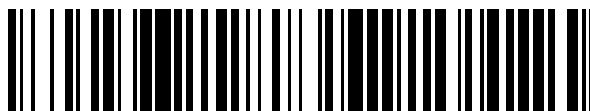


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 708 678**

51 Int. Cl.:

<b>C07C 275/64</b>	(2006.01)	<b>A61K 31/415</b>	(2006.01)
<b>A01N 47/34</b>	(2006.01)	<b>A61K 31/4196</b>	(2006.01)
<b>A01P 7/02</b>	(2006.01)	<b>A61K 31/42</b>	(2006.01)
<b>A61K 31/17</b>	(2006.01)	<b>A61K 31/421</b>	(2006.01)
<b>A61K 31/197</b>	(2006.01)	<b>A61K 31/4245</b>	(2006.01)
<b>A61K 31/216</b>	(2006.01)	<b>A61K 31/426</b>	(2006.01)
<b>A61K 31/277</b>	(2006.01)	<b>A61K 31/44</b>	(2006.01)
<b>A61K 31/341</b>	(2006.01)	<b>A61K 31/4402</b>	(2006.01)
<b>A61K 31/381</b>	(2006.01)	<b>A61K 31/4406</b>	(2006.01)
<b>A61K 31/41</b>	(2006.01)	<b>A61K 31/4409</b>	(2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **06.10.2011 PCT/JP2011/073082**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **19.04.2012 WO12050041**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **06.10.2011 E 11832476 (3)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **05.12.2018 EP 2628724**

54 Título: **Compuesto de ariloxiurea y agente de control de plagas**

30 Prioridad:

**12.10.2010 JP 2010229617**

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

**10.04.2019**

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

**FURUKAWA, HIRONORI;  
NAKAMURA, TAKEHIKO;  
TAMAI, TETSUO y  
HANAI, DAISUKE**

74 Agente/Representante:

**VALLEJO LÓPEZ, Juan Pedro**

**ES 2 708 678 T3**

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

**DESCRIPCIÓN**

Compuesto de ariloxiurea y agente de control de plagas

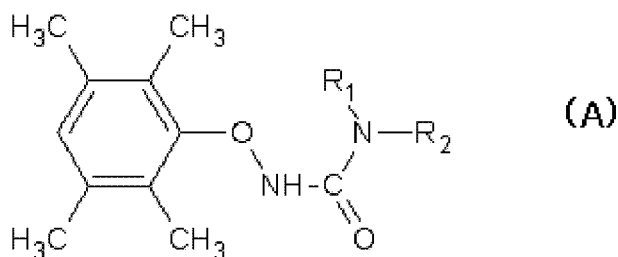
**5 Campo técnico**

La presente invención se refiere a un agente de control de plagas novedoso. Más específicamente, la presente invención se refiere a un compuesto de ariloxiurea, que es superior en actividad acaricida y/o actividad fungicida, superior en propiedades y seguridad, y que puede sintetizarse industrial y ventajosamente, y un acaricida y/o fungicida que incluye el compuesto de ariloxiurea como principio activo.

**Antecedentes de la técnica**

Los compuestos representados por las fórmulas (A) a (E), que son estructuralmente relevantes para el compuesto de la presente invención, se describen en los Documentos de patente 1 a 5.

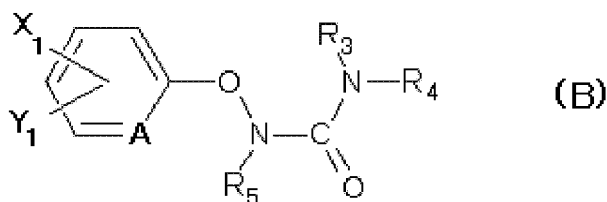
[Fórmula química 1]



20 En la fórmula, R<sub>1</sub> representa un grupo alquilo C1-6.

R<sub>2</sub> representa un átomo de hidrógeno.

25 [Fórmula química 2]



30 En la fórmula, X<sub>1</sub> representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o similares.

Y<sub>1</sub> representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o similares.

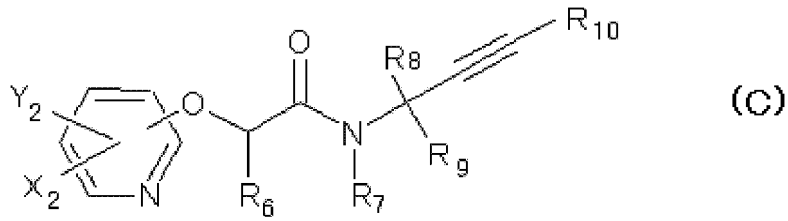
R<sub>3</sub> representa un grupo fenilo o similares.

35 R<sub>4</sub> representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo inferior o similares.

R<sub>5</sub> representa un átomo de hidrógeno.

A representa un átomo de carbono o un átomo de nitrógeno.

40 [Fórmula química 3]



En la fórmula, X<sub>2</sub> representa un átomo de hidrógeno, átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-8 o similares.

5 Y<sub>2</sub> representa un átomo de hidrógeno, átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-8 o similares.

R<sub>6</sub> representa un grupo fenilo, grupo ciano, grupo alquilo C1-4 o similares.

R<sub>7</sub> representa un átomo de hidrógeno, grupo alquilo C1-4 o similares.

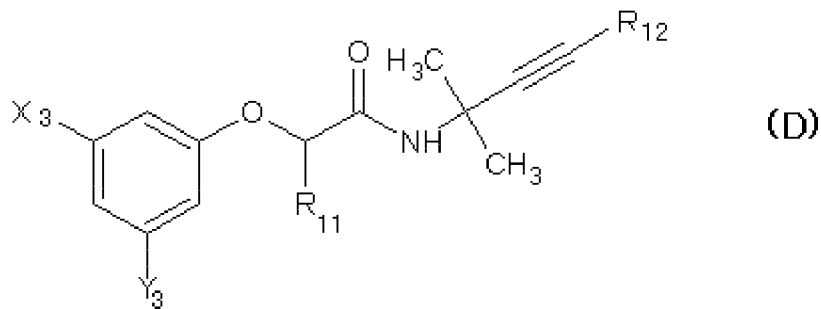
10

R<sub>8</sub> y R<sub>9</sub> representan cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-3 o similares.

R<sub>10</sub> representa un átomo de halógeno, grupo alquilo C1-4 o similares.

15

[Fórmula química 4]



En la fórmula, X<sub>3</sub> representa un átomo de cloro, átomo de bromo o grupo metilo.

20

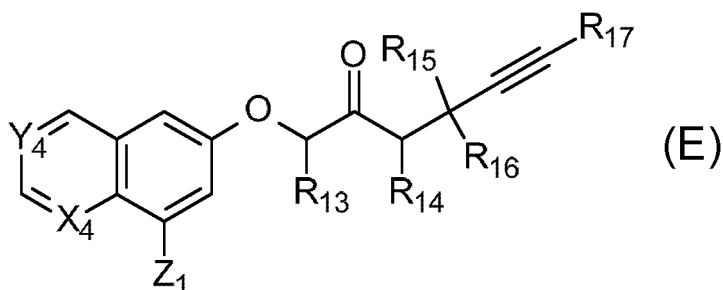
Y<sub>3</sub> representa un átomo de cloro, átomo de bromo o grupo metilo.

R<sub>11</sub> representa un grupo etilo o un grupo n-propilo.

25

R<sub>12</sub> representa un grupo etilo.

[Fórmula química 5]



30

En la fórmula, uno de X<sub>4</sub> e Y<sub>4</sub> representa un átomo de nitrógeno u óxido de nitrógeno, y el otro representa CR (en la que R representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o similares), o tanto X<sub>4</sub> como Y<sub>4</sub> representan un átomo de nitrógeno.

35

Z<sub>1</sub> representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o similares.

