H), 2,77-2,93 (m, 2H), 3,48 (s, 1H), 5,29-5,34 (m, 1H), 6,55 (d, 1H), 6,81 (dd, 1H), 7,03 (d, 1H), 7,13 (c, 1H), 8,1 6 (d, 1H).

Tabla 41

Compuesto N.º	RMN- ¹ H
b-10	1,59 (d, 3H), 1,65-1,94 (m, 4H), 2,74 (t, 2H), 2,90 (t, 2H), 3,27 (s, 3H), 4,90 (c, 1H), 6,62 (d, 1H), 6,84 (dd, 1H), 6,89 (d, 1H), 7,14-7,22 (m, 1H), 8,11 (d, 1H).
b-11	2,65 (s, 3H), 6,65 (d, 1H), 6,92 (t, 1H), 7,21 (d, 1H), 7,27-7,35 (m, 1H), 7,61 (d, 1H), 7,69 (d, 1H), 8,43 (d, 1H).
b-12	1,77 (d, 6H), 4,16 (d, 1H), 6,57 (d, 1H), 6,86 (dd, 1H), 7,09-7,18 (m, 1H), 7,20 (d, 1H), 7,61 (d, 1H), 7,69 (d, 1H), 8,44 (d, 1H).
b-13	1,17 (s, 6H), 1,53 (s, 6H), 2,92 (s, 3H), 2,92 (t, 2H), 3,41 (s, 1H), 3,48 (t, 2H), 6,78 (d, 1H), 6,91 (d, 1H), 6,92-7,15 (m, 2H), 7,42 (dd, 1H), 7,65 (d, 1H).
b-14	1,67 (d, 3H), 2,75 (dd, 1H), 5,31-5,41 (m, 1H), 6,58 (d, 1H), 6,87 (m, 1H), 7,12-7,21 (m, 2H), 7,61 (d, 1H), 7,67 (d, 1H), 8,44 (d, 1H).
b-15	1,59 (d, 3H), 3,29 (s, 3H), 4,93 (c, 1H), 6,65 (d, 1H), 6,90 (t, 1H), 7,07-7,25 (m, 2H), 7,58 (d, 1H), 7,64 (s, 1H), 0,41 (d, 1H).

ES 2 691 726 T3

b-16	1,06 (s, 9H), 1,75 (d, 3H), 4,93 (s, 1H), 6,54 (d, 1H), 6,84 (dd, 1H), 7,07-7,12 (m, 1H), 7,13 (d, 1H), 7,61 (d, 1H), 7,75 (d, 1H), 8,45 (d, 1H).
b-19	1,50 (s, 3H), 1,67 (s, 3H), 1,81-1,97 (m, 4H), 2,80 (m, 2H), 2,97 (m, 2H), 5,90 (s, 1H), 7,19-7,37 (m, 3H), 7,72 (m, 1H), 8,55 (d, 1H).
b-20	1,52 (s, 3H), 1,58 (s, 3H), 5,88 (s, 1H), 7,23-7,42 (m, 4H), 7,62 (d, 1H), 8,38 (d, 1H), 8,83 (d, 1H).
b-21	2,59 (s, 3H), 2,80 (t, 2H), 4,07 (t, 2H), 4,73 (s, 2H), 6,65 (d, 1H), 6,91 (t, 1H), 6,97 (d, 1H), 7,28-7,35 (m, 1H), 8,24 (d, 1H).
b-22	1,73 (d, 6H), 2,02 (s, 1H), 3,02 (t, 2H), 4,07 (t, 2H), 4,73 (s, 2H), 6,57 (d, 1H), 6,82-6,89 (m, 1H), 6,98 (d, 1H), 7,10-7,15 (m, 1H), 8,25 (d, 1H).
b-23	2,63 (s, 3H), 6,60 (d, 1H), 6,77 (d, 2H), 6,89 (t, 1H), 7,25-7,32 (m, 1H), 7,62 (d, 1H), 7,76 (d, 1H), 8,16 (d, 1H).

(Formulación)

- 5 Se muestran a continuación ejemplos del fungicida de acuerdo con la presente invención, sin embargo, los agentes de adición y la relación de adición no se limitan a estos ejemplos y es posible variarlos ampliamente. Además, las partes en los ejemplos de formulación representan partes en peso.

Ejemplo de formulación 1 - Polvo dispersable en agua		
El compuesto de acuerdo con la presente invención		40 partes
Arcilla		48 partes
Diocilsulfo succinato de sodio		4 partes
Lignina sulfonato de sodio		8 partes

- 10 Lo anterior se mezcló uniformemente y se pulverizó finamente para obtener un polvo dispersable en agua con un 40 % de activo ingrediente.

Ejemplo de formulación 2 - Emulsión		
El compuesto de acuerdo con la presente invención		10 partes
SORVESSO 200		53 partes
Ciclohexanona		26 partes
Dodecilbenceno sulfonato de potasio		1 parte
Alquilaliléter de polioxietileno		10 partes

Lo anterior se mezcló y se disolvió para obtener una emulsión con un 10 % de principio activo.

Ejemplo de formulación 3 - Polvo		
El compuesto de acuerdo con la presente invención		10 partes
Arcilla		90 partes

- 15 Lo anterior se mezcló uniformemente y se pulverizó finamente para obtener un polvo con un 10 % de principio activo.

Ejemplo de formulación 4 - Gránulo		
El compuesto de acuerdo con la presente invención		5 partes
Arcilla		73 partes
Bentonita		20 partes
Diocilsulfo succinato de sodio		1 parte
Fosfato de potasio		1 parte

- 20 Lo anterior se pulverizó bien, se mezcló y se amasó bien con una adición de agua, seguida de granulación y secado para obtener gránulos con un 5 % de principio activo.

Ejemplo de formulación 5 - Suspensión		
El compuesto de acuerdo con la presente invención		10 partes
Alquilaliléter de polioxietileno		4 partes
Policarboxilato de sodio		2 partes
Glicerina		10 partes
Goma xantana		0,2 partes
Agua		73,8 partes

Lo anterior se mezcló y se pulverizó en húmedo hasta que el diámetro de la partícula fue igual o inferior a 3 micrómetros. Para obtener una suspensión con un 10 % de principio activo.

Ejemplo de formulación 6 – Gránulo dispersable en agua

El compuesto de acuerdo con la presente invención	40 partes
Arcilla	36 partes
Cloruro de potasio	10 partes
Alquilbenceno sulfonato de sodio	1 parte
Lignina sulfonato de sodio	8 partes
Producto de condensación de formaldehído de alquilbenceno sulfonato de sodio	5 partes

- 5 Lo anterior se mezcló y se pulverizó finamente, seguido de la adición de una cantidad adecuada de agua y el amasado con ella para que tenga forma de arcilla. El material en forma de arcilla se granuló y se secó para obtener un gránulo dispersable en agua con un 40 % de principio activo.

(Ejemplo de ensayo biológico 1) Ensayo de control de sarna de manzana

- 10 A plántulas de manzana cultivadas en macetas de arcilla (Variedades "Ralls Janet", base de 3 a 4 hojas), se les pulverizó la emulsión del compuesto de acuerdo con la presente invención con un principio activo de concentración de 100 ppm. Después de secarse al aire a temperatura ambiente, se inoculó un conidio de la bacteria de la sarna (*Venturia inaequalis*) y se mantuvo durante 2 semanas en una habitación a 20 °C con humedad alta y con luz y oscuridad repetidas cada 12 horas. El efecto de control se determinó mediante la comparación del estado de la aparición de la lesión en las hojas con las no tratadas.

- 15 A los compuestos representados por los números de compuesto 3, 6, 7, 8, 10, 11, 12, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 24, 25, 26, 28, 29, 30, 31, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 40, 41, 43, 44, 45, 46, 48, 49, 52, 53, 54, 57, 59, 60, 61, 62, 63, 64, 65 y 66, se les realizó el ensayo de control de sarna de manzana. Como resultado, todos los compuestos mostraron al menos un 75 % de valor protector.