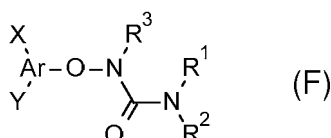
R<sub>13</sub> representa un grupo alquilo, grupo alquenilo o similares.

R<sub>14</sub> representa un grupo benciloximetilo, en el que el anillo de fenilo del resto bencilo está opcionalmente sustituido con un grupo alcoxi C1-4.

5 R<sub>15</sub> y R<sub>16</sub> representan cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-3 o similares, con la condición de que no representen simultáneamente átomos de hidrógeno, y cuando ambos no sean átomos de hidrógeno, el número combinado de átomos de carbono no exceda de 4.

R<sub>17</sub> representa un grupo alquilo C1-4, un grupo cicloalquilo C3-6 o similares.

10 Los compuestos representados por las fórmulas (F) a (G) que son estructuralmente relevantes para el compuesto de la presente invención, se describen en los Documentos de patente 6 a 7.



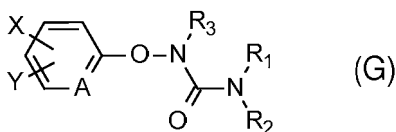
15 En la fórmula, R<sup>1</sup> es hidrógeno, alquilo, alquenoilo, alquinilo o cicloalquilo;

R<sup>2</sup> es hidrógeno o alquilo;

R<sup>3</sup> es -COR<sup>4</sup>, -CH<sub>2</sub>OR<sup>5</sup> o alquilo, donde R<sup>4</sup> es hidrógeno, alquilo u otros grupos, y R<sup>5</sup> es hidrógeno o alquilo;

Ar es fenilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo y pirazinilo;

20 X e Y son hidrógeno, halógeno, ciano, nitro y otros grupos.



En la fórmula, A es CH o N;

25

R<sub>1</sub> incluye alquilo sustituido, y arilo sustituido;

R<sub>2</sub> incluye hidrógeno y alquilo;

o juntos R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> pueden formar un anillo, tal como un anillo de indolina;

R<sub>3</sub> incluye hidrógeno, alcoxicarbonilo y acilo;

30

X e Y incluyen halo, haloalquilo, y alcoxi.

El Documento de patente 8 describe métodos para preparar derivados de acil urea que poseen un grupo arilo que contiene nitrógeno.

35 Bibliografía de la técnica anterior

Documentos de patente

40 Documento de patente 1: Publicación de Solicitud de Patente Japonesa Sin Examinar N.º Sho 61-126065

Documento de patente 2: Publicación de Solicitud de Patente Japonesa Sin Examinar N.º Hei 1-131146

Documento de patente 3: Publicación de Solicitud de Patente Japonesa Sin Examinar N.º 2005-517642

Documento de patente 4: Publicación de Solicitud de Patente Japonesa Sin Examinar N.º 2006-507338

Documento de patente 5: Publicación de Solicitud de Patente Japonesa Sin Examinar N.º 2006-507339

Documento de patente 6: EP 270.683.

45

Documento de patente 7: JP 1131146.

Documento de patente 8: Documento WO 2005/035508

### Divulgación de la invención

50 Problemas a resolver por la invención

El objetivo de la presente invención es proporcionar un agente de control de plagas novedoso, particularmente, un acaricida y/o fungicida que incluye como principio activo un compuesto de ariloxiurea, que es superior en actividad acaricida y/o actividad fungicida, superior en propiedades y seguridad, y que se puede sintetizar industrial y ventajosamente.

55

Medios para resolver los problemas

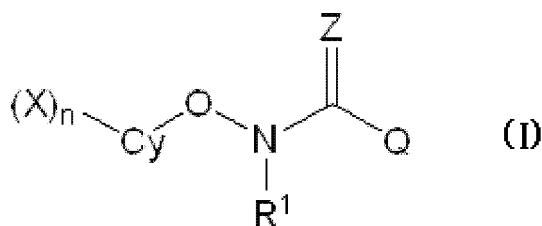
Para conseguir los objetivos anteriores, los presentes inventores realizaron estudios exhaustivos y, como resultado, descubrieron que un compuesto de ariloxiurea, o una sal del mismo que tiene una estructura específica, demuestra una actividad acaricida y/o una actividad fungicida superiores, puede usarse como un principio activo de un acaricida y/o fungicida, y es superior en propiedades y seguridad.

La presente invención se logró sobre la base de esta percepción.

Concretamente, la presente invención es como se indica a continuación:

(1) Un compuesto de ariloxiurea representado por la fórmula (I), o una sal del mismo.

[Fórmula química 6]



En la fórmula (I). Cy representa un grupo arilo C6-10, o un grupo heteroarilo.

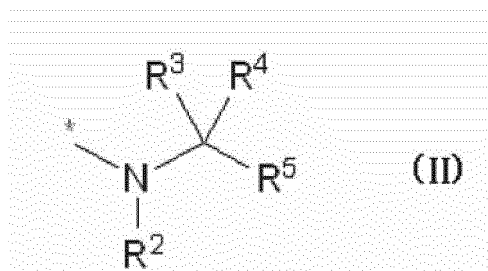
X representa un grupo alquilo C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo cicloalquilo C3-8 sin sustituir o sustituido, grupo alqueno C2-6 sin sustituir o sustituido, grupo alquino C2-6 sin sustituir o sustituido, grupo hidroxilo, grupo alcoxi C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo amino, grupo alquil amino C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo acilo C1-7 sin sustituir o sustituido, grupo alcoxycarbonilo C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo alquil sulfonilo C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo alcoxisulfonilo C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo arilo C6-10 sin sustituir o sustituido, grupo heteroarilo sin sustituir o sustituido, grupo hidroximino alquilo C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo nitro, grupo ciano, o un átomo de halógeno.

n representa el número de X unidos a Cy y representa un número entero de 0 a 5. Cuando n es 2 o más. X puede ser igual o diferente entre sí, y cuando n es 2 o más. X puede unirse entre sí para formar un anillo junto con los átomos de carbono o átomos de nitrógeno unidos al mismo.

R<sup>1</sup> representa un grupo alquilo C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo alqueno C2-6 sin sustituir o sustituido, o un alquino C1-6 sin sustituir o sustituido

Q representa un grupo representado por la fórmula (II)

[Fórmula química 7]



En la fórmula (II), \* representa la posición de enlace. R<sup>2</sup> representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo alqueno C2-6 sin sustituir o sustituido, grupo alquino C2-6 sin sustituir o sustituido, grupo acilo C1-7 sin sustituir o sustituido, o un grupo alcoxycarbonil C1-6 sin sustituir o sustituido, R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> pueden unirse juntos para formar un grupo alqueno C2-4 sin sustituir o sustituido.

R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> representan cada uno independientemente un grupo alquilo C1-6 sin sustituir o sustituido

R<sup>5</sup> representa un grupo aminocarbonilo sin sustituir o sustituido, grupo arilo C6-10 sin sustituir o sustituido, o un grupo heteroarilo sin sustituir o sustituido,

5

Z representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre.

(3) Un agente de control de plagas, que comprende al menos uno del compuesto de ariloxiurea o una sal del mismo, de acuerdo con (1) o (2) como un principio activo.

10

(4) Un acaricida, que comprende al menos uno del compuesto de ariloxiurea o una sal del mismo, de acuerdo con (1) o (2) como un principio activo.

(5) Un fungicida, que comprende al menos uno del compuesto de ariloxiurea o una sal del mismo, de acuerdo con (1) o (2) como un principio activo.

15 [Efectos de la invención]

El compuesto de ariloxiurea, o una sal del mismo de acuerdo con la presente invención, puede proteger los cultivos agrícolas contra una infección por organismos nocivos. Además, también tiene aplicaciones de higiene. Particularmente, el compuesto de la presente invención es capaz de reducir eficazmente la infección por ácaros y/o patógenos de plantas.