- 20 Además, se realizó el mismo ensayo para los compuestos representados por los números de compuesto 67, 68, 70, 73, 74, 75, 76, 77, 78, 79, 80, 82, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 90, 91, 92, 93, 94, 95, 96, 97, 98, 100, 101, 102, 103, 104, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 113, 114, 115, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 128, 131, 132, 133, 134, 135, 136, 137, 138, 140, 141, 142, 143, 144, 145, 146, 147, 148, 149, 150, 151, 152, 156, 157, 158, 159, 160, 161, 162, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 175, 176, 177, 178, 179, 180, 181, 182, 183, 184, 185, 186, 187, 188, 190, 192, 193, 194, 195, 196, 197, 198, 199, 200, 201, 202, 203, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 215, 217, 218, 219, 220, 221, 222, 223, 224, 225, 227, 228, 229, 230, 231, 232, 233, 234, 235, 236, 237, 238, 239, 240, 242, 243, 244, 245, 247, 248, 249, 250, 251, 252, 253, 254, 255, 256, 257, 258, 259, 260, 261, 262, 263, 264, 265, 266, 267, 268, 269, 270, 271, 272, 273, 274, 276, 277, 278, 279, 280, 281, 283, 284, 285, 288, 289, 290, 291, 292, 293, 294, 295, 297, 298, 299, 300, 306, 308, 309, 310, 311, 314, 315, 316, 317, 318, 319, 320, 321, 322, 323, 324, 325, 327, 328, 329, 330, 331, 332, 333, 334, 335, 344, 347, 348, 349, 350, 353, 354, 355, 356, 357, 358, 359, 360, 361, 362, 363, 364, 365, 366, 367, 368, 369, 370, 371, 372, 373, 374, 375, 376, 377, 378, 379, 380, 381, 382, 383, 384, 385, 386, 387, 388, 389, 390, 391, 392, 393, 394, 395, 396, 398, 399, 400, 402, 403, 404, 406, 407, 408, 409, 410, 411, 412, 413, 414, 416, 417, 418, 419, 423, 424, 425, 426, 427, 428, 429, 430, 431, 432, 433, 434, 435, 437, 439, 440, 441, 442, 443, 445, a-2, a-3, a-4, a-5, a-6, a-7, a-8, a-9, a-10, b-1, b-2, b-3, b-4, b-5, b-6, b-7, b-8, b-9, b-10, b-11, b12, b-13, b-14, b-15, b-16, b-17, b-20, b-22, b-23, b-24, c-2, c-3, c-4, c-5, d-5 y d-6. Como resultado, todos los compuestos mostraron al menos un 75 % de valor protector.

- 40 (Ejemplo de ensayo biológico 2) Ensayo de control de moho gris de pepino

- 45 A plántulas de pepino cultivadas en macetas de arcilla (Variedades "Cucumis sativus L.", base de cotiledón), se les pulverizó la emulsión del compuesto de acuerdo con la presente invención con principio activo de concentración de 100 ppm. Después de secarse al aire a temperatura ambiente, se inoculó gota a gota una suspensión de conidio de bacterias del moho gris del pepino (*Botrytis cinerea*) y se mantuvo durante 4 días en una habitación oscura a 20 °C con humedad alta. El efecto de control se determinó mediante la comparación del estado de la aparición de la lesión en las hojas con las no tratadas.

- 50 A los compuestos representados por los números de compuesto 10, 11, 12, 15, 18, 19, 22, 26, 29, 30, 31, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 42, 43, 44, 48, 49, 54, 57 y 59, se les realizó un ensayo de control de moho gris de pepino. Como resultado, todos los compuestos mostraron al menos un 75 % de valor protector.

- 55 Además, se realizó el mismo ensayo para los compuestos representados por los números de compuesto 67, 73, 75, 76, 77, 80, 81, 82, 83, 86, 88, 89, 90, 92, 93, 94, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 101, 102, 104, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 113, 114, 116, 117, 118, 119, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 128, 133, 134, 138, 139, 140, 141, 142, 143, 144, 145, 146, 147, 148, 149, 150, 151, 152, 153, 156, 157, 158, 159, 160, 162, 163, 164, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 175, 176, 177, 178, 179, 180, 181, 183, 184, 185, 186, 187, 188, 192, 197, 198, 199, 200, 201, 202,

203, 205, 208, 209, 210, 219, 220, 221, 222, 223, 225, 227, 228, 229, 230, 231, 232, 233, 234, 235, 236, 237, 238, 239, 240, 241, 242, 243, 244, 245, 246, 247, 248, 249, 250, 251, 252, 253, 254, 255, 256, 257, 258, 259, 260, 261, 262, 263, 264, 265, 266, 267, 268, 269, 270, 271, 272, 274, 275, 278, 281, 284, 285, 291, 292, 293, 295, 296, 297, 298, 299, 308, 309, 310, 311, 314, 315, 316, 317, 318, 319, 323, 324, 325, 326, 327, 328, 332, 333, 338, 340, 344, 348, 353, 355, 359, 360, 361, 363, 364, 365, 371, 375, 377, 378, 379, 380, 381, 382, 386, 391, 392, 393, 395, 397, 398, 399, 402, 403, 405, 406, 412, 414, 416, 417, 418, 423, 424, 425, 426, 427, 428, 429, 431, 432, 433, 434, 435, 436, 437, 439, 440, 441, 442, 444, a-2, a-5, a-6, a-7, a-8, a-10, b-1, b-2, b-3, b-7, b-8, b-12, b-16, c-3 y c-4. Como resultado, todos los compuestos mostraron al menos un 75 % de valor protector.

10 (Ejemplo de ensayo biológico 3) Ensayo de aplicación sumergida en podredumbre del cuello del arroz

A plántulas de arroz cultivadas en macetas en las que la preparación comercial está disponible en una condición sumergida (variedades "koshihikari", base de 1 hoja) y la emulsión del compuesto de acuerdo con la presente invención con principio activo de concentración de 400 ppm se trató por goteo en la superficie del agua. Después de 2 días, se inoculó por pulverización una suspensión de conidios de la bacteria de la podredumbre del cuello del arroz (*Magnaporthe grisea*), se mantuvo durante 2 días en una habitación oscura a 25 °C con humedad alta y después se mantuvo durante 8 días en una habitación a 25 °C, con la luz y la oscuridad repitiéndose cada 12 horas. El efecto de control se decidió mediante los siguientes grados después de comparar el estado de la aparición de la lesión en las hojas con el de las no tratadas.

- A (valor de protección de al menos el 60 %)
- B (valor de protección de al menos el 40 % pero inferior al 60 %)

Como resultado del presente ensayo, el efecto de control de los siguientes compuestos se evaluó como A.

Número de compuesto: 5, 20, 21, 23, 25, 28, 32, 33, 34, 36, 37, 38, 43, 44, 48, 58, 66, 70, 71, 73, 78, 84, 85, 88, 89, 90, 106, 107, 227, 228, 234, 236, 260, 262, 348, 353, 356, 358, 375, 376, 401, 402, a-6.

Además, el efecto de control de los siguientes compuestos se evaluó como B.

Número de compuesto: 1, 3, 7, 12, 13, 22, 46, 54, 55, 75, 95, 98, 139, 151, 261, 359, 360, b-1.

(Ejemplo de ensayo biológico 4) Ensayo de aplicación sumergida en podredumbre del cuello del arroz

A plántulas de arroz cultivadas en macetas en las que la preparación comercial está disponible en una condición sumergida (variedades "koshihikari", base de 1 hoja) y la emulsión del compuesto de acuerdo con la presente invención con principio activo de concentración de 400 ppm se trató por goteo en la superficie del agua. Después de 2 días, se inoculó por pulverización una suspensión de conidios de la bacteria de la podredumbre del cuello del arroz (*Magnaporthe grisea*), se mantuvo durante 2 días en una habitación oscura a 25 °C con humedad alta y después se mantuvo durante 8 días en una habitación a 25 °C, con la luz y la oscuridad repitiéndose cada 12 horas. El efecto de control se decidió mediante los siguientes grados después de comparar el estado de la aparición de la lesión en las hojas con el de las no tratadas.

- A (valor de protección de al menos el 60 %)
- B (valor de protección de al menos el 40 % pero inferior al 60 %)

Como resultado del presente ensayo, el efecto de control de los siguientes compuestos se evaluó como A.

Número de compuesto: 21, 36, 37, 38, 43, 44, 48, 84, 88, 89, 95, 106, 109, 125, 262, 266, 267, 292, 350, 375, a-6

Además, el efecto de control del siguiente compuesto se evaluó como B.