20

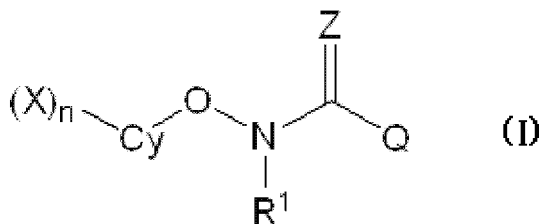
MEJOR MODO DE LLEVAR A CABO LA INVENCION

[Compuesto de ariloxiurea]

25

El compuesto de ariloxiurea de la presente invención se representa por la siguiente fórmula (I).

[Fórmula química 11]



30 [Sustituyentes]

El término "sin sustituir" en la presente invención se refiere a un grupo que tiene solamente un grupo central. En la presente descripción, a menos que se indique específicamente otra cosa, un grupo tiene el significado de estar "sin sustituir" cuando el grupo no se describe como "sustituido" y se describe solo usando el nombre del grupo central.

35

Por otro lado, el término "sustituido" se refiere a cualquier hidrógeno del grupo central que está sustituido con un grupo que tiene una estructura que es igual o diferente a la del grupo central. Por lo tanto, un "sustituyente" es otro grupo unido al grupo central. Un grupo puede tener un sustituyente o dos o más sustituyentes. Los dos o más sustituyentes pueden ser iguales o diferentes.

40

El término "C1-6", por ejemplo, significa que el número de átomos de carbono del grupo central es de 1 a 6. El número de átomos de carbono presentes en un sustituyente o sustituyentes no está incluido en el número de carbono átomos. Por ejemplo, un grupo butilo que tiene un grupo etoxi como un sustituyente del mismo se clasifica como un grupo alcoxi C2 alquilo C4.

45

No hay limitaciones particulares sobre los "sustituyentes" siempre que sean químicamente aceptables y permitan demostrar los efectos de la presente invención.

Los ejemplos de grupos que pueden ser "sustituyentes" son los siguientes:

50

átomos de halógeno tal como un átomo de flúor, átomo de cloro, átomo de bromo o átomo de yodo;  
 grupos alquilo C1-6 tales como un grupo metilo, grupo etilo, grupo n-propilo, grupo i-propilo, grupo n-butilo, grupo s-butilo, grupo i-butilo, grupo t-butilo, grupo n-pentilo o grupo n-hexilo;  
 grupos cicloalquilo C3-8 tales como un grupo ciclopropilo, grupo ciclobutilo, grupo ciclopentilo, grupo ciclohexilo o grupo cicloheptilo;  
 grupos alqueno C2-6 tales como un grupo vinilo, grupo 1-propenilo, grupo 2-propenilo, grupo 1-butenilo, grupo 2-butenilo, grupo 3-butenilo, grupos 1-metil-2-propenilo, grupos 2-metil-2-propenilo, grupo 1-pentenilo, grupo 2-pentenilo, grupo 3-pentenilo, grupo 4-pentenilo, grupo 1-metil-2-butenilo, grupo 2-metil-2-butenilo, grupo 1-

55

- hexenilo, grupo 2-hexenilo, grupo 3-hexenilo, grupo 4-hexenilo o grupo 5-hexenilo;  
 grupos cicloalquenilo C3-8 tales como un grupo 2-ciclopropenilo, grupo 2-ciclopentenilo, grupo 3-ciclohexenilo o grupo 4-ciclooctenilo;
- 5 grupos alquinilo C2-6 tales como un grupo etinilo, grupo 1-propinilo, grupo 2-propinilo, grupo 1-butinilo, grupo 2-butinilo, grupo 3-butinilo, grupo 1-metil-2-propinilo, grupo 2-metil-3-butinilo, grupo 1-pentinilo, grupo 2-pentinilo, grupo 3-pentinilo, grupo 4-pentinilo, grupo 1-metil-2-butinilo, grupo 2-metil-3-pentinilo, grupo 1-hexenilo o grupo 1,1-dimetil-2-butinilo;
- grupos alcoxi C1-6 tales como un grupo metoxi, grupo etoxi, grupo n-propoxi, grupo i-propoxi, grupo n-butoxi, grupo s-butoxi, grupo i-butoxi o grupo t-butoxi;
- 10 grupos alqueniloxi C2-6 tales como un grupo viniloxi, grupo aliloxi, grupo propeniloxi o grupo buteniloxi;  
 grupos alquiniloxi C2-6 tales como un grupo etiniloxi o grupo propargiloxi; grupos arilo C6-10 tal como un grupo fenilo o grupo naftilo;
- grupos ariloxi C6-10 tales como un grupo fenoxi o grupo 1-naftoxi;
- 15 grupos aralquilo C7-11 tales como un grupo bencilo o grupo fenetilo;
- grupos aralquiloxi C7-11 tales como un grupo benciloxi o grupo fenetiloxi;
- grupos acilo C1-7 tales como un grupo formilo, grupo acetilo, grupo propionilo, grupo benzoílo o grupo ciclohexilcarbonilo;
- grupos aciloxi C1-7 tales como un grupo formiloxi, grupo acetiloxi, grupo propioniloxi, grupo benzoiloxi o grupo ciclohexilcarboniloxi;
- 20 grupos alcoxycarbonilo C1-6 tales como un grupo metoxycarbonilo, grupo etoxycarbonilo, grupo n-propoxycarbonilo, grupo i-propoxycarbonilo, grupo n-butoxycarbonilo o grupo t-butoxycarbonilo;
- grupos carboxilo;
- grupos hidroxilo;
- 25 grupos haloalquilo C1-6 tales como un grupo clorometilo, grupo cloroetilo, grupo trifluorometilo, grupos 1,2-dicloro-n-propilo, grupo 1-fluoro-n-butilo o grupo perfluoro-n-pentilo;
- grupos haloalquenilo C2-6 tales como un grupo 2-cloro-1-propenilo o grupo 2-fluoro-1-butenilo;
- grupos haloalquinilo C2-6 tales como un grupo 4,4-dicloro-1-butinilo, grupo 4-fluoro-1-pentinilo o grupo 5-bromo-2-pentinilo;
- grupos haloalcoxi C1-6 tales como un grupo 2-cloro-n-propoxi o grupo 2,3-diclorobutoxi;
- 30 grupos haloalqueniloxi C2-6 tales como un grupo 2-cloropropeniloxi o un grupo 3-bromobuteniloxi;
- grupos haloarilo C6-10 tales como un grupo 4-clorofenilo, grupo 4-fluorofenilo o grupo 2,4-diclorofenilo;
- grupos haloariloxi C6-10 tales como un grupo 4-fluorofeniloxi o grupo 4-cloro-1-naftoxi;
- grupos acilo C1-7 sustituido con halógeno tal como un grupo cloroacetilo, grupo trifluoroacetilo, grupo tricloroacetilo o grupo 4-clorobenzoílo;
- 35 grupos ciano; grupos nitro; grupos amino;
- grupos alquilamino C1-6 tales como un grupo metilamino, grupo dimetilamino o grupo dietilamino;
- grupos arilamino C6-10 tales como un grupo anilino o grupo naftilamino;
- grupos aralquilamino C7-11 tales como un grupo bencilamino o grupo feniletilamino;
- 40 grupos acilamino C1-7 tales como un grupo formilamino, grupo acetilamino, grupo propanoilamino, grupo butililamino, grupo i-propil carbonil amino o grupo benzoilamino;
- grupos alcoxycarbonilamino C1-6 tales como un grupo metoxycarbonilamino, grupo etoxycarbonilamino, grupo n-propoxycarbonilamino o grupo i-propoxycarbonilamino;
- grupos aminocarbonilo sin sustituir o sustituidos tal como un grupo aminocarbonilo, grupo dimetilaminocarbonilo, grupo fenilaminocarbonilo o grupo N-fenil-N-metilaminocarbonilo;
- 45 grupos imino alquilo C1-6 tales como un grupos iminometilo, grupo (1-imino)etilo o grupo (1-imino)-n-propilo;
- grupos hidroximino alquilo C1-6 tales como un grupo hidroximinometilo, grupo (1-hidroximino)etilo o grupo (1-hidroximino)propilo;
- grupos mercapto;
- 50 grupos alquiltio C1-6 tales como un grupo metiltio, grupo etiltio, grupo n-propiltio, grupo i-propiltio, grupo n-butiltio, grupo i-butiltio, grupo s-butiltio o grupo t-butiltio;
- grupos alqueniltio C2-6 tales como un grupo viniltio o grupo aliltio;
- grupos alquiniltio C2-6 tales como un grupo etiniltio o grupo propargiltio; grupos ariltio C6-10 tales como un grupo feniltio o grupo naftiltio; grupos heteroariltio tales como un grupo tiazoliltio o grupo piridiltio;
- 55 grupos aralquiltio C7-11 tales como un grupo benciltio o grupo feniltio;
- grupos (alquiltio C1-6)carbonilo tales como un grupo (metiltio)carbonilo, grupo (etiltio)carbonilo, grupo (n-propiltio)carbonilo, grupo (i-propiltio)carbonilo, grupo (n-butiltio)carbonilo, grupo (i-butiltio)carbonilo, grupo (s-butiltio)carbonilo o grupo (t-butiltio)carbonilo;
- grupos alquilsulfinito C1-6 tales como un grupo a metilsulfinito, grupo etilsulfinito o grupo t-butilsulfinito;
- 60 grupos alquenilsulfinito C2-6 tal como un grupo alilsulfinito;
- grupos alquinilsulfinito C2-6 tal como un grupo propargilsulfinito;
- grupos arilsulfinito C6-10 tal como un grupo fenilsulfinito; grupos heteroarilsulfinito tales como un grupo tiazolilsulfinito o grupo piridilsulfinito;
- grupos aralquilsulfinito C7-11 tales como un grupo bencilsulfinito o grupo fenetilsulfinito;
- grupos alquilsulfonilo C1-6 tales como un grupo metil sulfonilo, grupo etilsulfonilo o grupo t-butilsulfonilo;
- 65 grupos alquenil sulfonilo C2-6 tal como un grupo alilsulfonilo;
- grupos alquinilsulfonilo C2-6 tal como un grupo propargilsulfonilo;