Número de compuesto: 236

(Ejemplo de ensayo biológico 5) Ensayo de tratamiento en semilla de marchitamiento de pepino

Se trataron semillas de pepino (variedades "*Cucumis sativus L.*") contaminadas por bacterias de marchitamiento de pepino (*Fusarium oxisporum*) con la emulsión del compuesto de acuerdo con presente invención para obtener las semillas que contienen 1 g/kg de principio activo. Las semillas se sembraron y, después de 3 semanas, se determinó el efecto de control comparando el grado de aparición de la enfermedad con el de las no tratadas.

Como resultado, los siguientes compuestos mostraron un excelente valor protector de al menos el 75 %.

Número de compuesto: 18, 36, 37, 43, 44, 48, 77, 81, 83, 88, 92, 94, 100, 103, 109, 126, 225, 227, 228, 234, 235, 241, 242, 243, 244, 252, 258, 266, 268, 298, 395, 397, 425, 435, a-6, a-7, a-8, b-8, b-12, c-4

(Ejemplo de ensayo biológico 6) Ensayo de tratamiento en semilla de marchitamiento de pepino

Se trataron semillas de pepino (variedades "*Cucumis sativus L.*") con la emulsión del compuesto de acuerdo con la presente invención para obtener las semillas que contienen 1 g/kg de principio activo. Las semillas se sembraron en un suelo contaminado por bacterias del marchitamiento del pepino (*Fusarium oxisporum*) y, después de 3 semanas,

ES 2 691 726 T3

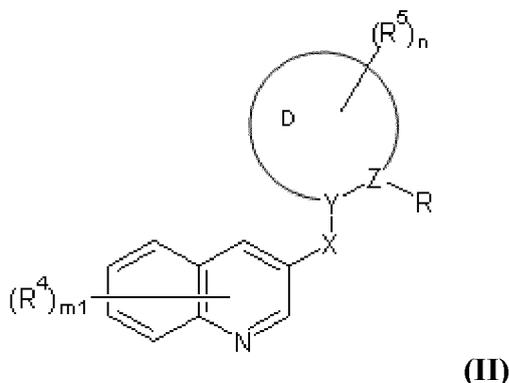
se determinó el efecto de control comparando el grado de aparición de la enfermedad con el de las no tratadas.

Como resultado, los siguientes compuestos mostraron un excelente valor protector de al menos el 75 %.

Número de compuesto: 17, 18, 31, 33, 34, 35, 36, 37, 43, 86, 88, 96, 97, 100, 109, 227, 232, 239, 242, 243, 244,
5 262, 265, 268, 295, 296, 375, 428, a-7, b-1.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno representado por la Fórmula (II):



5

en la que, en la Fórmula (II), R representa un grupo representado por CR¹R²R³, un grupo arilo C₆₋₁₀ sin sustituir o sustituido o un grupo ciano;

10

de R¹ a R³ representan cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo alquenilo C₂₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo alquinilo C₂₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalquilo C₃₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalquenilo C₄₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo arilo C₆₋₁₀ sin sustituir o sustituido, un grupo heterocíclico sin sustituir o sustituido, un grupo acilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo (1-imino)alquilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo carboxilo sin sustituir o sustituido, un grupo carbamoilo sin sustituir o sustituido, un grupo hidroxilo sin sustituir o sustituido, un grupo amino sin sustituir o sustituido, un grupo mercapto sin sustituir o sustituido, un grupo sulfonilo sustituido, un grupo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro;

15

excepto donde: de R¹ a R³ son todos átomos de hidrógeno; de R¹ a R³ son todos grupos alquilo C₁₋₈ sin sustituir; uno cualquiera de R¹ a R³ es un átomo de hidrógeno y los dos restantes son ambos grupos alquilo C₁₋₈ sin sustituir; y, uno cualquiera de R¹ a R³ es un grupo alquilo C₁₋₈ sin sustituir y los dos restantes son ambos átomos de hidrógeno;