grupos arilsulfonilo C6-10 tal como un grupo fenilsulfonilo;  
 grupos heteroarilsulfonilo tales como un grupo tiazolilsulfonilo o grupo piridilsulfonilo;  
 grupos aralquilsulfonilo C7-11 tales como un grupo bencilsulfonilo o grupo fenetilsulfonilo;  
 5 grupos heteroarilo de 5 miembros tal como un grupo pirrolilo, grupo furilo, grupo tienilo, grupo imidazolilo, grupo  
 pirazolilo, grupo oxazolilo, grupo isoxazolilo, grupo tiazolilo, grupo isotiazolilo, grupo triazolilo, grupo oxadiazolilo,  
 grupo tiadiazolilo o grupo tetrazolilo;  
 grupos heteroarilo de 6 miembros tal como un grupo piridilo, grupo pirazinilo, grupo pirimidinilo, grupo piridazinilo  
 o grupo triazinilo;  
 10 grupos heteroarilo condensados, tales como un grupo indolilo, grupo benzofurilo, grupo benzotienilo, grupo  
 benzoimidazolilo, grupo benzoxazolilo, grupo benzotiazolilo, grupo quinolilo, grupo isoquinolilo o grupo  
 quinoxalinilo;  
 grupos heterocíclicos saturados tales como un grupo aziridinilo, grupo oxiranilo, grupo pirrolidinilo, grupo  
 tetrahidrofuranilo, grupo piperidilo, grupo piperazinilo o grupo morfolinilo;  
 15 grupos sililo sustituido con trialquil C1-6 tales como un grupo trimetilsililo, grupo trietilsililo o grupo t-  
 butildimetilsililo; grupos trifenilsililo:

Además, estos "sustituyentes" pueden tener además otros "sustituyentes".

[Cy]

20

En la fórmula (I), Cy representa un grupo arilo C6-10 o grupo heteroarilo.

25 El "grupo arilo C6-10" puede ser un grupo arilo monocíclico, o un grupo arilo policíclico en el que múltiples anillos  
 están unidos. El grupo arilo policíclico puede ser un grupo en que al menos uno de los anillos es un anillo aromático,  
 mientras que los anillos resultantes son cualquiera de los anillos alifáticos saturados, anillos alifáticos insaturados o  
 anillos aromáticos. Los ejemplos de los grupos arilo C6-10 incluyen un grupo fenilo, grupo naftilo, grupo azuleno,  
 grupo indenilo, grupo indanilo, grupo tetralinilo y similares.

30 El "grupo heteroarilo" es un grupo arilo de 5 a 10 miembros que incluye 1 a 4 heteroátomos distintos de átomos de  
 carbono seleccionados del grupo que consiste en átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno y átomo de azufre como un  
 átomo que constituye el anillo. En este caso, el grupo heteroarilo puede ser un grupo arilo monocíclico, o un grupo  
 arilo policíclico en el que múltiples anillos están condensados.

35 Los ejemplos del grupo heteroarilo son los mismos que los ejemplos de un grupo heteroarilo de 5 miembros, un  
 grupo heteroarilo de 6 miembros y un grupo heteroarilo condensado enumerados como los ejemplos de los  
 "sustituyentes".

40 Entre estos ejemplos, Cy es preferiblemente un grupo fenilo, grupo naftilo, grupo piridilo, grupo pirimidinilo, grupo  
 piridazinilo, grupo quinolilo, grupo isoquinolilo, grupo quinoxalinilo, y más preferiblemente un grupo fenilo.

40

[X]

45 En la fórmula (I). X representa un grupo alquilo C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo cicloalquilo C3-8 sin sustituir o  
 sustituido, grupo alquenilo C2-6 sin sustituir o sustituido, grupo alquinilo C2-6 sin sustituir o sustituido, grupo hidroxilo,  
 grupo alcoxi C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo amino, grupo alquil amino C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo acilo  
 C1-7 sin sustituir o sustituido, grupo alcoxicarbonilo C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo alquil sulfonilo C1-6 sin  
 sustituir o sustituido, grupo alcoxisulfonilo C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo arilo C6-10 sin sustituir o sustituido,  
 grupo heteroarilo sin sustituir o sustituido, grupo hidroximiino alquilo C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo nitro, grupo  
 50 ciano, o un átomo de halógeno.

n representa el número de X unidos a Cy y representa un número entero de 0 a 5. Cuando n es 2 o más. X puede  
 ser igual o diferente entre sí, y cuando n es 2 o más, X puede unirse entre sí para formar un anillo junto con los  
 átomos de carbono o átomos de nitrógeno unidos al mismo.

55 El "grupo alquilo C1-6" de X puede ser un grupo alquilo lineal o un grupo alquilo ramificado. Los ejemplos del grupo  
 alquilo incluyen un grupo metilo, grupo etilo, grupo n-propilo, grupo n-butilo, grupo n-pentilo, grupo n-hexilo, grupo i-  
 propilo, grupo i-butilo, grupo s-butilo, grupo t-butilo, grupo i-pentilo, grupo neopentilo, grupo 2-metil butilo, grupo 2,2-  
 dimetil propilo, grupo i-hexilo y similares.