20

R⁴ representa cada uno independientemente un grupo alquilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo alquenilo C₂₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo alquinilo C₂₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalquilo C₃₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalquenilo C₄₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo arilo C₆₋₁₀ sin sustituir o sustituido, un grupo heterocíclico sin sustituir o sustituido, un grupo acilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo (1-imino)alquilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo carboxilo sin sustituir o sustituido, un grupo carbamoilo sin sustituir o sustituido, un grupo hidroxilo sin sustituir o sustituido, un grupo amino sin sustituir o sustituido, un grupo mercapto sin sustituir o sustituido, un grupo sulfonilo sustituido, un grupo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro;

25

m₁ representa un número de R⁴ y es un número entero de 0 a 6;

30

R⁵ representa cada uno independientemente un grupo alquilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo alquenilo C₂₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo alquinilo C₂₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalquilo C₃₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalquenilo C₄₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo arilo C₆₋₁₀ sin sustituir o sustituido, un grupo heterocíclico sin sustituir o sustituido, un grupo acilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo (1-imino)alquilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo carboxilo sin sustituir o sustituido, un grupo carbamoilo sin sustituir o sustituido, un grupo hidroxilo sin sustituir o sustituido, un grupo amino sin sustituir o sustituido, un grupo mercapto sin sustituir o sustituido, un grupo sulfonilo sustituido, un grupo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro;

35

n representa un número de R⁵ y es un número entero de 0 a 5;

40

D representa un anillo de hidrocarburo aromático de 5 a 7 miembros que incluye tanto Y como Z o un anillo heterocíclico aromático de 5 a 7 miembros que incluye tanto Y como Z;

X representa un átomo de oxígeno;

Y representa un átomo de carbono o un átomo de nitrógeno; y

Z representa un átomo de carbono o un átomo de nitrógeno,

45

el grupo alquilo C₁₋₈ sustituido es un grupo cicloalquil C₃₋₆ alquilo C₁₋₆, un grupo cicloalquienil C₄₋₆ alquilo C₁₋₆, un grupo haloalquilo C₁₋₆, un grupo aril C₆₋₁₀ alquilo C₁₋₆, un grupo heteroaril alquilo C₁₋₆ de 5 a 6 miembros, un grupo hidroxil alquilo C₁₋₆, un grupo alcoxi C₁₋₆ alquilo C₁₋₆, un grupo aciloxi C₁₋₇ alquilo C₁₋₆, un grupo tri alquilsililoxi C₁₋₆ alquilo C₁₋₆, un grupo arilsulfoniloxi C₆₋₁₀ alquilo C₁₋₆ sustituido con alquilo C₁₋₆, un grupo ciano alquilo C₁₋₆, un grupo acil C₁₋₆ alquilo C₁₋₆, un grupo 2-hidroxiimino alquilo C₂₋₆, un grupo formil alquilo C₁₋₆, un grupo carboxi alquilo C₁₋₆, un grupo alcocixarbonil C₁₋₆ alquilo C₁₋₆ o un grupo azido alquilo C₁₋₆,

50

el grupo alquenilo C₂₋₈ sustituido es un grupo haloalquenilo C₂₋₆ o un grupo hidroxil alquenilo C₂₋₆,

el grupo alquinilo C₂₋₈ sustituido es un grupo haloalquinilo C₂₋₆,

el grupo cicloalquilo C₃₋₈ sustituido es un grupo cicloalquilo C₃₋₆ en el que de 1 a 3 grupos alquilo C₁₋₆ están sustituidos,

el grupo cicloalqueno C₄₋₈ sustituido es un grupo cicloalqueno C₄₋₆ en el que de 1 a 3 grupos alquilo C₁₋₆ están sustituidos,

el grupo arilo C₆₋₁₀ sustituido es un grupo arilo C₆₋₁₀ sustituido con alquilo C₁₋₆, un grupo arilo C₆₋₁₀ sustituido con halógeno, o un grupo arilo sustituido con alcoxi C₁₋₆,

el grupo heterocíclico sustituido es un grupo 4-cloro-2-piridinilo, un grupo 3-cloro-2-pirazinilo, un grupo 4-metil-2-piridinilo, un grupo 5-trifluorometil-2-pirimidinilo, un grupo 3-metil-2-quinolilo,

el grupo acilo C₁₋₈ sustituido es un grupo haloacilo C₁₋₇,

el grupo (1-imino)alquilo C₁₋₈ sustituido es un grupo (1-(alcoxi C₁₋₆)imino)alquilo C₁₋₆ alquilo,

el grupo carboxilo sustituido es un grupo alcocarbonilo C₁₋₆, un grupo alqueniloxycarbonilo C₂₋₆, un grupo alquiniloxycarbonilo C₂₋₆, un grupo ariloxycarbonilo C₆₋₁₀ o un grupo aril C₆₋₁₀ alcocarbonilo C₁₋₆,

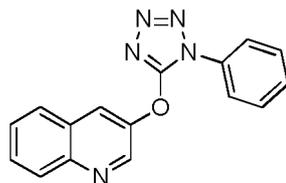
el grupo carbamoilo sustituido es un grupo mono alquilcarbamoilo C₁₋₆, un grupo di alquilcarbamoilo C₁₋₆ o un grupo mono arilcarbamoilo C₆₋₁₀,

el grupo hidroxilo sustituido es un grupo alcoxi C₁₋₆, un grupo cicloalquil C₃₋₈ alcoxi C₁₋₆, un grupo aril C₆₋₁₀ alcoxi C₁₋₆, un grupo haloalcoxi C₁₋₆, un grupo alqueniloxi C₂₋₆, un grupo alquiniloxi C₂₋₆, un grupo cicloalquiloxi C₃₋₆, un grupo ariloxi C₆₋₁₀, un grupo aril C₆₋₁₀ alquiloxi C₁₋₆, un grupo aciloxi C₁₋₇, un grupo alcocarbonil C₁₋₆ alcoxi C₁₋₆ o un grupo tri alquilsililoxi C₁₋₆,

el grupo amino sustituido es un grupo mono alquilamino C₁₋₆, un grupo di alquilamino C₁₋₆, un grupo mono alquilidenamino C₁₋₆, un grupo mono arilamino C₆₋₁₀, un grupo di arilamino C₆₋₁₀, un grupo aril C₆₋₁₀ alquilamino C₁₋₆, un grupo acilamino C₁₋₆ o un grupo alcocarbonilamino C₁₋₆,

el grupo mercapto sustituido es un grupo alquiltio C₁₋₆ o un grupo ariltio C₁₋₆ o un grupo aciltio C₁₋₆, y el grupo sulfonilo sustituido es un grupo alquilsulfonilo C₁₋₆, un grupo haloalquilsulfonilo C₁₋₆, un grupo arilsulfonilo C₆₋₁₀, un grupo alcóxilsulfonilo C₁₋₆, un grupo mono alquilsulfamoilo C₁₋₆, un grupo di alquilsulfamoilo C₁₋₆ o un grupo mono arilsulfamoilo C₆₋₁₀, o una sal del mismo, o un compuesto de N-óxido del mismo,

a condición de que dicho compuesto no sea:



2. Un compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno, una sal del mismo, o un compuesto de N-óxido del mismo, de acuerdo con la reivindicación 1, en el que, en la Fórmula (II), R representa un grupo representado por CR¹R²R³, y

R¹ es un grupo hidroxilo sin sustituir o sustituido, R² es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido; y R³ es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo alquenilo C₂₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo alquinilo C₂₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalquilo C₃₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo arilo C₆₋₁₀ sin sustituir o sustituido, un grupo heterocíclico sin sustituir o sustituido, un grupo acilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo (1-imino)alquilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo alcocarbonilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo hidroxilo sin sustituir o sustituido o un grupo ciano;

R⁴ representa un grupo alquilo C₁₋₆, un grupo haloalquilo C₁₋₆, un grupo alquenilo C₂₋₆, un grupo cicloalquilo C₃₋₈, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi C₁₋₆ o un grupo halógeno,

R⁵ representa un grupo alquilo C₁₋₆, un grupo haloalquilo C₁₋₆, un grupo aril C₆₋₁₀ alquilo C₁₋₆, un grupo cicloalquilo C₃₋₈, un grupo arilo C₆₋₁₀, un grupo acilo C₁₋₇, un grupo alcocarbonilo C₁₋₆, un grupo alcoxi C₁₋₆, un grupo amino, un

grupo mono alquilamino C₁₋₆, un grupo di alquilamino C₁₋₆, un grupo alcocarbonilamino C₁₋₆, un grupo alquiltio C₁₋₆, un grupo alquilsulfonilo C₁₋₆, un grupo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro,

Y y Z son ambos un átomo de carbono,

D es un anillo aromático que incluye tanto Y como Z, y

X representa un átomo de oxígeno.