60 Los ejemplos del "grupo alquilo sustituido" incluyen grupos cicloalquil C3-8-alquilo C1-6 tales como un grupo  
 ciclopropil metilo, grupo 2-ciclopropil etilo, grupo ciclopentil metilo, grupo 2-ciclohexil etilo, grupo 2-ciclooctil etilo o  
 similares;

65 grupos haloalquilo C1-6 tales como un grupo fluorometilo, grupo clorometilo, grupo bromometilo, grupo  
 difluorometilo, grupo diclorometilo, grupo dibromometilo, grupo trifluorometilo, grupo triclorometilo, grupo  
 tribromometilo, grupo 2,2,2-tolfluoroetilo, grupo 2,2,2-tricloroetilo, grupo pentafluoroetilo, grupo 4-fluorobutilo,



- grupo 4-clorobutilo, grupo 3,3,3-trifluoropropilo, grupo 2,2,2-trifluoro-1-trifluorometil etilo, grupo perfluorohexilo, grupo perclorohexilo, grupo perfluorooctilo, grupo perclorooctilo, grupo 2,4,6-triclorohexilo o similares;  
 grupos hidroxil alquilo C1-6 tales como un grupo hidroximetilo, grupo 2-hidroxietilo o similares;  
 grupos alcoxi C1-6 alquilo C1-6 tales como un grupo metoximetilo, grupo etoximetilo, grupo metoxietilo, grupo  
 5 etoxietilo, grupo metoxi-n-propilo, grupo etoximetilo, grupo etoxietilo, grupo n-propoximetilo, grupo i-propoxietilo, grupo s-butoximetilo, grupo t-butoxietilo o similares;  
 grupos alqueniloxi C2-6 alquilo C1-6 tales como un grupo viniloximetilo, grupo aliloximetilo, grupo propeniloximetilo, grupo buteniloximetilo o similares;  
 grupos heteroariloxi alquilo C1-6 tal como un grupo piridina-2-iloximetilo o similares;  
 10 grupos acilo C1-7 tales como un grupo formilo, grupo acetilo, grupo propionilo o similares;  
 grupos aciloxi C1-7 alquilo C1-6 tales como un grupo formiloximetilo, grupo acetoximetilo, grupo 2-acetoxietilo, grupo propioniloximetilo, grupo propioniloxietilo o similares;  
 grupo carboxilo alquilo C1-6 tales como un grupo carboxil metilo, grupo carboxil etilo o similares;  
 grupos alcoxycarbonil C1-6 alquilo C1-6 tales como un grupo metoxycarbonil metilo, grupo etoxycarbonil metilo,  
 15 grupo n-propoxycarbonil metilo, grupo i-propoxycarbonil metilo o similares;  
 grupos acil C1-7 amino alquilo C1-6 tales como un grupo formamida metilo, grupo acetamida metilo, grupo 2-acetamida etilo, grupo propionil aminometilo, grupo propionil aminoetilo o similares;  
 grupos alquilo C1-6 aminocarbonil alquilo C1-6 tales como un grupo metil aminocarbonil metilo, grupo etil aminocarbonil metilo, grupo i-propil aminocarbonil metilo, grupo t-butil aminocarbonil metilo, grupo s-butil  
 20 aminocarbonil metilo, grupo n-pentil aminocarbonil metilo o similares;  
 grupos alcoxycarbonil C1-6 amino alquilo C1-6 tales como un grupo metoxycarbonil aminometilo, grupo etoxycarbonil aminometilo, grupo i-propoxycarbonil aminometilo, grupo t-butoxycarbonil aminometilo, grupo s-butiloxycarbonil aminometilo, grupo n-pentiloxycarbonil aminometilo o similares;  
 grupos aralquilo C7-11 tales como un grupo bencilo, grupo fenetilo o similares;  
 25 grupos arilo C6-10 carbonil amino alquilo C1-6 tal como un grupo benzoil aminometilo o similares; y similares.

Los ejemplos del "grupo cicloalquilo C3-8" de X incluyen un grupo ciclopropilo, grupo ciclobutilo, grupo ciclopentilo, grupo ciclohexilo, grupo cicloheptilo y similares.

- 30 Los ejemplos del "grupo alquenilo C2-6" de X incluyen un grupo vinilo, grupo 1-propenilo, grupo 2-propenilo, grupo 1-butenilo, grupo 2-butenilo, grupo 3-butenilo, grupos 1-metil-2-propenilo, grupos 2-metil-2-propenilo, grupo 1-pentenilo, grupo 2-pentenilo, grupo 3-pentenilo, grupo 4-pentenilo, grupo 1-metil-2-butenilo, grupo 2-metil-2-butenilo, grupo 1-hexenilo, grupo 2-hexenilo, grupo 3-hexenilo, grupo 4-hexenilo, grupo 5-hexenilo y similares.

- 35 Los ejemplos del "grupo alquenilo C2-6 sustituido" incluyen grupos haloalquenilo C2-6 tal como un grupo 2-cloro-1-propenilo, grupo 2-fluoro-1-butenilo y similares.

- Los ejemplos del "grupo alquinilo C2-6" de X incluyen un grupo etinilo, grupo 1-propinilo, grupo 2-propinilo, grupo 1-butinilo, grupo 2-butinilo, grupo 3-butinilo, grupo 1-metil-2-propinilo, grupo 2-metil-3-butinilo, grupo 1-pentinilo, grupo  
 40 2-pentinilo, grupo 3-pentinilo, grupo 4-pentinilo, grupo 1-metil-2-butinilo, grupo 2-metil-3-pentinilo, grupo 1-hexinilo, grupo 1,1-dimetil-2-butinilo y similares.

- Los ejemplos del "grupo alquinilo C2-6 sustituido" incluyen grupos haloalquinilo C2-6 tales como un grupo 4,4-dicloro-1-butinilo, grupo 4-fluoro-1-pentinilo, grupo 5-bromo-2-pentinilo y similares.  
 45

Los ejemplos del "grupo alcoxi C1-6" de X incluyen un grupo metoxi, grupo etoxi, grupo n-propoxi, grupo n-butoxi, grupo n-pentiloxi, grupo n-hexiloxi, grupo i-propoxi, grupo i-butoxi, grupo s-butoxi, grupo t-butoxi, grupo i-hexiloxi y similares.

- 50 Los ejemplos del "grupo alcoxi C1-6 sustituido" incluyen grupos haloalcoxi C1-6 tal como un grupo clorometoxi, grupo diclorometoxi, grupo difluorometoxi, grupo triclorometoxi, grupo trifluorometoxi, grupo 1-fluoroetoxi, grupo 1,1-difluoroetoxi, grupo 2,2,2-trifluoroetoxi, grupo pentafluoroetoxi y similares.

- Los ejemplos del "grupo alquilo C1-6 amino" de X incluyen un grupo metil amino, grupo dimetil amino, grupo dietil amino y similares.  
 55

Los ejemplos del "grupo acilo C1-7" de X incluyen un grupo formilo, grupo acetilo, grupo propionilo, grupo benzoilo y similares.

- 60 Los ejemplos del "grupo acilo C1-7 sustituido" incluyen grupos acilo C1-7 sustituidos con halógeno, tal como un grupo cloroacetilo, grupo trifluoroacetilo, grupo tricloroacetilo, grupo 4-clorobenzoilo y similares.

Los ejemplos del "grupo alcoxycarbonilo C1-6" de X incluyen un grupo metoxycarbonilo, grupo etoxycarbonilo, grupo n-propoxycarbonilo, grupo i-propoxycarbonilo y similares.

- 65 Los ejemplos del "grupo alcoxycarbonilo C1-6 sustituido" incluyen grupos cicloalquilo C3-8 alcoxycarbonilo C1-6 tal

como un grupo ciclopropil metoxicarbonilo, grupo ciclobutil metoxicarbonilo, grupo ciclopentil metoxicarbonilo, grupo ciclohexil metoxicarbonilo, grupo 2-metil ciclopropil metoxicarbonilo, grupo 2,3-dimetil ciclopropil metoxicarbonilo, grupo 2-clorociclopropil metoxicarbonilo, grupo 2-ciclopropil etoxicarbonilo;

- 5 grupos haloalcoxicarbonilo C1-6 tal como un grupo fluorometoxicarbonilo, grupo clorometoxicarbonilo, grupo bromometoxicarbonilo, grupo difluorometoxicarbonilo, grupo diclorometoxicarbonilo, grupo dibromometoxicarbonilo, grupo trifluorometoxicarbonilo, grupo triclorometoxicarbonilo, grupo tribromometoxicarbonilo, grupo 2,2,2-trifluoroetoxicarbonilo, grupo 2,2,2-tricloroetoxicarbonilo, grupo pentafluoroetoxicarbonilo, grupo 4-fluorobutoxicarbonilo, grupo 3,3,3-trifluoropropoxicarbonilo, grupo 2,2,2-trifluoro-1-trifluorometil etoxicarbonilo, grupo perfluorohexiloxicarbonilo;
- 10 y similares.

Los ejemplos del "grupo alquilo sulfonilo C1-6" de X incluyen un grupo metil sulfonilo, grupo etil sulfonilo, grupo t-butil sulfonilo y similares.

- 15 Los ejemplos del "grupo alcoxisulfonilo C1-6" de X incluyen un grupo metoxisulfonilo, grupo etoxisulfonilo, grupo t-butoxisulfonilo y similares.

Los ejemplos del "grupo arilo C6-10" and "grupo heteroarilo" de X son los mismos que los enumerados como los ejemplos de Cy.

- 20 Los ejemplos de los sustituyentes en el "grupo arilo C6-10" y el "grupo heteroarilo" de X incluyen

átomos de halógeno tal como un átomo de flúor, átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo o similares;

- 25 grupos alquilo C1-6 tales como un grupo metilo, grupo etilo, grupo n-propilo, grupo i-propilo, grupo n-butilo, grupo s-butilo, grupo i-butilo, grupo t-butilo, grupo n-pentilo, grupo n-hexilo o similares;
- grupos haloalquilo C1-6 tales como un grupo clorometilo, grupo cloroetilo, grupo trifluorometilo, grupos 1,2-dicloro-n-propilo, grupo 1-fluoro-n-butilo, grupos perfluoro-n-pentilo o similares;
- 30 grupos ciano; y similares.

Los ejemplos del "grupo hidroxiiimino alquilo C1-6" de X incluyen un grupo hidroxiiiminometilo, grupo (1-hidroxiiimino)etilo, grupo (1-hidroxiiimino)propilo y similares.

- 35 Los ejemplos del "grupo hidroxiiimino alquilo C1-6 sustituido" incluyen grupos alcoxiimino C1-6 alquilo C1-6 tal como un grupo metoxiiminometilo, grupo (1-metoxiimino)etilo, grupo (1-metoxiimino)propilo, grupo etoxiiminometilo, grupo (1-etoxiimino)etilo, grupo (1-etoxiimino)propilo o similares; grupos cicloalquilo C3-8 alcoxiimino C1-6 alquilo C1-6 tal como un grupo (1-ciclopropil metoxiimino)etilo; grupos aralquiloimino C7-11 alquilo C1-6 tal como un grupo benciloxiiminometilo, grupo (1-benciloxiimino)etilo; y similares.

- 40 Los ejemplos del "átomo de halógeno" de X incluyen un átomo de flúor, átomo de cloro, un átomo de bromo, átomo de yodo y similares.

Los ejemplos del anillo formado por la unión de X junto con los átomos de carbono o átomos de nitrógeno unidos al mismo cuando n es 2 o más, incluyen un anillo de ciclopenteno, anillo de ciclohexeno, anillo de 3,4-dihidro-2H-pirano, anillo de 3,4-dihidro-2H-tiopirano, anillo de 1,1-dióxido de 3,4-dihidro-2H-tiopirano y similares.

[R<sup>1</sup>]

- 50 En la fórmula (I), R<sup>1</sup> representa un grupo alquilo C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo alqueno C2-6 sin sustituir o sustituido o un grupo alquino C2-6 sin sustituir o sustituido.

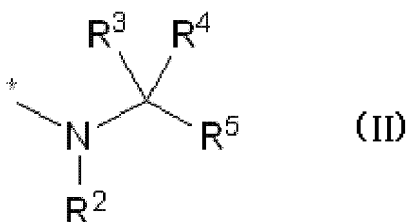
Los ejemplos del "grupo alquilo C1-6", "grupo alqueno C2-6" y "grupo alquino C2-6", de R<sup>1</sup> son los mismos que los enumerados como los ejemplos de X.

55 [Q]

En la fórmula (I), Q representa un grupo representado por la fórmula (II),

60

[Fórmula química 12]



En la fórmula (II), \* representa la posición de enlace.

5 [R<sup>2</sup>]

En la fórmula (II), R<sup>2</sup> representa un átomo de hidrógeno, grupo alquilo C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo alqueno C2-6 sin sustituir o sustituido, grupo alquino C2-6 sin sustituir o sustituido, grupo acilo C1-7 sin sustituir o sustituido, grupo alcóxicarbonilo C1-6 sin sustituir o sustituido. R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> pueden unirse juntos para formar un grupo alqueno C2-4 sin sustituir o sustituido.

Los ejemplos del "grupo alquilo C1-6", "grupo alqueno C2-6", "grupo alquino C2-6", "grupo acilo C1-7" y "grupo alcóxicarbonilo C1-6" de R<sup>2</sup> son los mismos que los enumerados como los ejemplos de X.

15 Los ejemplos del "grupo alqueno C2-4 sin sustituir o sustituido" formado por la unión de R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> incluyen un grupo etileno, grupo propileno (grupo trimetileno) y similares.

[R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>]

20 En la fórmula (II), R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> representan cada uno independientemente grupo alquilo C1-6 sin sustituir o sustituido.

Los ejemplos del "grupo alquilo C1-6" de R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> son los mismos que los enumerados como los ejemplos de X.

[R<sup>5</sup>]

25 En la fórmula (II), R<sup>5</sup> representa un grupo aminocarbonilo sin sustituir o sustituido, grupo arilo C6-10 sin sustituir o sustituido, o un grupo heteroarilo sin sustituir o sustituido.

30 Los ejemplos del "grupo arilo C6-10" de R<sup>5</sup> incluyen un grupo fenilo, grupo naftilo, grupo azuleno, grupo indenilo, grupo indanilo, grupo tetralinilo y similares.

35 Los ejemplos del "grupo heteroarilo" de R<sup>5</sup> incluyen grupos heteroarilo de 5 miembros tal como un grupo pirrolilo, grupo furilo, grupo tienilo, grupo imidazolilo, grupo pirazolilo, grupo oxazolilo, grupo isoxazolilo, grupo tiazolilo, grupo isotiazolilo, grupo triazolilo, grupo oxadiazolilo, grupo tiadiazolilo, grupo tetrazolilo o similares;

grupos heteroarilo de 6 miembros tal como un grupo piridilo, grupo pirazinilo, grupo pirimidinilo, grupo piridazinilo, grupo triazinilo o similares;

40 grupos heteroarilo condensados, tales como un grupo indolilo, grupo benzofurilo, grupo benzotienilo, grupo benzoimidazolilo, grupo benzoxazolilo, grupo benzotiazolilo, grupo quinolilo, grupo isoquinolilo, grupo quinoxalinilo o similares;

grupos heterocíclicos parcialmente insaturados de 5 miembros tal como un grupo pirrolinilo, grupo imidazolinilo, grupo pirazolinilo, grupo oxazolinilo, grupo tiazolinilo o similares; y similares.