3. Un compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno, una sal del mismo, o un compuesto de N-óxido del mismo, de acuerdo con la reivindicación 1, en el que, en la Fórmula (II), R representa un grupo representado por CR¹R²R³, y

R¹ es un grupo alquilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido, R² es un grupo alquilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido; y R³ es un grupo alquilo C₁₋₈ sustituido, un grupo alquenilo C₂₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo alquinilo C₂₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo cicloalquilo C₃₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo arilo C₆₋₁₀ sin sustituir o sustituido, un grupo heterocíclico sin sustituir o sustituido, un grupo acilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo (1-imino)alquilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo alcocarbonilo C₁₋₈ sin sustituir o sustituido, un grupo carbamoilo sin sustituir o sustituido, un grupo sulfonilo sin sustituir o sustituido, o un grupo ciano;

R⁴ representa un grupo alquilo C₁₋₆, un grupo haloalquilo C₁₋₆, un grupo alquenilo C₂₋₆, un grupo cicloalquilo C₃₋₈, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi C₁₋₆ o un grupo halógeno,

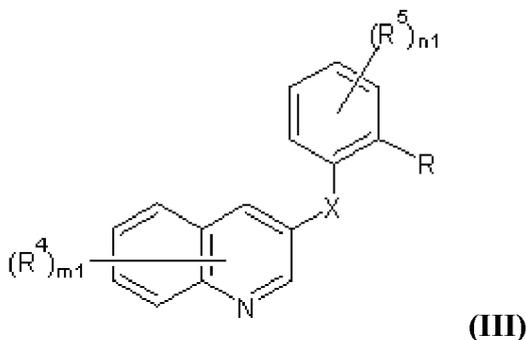
R⁵ representa un grupo alquilo C₁₋₆, un grupo haloalquilo C₁₋₆, un grupo aril C₆₋₁₀ alquilo C₁₋₆, un grupo cicloalquilo C₃₋₈, un grupo arilo C₆₋₁₀, un grupo acilo C₁₋₇, un grupo alcocarbonilo C₁₋₆, un grupo alcoxi C₁₋₆, un grupo amino, un

grupo mono alquilamino C₁₋₆, un grupo di alquilamino C₁₋₆, un grupo alcocarbonilamino C₁₋₆, un grupo alquiltio C₁₋₆, un grupo alquilsulfonilo C₁₋₆, un grupo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro,

Y y Z son ambos un átomo de carbono,

D es un anillo aromático que incluye tanto Y como Z, y X representa un átomo de oxígeno.

4. Un compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno, una sal del mismo, o un compuesto de N-óxido del mismo, de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en el que el compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno se representa por la Fórmula (III):



- 10 en la que cada uno de R, R⁴, R⁵, m1 y X representan el mismo significado que los de la Fórmula (II); y n1 representa un número de R⁵ y es un número entero de 0 a 4.

5. Un compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno, una sal del mismo, o un compuesto de N-óxido, de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, elegido de la lista que consiste en 2-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-fenil]-3,3-dimetil-butan-2-ol, 2-[2-fluoro-6-(8-fluoroquinolin-3-iloxi)-fenil]-propan-2-ol, 2-[2-fluoro-6-(8-fluoro-2-metilquinolin-3-iloxi)-fenil]-propan-2-ol o 2-[2-fluoro-6-(7,8-difluoro-2-metilquinolin-3-iloxi)-fenil]-propan-2-ol.

6. Un fungicida agrícola que comprende, como principio activo, al menos uno seleccionado entre el grupo que consiste en el compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno, la sal del mismo, y el compuesto de N-óxido del mismo, de una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5.

7. El uso de un fungicida agrícola de la reivindicación 6 para tratar semillas.