45 Entre estos ejemplos, un grupo fenilo, un grupo piridilo y similares son preferibles.

Los ejemplos de los sustituyentes en el "grupo arilo C6-10" y "grupo heteroarilo" de R<sup>5</sup> incluyen

50 átomos de halógeno tal como un átomo de flúor, átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo;  
grupos alquilo C1-6 tales como un grupo metilo, grupo etilo, grupo n-propilo, grupo i-propilo, grupo n-butilo, grupo s-butilo, grupo i-butilo, grupo t-butilo, grupo n-pentilo, grupo n-hexilo;  
grupos haloalquilo C1-6 tales como un grupo clorometilo, grupo cloroetilo, grupo trifluorometilo, grupo 1,2-dicloro-n-propilo, grupo 1-fluoro-n-butilo, grupo perfluoro-n-pentilo;  
grupo ciano;  
55 y similares.

Los ejemplos del "grupo aminocarbonilo sustituido" incluyen un grupo alquil aminocarbonilo C1-6 tal como un grupo metil aminocarbonilo, grupo etil aminocarbonilo, grupo i-propil aminocarbonilo, grupo t-butil aminocarbonilo, grupo s-butil aminocarbonilo, grupo n-pentil aminocarbonilo o similares; grupos di alquil C1-6 aminocarbonilo tal como un grupo dimetil aminocarbonilo, grupo dietil aminocarbonilo o similares; grupos cicloalquilo C3-8 aminocarbonilo tales como un grupo ciclopropil aminocarbonilo, grupo ciclopentil aminocarbonilo, grupo ciclohexil aminocarbonilo o similares; grupos alquil C2-6 aminocarbonilo tal como un grupo 2-propinil aminocarbonilo o similares; grupo fenil aminocarbonilo. grupo N-fenil-N-metil aminocarbonilo o similares; grupos alcoxi C1-6 alquilo C1-6 aminocarbonilo tal como un grupo metoxietil aminocarbonilo o similares; grupos haloalquilo C1-6 aminocarbonilo tal como un grupo 2,2,2-trifluoroetil aminocarbonilo o similares; grupos cicloalquilo C3-8 alquilo C1-6 aminocarbonilo tal como un grupo ciclopropil metil aminocarbonilo o similares; grupos aralquilo C7-11 aminocarbonilo tal como un grupo bencilo aminocarbonilo o similares; grupos amina carbonilos cíclicos 1-sustituidos tal como un grupo piperidina-1-il carbonilo o similares;

[Z]

En la fórmula (I), Z representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre, y preferiblemente representa un átomo de oxígeno.

[Sal de compuesto de ariloxiurea]

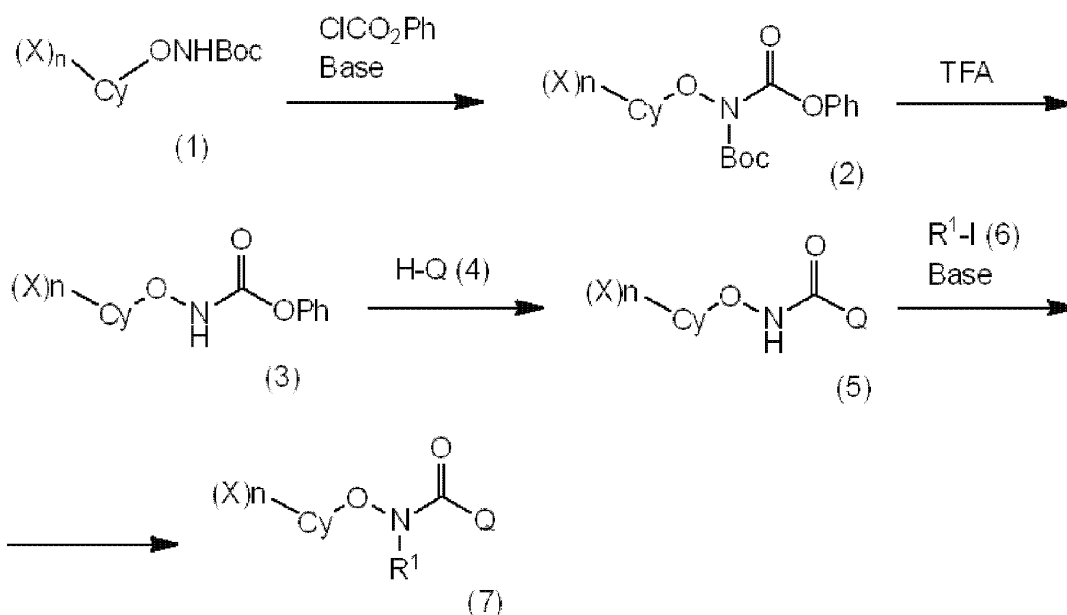
No hay limitaciones particulares sobre las sales del compuesto de ariloxiurea de la presente invención siempre que sea una sal agrícola y hortícola admisible. Los ejemplos de la sal incluyen sales de ácidos inorgánicos tales como ácido clorhídrico o ácido sulfúrico; sales de ácidos orgánicos tales como ácido acético o ácido láctico; sales de metales alcalinos tales como litio, sodio o potasio; sales de metales alcalinotérreos tales como calcio o magnesio; sales de metales de transición tales como hierro o cobre; y sales de bases orgánicas tales como amoniaco, trietilamina, tributilamina, piridina o hidrazina. Las sales del compuesto de ariloxiurea de la presente invención pueden producirse por métodos bien conocidos.

[Método de producción]

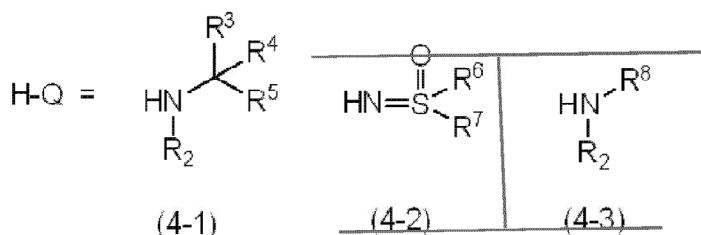
A continuación se proporciona una explicación de un método de producción del compuesto de ariloxiurea de la presente invención.

1) El método de producción que se muestra en el siguiente esquema puede ser un ejemplo del primer método de producción.

[Fórmula química 16]



40



a) Un compuesto de diéster representado por la fórmula (2) (en lo sucesivo en el presente documento, puede denominarse "compuesto (2)") se obtiene haciendo reaccionar un compuesto ariloxiamina representado por la fórmula (1) (en lo sucesivo en el presente documento, puede denominarse "compuesto (1)") con éster fenílico del ácido clorofórmico en presencia de una base. A continuación, se produce un éster fenílico del ácido N-ariloxycarbámico representado por la fórmula (3) (en lo sucesivo en el presente documento, el "compuesto (3)") realizando una reacción de-Boc en presencia de ácido trifluoroacético. En las fórmulas (1) a (3), X, n y Cy son como se han definido anteriormente.

La cantidad de ácido fenil clorofórmico es generalmente de 1 a 2 moles, y preferiblemente de 1,0 a 1,2 moles con respecto a 1 mol del compuesto (1).

Si bien la reacción se puede realizar en ausencia de una base, es preferible realizar la reacción en presencia de una base. Los ejemplos de la base incluyen piridina, trietilamina, hidróxido potásico y similares. La cantidad de la base es generalmente de 1 a 2 moles con respecto a 1 mol del compuesto (1).

La reacción puede realizarse en un disolvente. No hay limitaciones particulares en el disolvente siempre que esté inactivo contra la reacción. Los ejemplos del disolvente incluyen disolventes de tipo éter tales como dioxano, 1,2-dimetoxietano, tetrahidrofurano; disolventes de tipo hidrocarburo aromático tales como tolueno, benceno, xileno; disolventes de tipo hidrocarburo alifático tales como n-pentano, n-hexano, n-heptano; disolventes de tipo hidrocarburo halogenado tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano; disolventes de tipo amida tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetil acetamida, N-metil pirrolidona; disolventes de tipo nitrilo tales como acetonitrilo, benzonitrilo; y disolventes mixtos que incluyen dos o más de estos disolventes; y similares. Aunque no hay limitaciones particulares en la cantidad de disolvente, generalmente es de 1 a 100 ml con respecto a 1 g del compuesto (1).

La temperatura de reacción varía de -20 °C hasta el punto de ebullición del disolvente. Aunque el tiempo de reacción varía según la escala de reacción, generalmente es de minutos a horas.

A continuación, la reacción de-Boc se realiza en presencia de un catalizador ácido. Los ejemplos del ácido incluyen ácidos inorgánicos, tales como ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, ácido nítrico; ácidos acéticos, ácidos trifluoroacéticos, ácidos metanosulfónicos, ácido p-toluenosulfónicos y similares. Entre estos ejemplos, es preferible el ácido trifluoroacético. La cantidad de ácido es generalmente de 1 a 20 moles con respecto a 1 mol del compuesto (2).

La reacción puede realizarse en un disolvente. No hay limitaciones particulares en el disolvente siempre que esté inactivo contra la reacción. Los ejemplos del disolvente son los mismos que los ejemplos del disolvente utilizado para producir el compuesto (2). Aunque no hay limitaciones particulares en la cantidad de disolvente, generalmente es de 1 a 100 ml con respecto a 1 g del compuesto (2).

La temperatura de reacción varía de la temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente. Aunque el tiempo de reacción varía según la escala de reacción, generalmente es de minutos a horas.

b) se produce un compuesto de ariloxiurea representado por la fórmula (5) (en lo sucesivo en el presente documento, "compuesto (5)") haciendo reaccionar el compuesto (3) con un compuesto representado por la fórmula (4) (en lo sucesivo en el presente documento, se puede denominar como "compuesto (4)"). Aquí, el compuesto (4) puede ser un compuesto de amina representado por la fórmula (4-1) (en lo sucesivo en el presente documento, puede denominarse "compuesto (4-1)"). En la fórmula (4) y la fórmula (5), X, n, Q y Cy son como se han definido anteriormente. En la fórmula (4-1), R<sup>2</sup> a R<sup>5</sup> son como se han definido anteriormente.

La cantidad de compuesto (4) es generalmente de 1 a 2 moles, y preferiblemente de 1,0 a 1,2 moles con respecto a 1 mol de compuesto (3).

La reacción puede realizarse en un disolvente. No hay limitaciones particulares en el disolvente siempre que esté inactivo contra la reacción. Los ejemplos del disolvente son los mismos que los ejemplos del disolvente utilizado para

producir el compuesto (2). Aunque no hay limitaciones particulares en la cantidad de disolvente, generalmente es de 1 a 100 ml con respecto a 1 g del compuesto (3).

5 La temperatura de reacción varía de la temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente. Aunque el tiempo de reacción varía según la escala de reacción, generalmente es de minutos a horas.

10 b) un compuesto de ariloxiurea representado por la fórmula (7) (en lo sucesivo en el presente documento, puede denominarse "compuesto (7)"), que es un compuesto diana, se produce haciendo reaccionar el compuesto (5) con un compuesto yodado representado por la fórmula (6) (en lo sucesivo en el presente documento, puede denominarse "compuesto (6)") en presencia de una base. En la fórmula (6) y la fórmula (7), X, n, Q, R<sup>1</sup> y Cy son como se han definido anteriormente.

15 La cantidad de compuesto (6) es generalmente de 1 a 2 moles, y preferiblemente de 1,0 a 1,2 moles con respecto a 1 mol de compuesto (5).

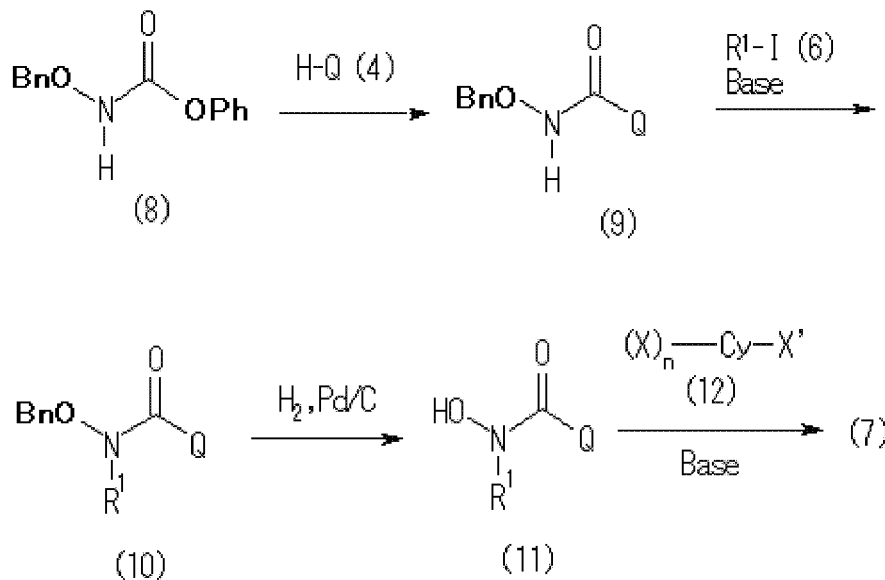
Los ejemplos de la base incluyen piridina, trietilamina, hidróxido potásico, carbonato de calcio y similares. La cantidad de la base es generalmente de 1 a 2 mol con respecto a 1 mol del compuesto (5).

20 La reacción puede realizarse en un disolvente. No hay limitaciones particulares en el disolvente siempre que esté inactivo contra la reacción. Los ejemplos del disolvente son los mismos que los ejemplos del disolvente utilizado para producir el compuesto (2). Aunque no hay limitaciones particulares en la cantidad de disolvente, generalmente es de 1 a 100 ml con respecto a 1 g del compuesto (5).

25 La temperatura de reacción varía de -20 °C hasta el punto de ebullición del disolvente. Aunque el tiempo de reacción varía según la escala de reacción, generalmente es de minutos a horas.

2) El método de producción que se muestra en el siguiente esquema puede ser un ejemplo del segundo método de producción.

30 [Fórmula química 17]



35 a) Un compuesto benciloxiurea representado por la fórmula (9) (en lo sucesivo en el presente documento, puede denominarse "compuesto (9)") se produce haciendo reaccionar un fenil éster de ácido N-benciloxicarbámico (en lo sucesivo en el presente documento, puede denominarse "compuesto (8)") que se puede producir mediante métodos bien conocidos con el compuesto (4). En la Fórmula (9), Q es como se ha definido anteriormente.

40 La cantidad de compuesto (4) es generalmente de 1 a 2 moles, y preferiblemente de 1,0 a 1,2 moles con respecto a 1 mol de compuesto (8).

La reacción puede realizarse en un disolvente. No hay limitaciones particulares en el disolvente siempre que esté inactivo contra la reacción. Los ejemplos del disolvente son los mismos que los ejemplos del disolvente utilizado para

producir el compuesto (2). Aunque no hay limitaciones particulares en la cantidad de disolvente, generalmente es de 1 a 100 ml con respecto a 1 g del compuesto (8).

La temperatura de reacción varía de la temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente. Aunque el tiempo de reacción varía según la escala de reacción, generalmente es de minutos a horas.

b) Se produce un compuesto benciloxiurea representado por la fórmula (10) (en lo sucesivo en el presente documento, puede denominarse "compuesto (10)") haciendo reaccionar el compuesto (9) con el compuesto (6), seguido de una desbencilación por reducción catalítica para producir un compuesto oxiurea representado por la fórmula (11) (en lo sucesivo en el presente documento, puede denominarse "compuesto (11)"). En la fórmula (10) y (11), Q y R<sup>1</sup> son como se han definido anteriormente.

La cantidad de compuesto (6) es generalmente de 1 a 2 moles, y preferiblemente de 1,0 a 1,2 moles con respecto a 1 mol de compuesto (9).

La reacción puede realizarse en un disolvente. No hay limitaciones particulares en el disolvente siempre que esté inactivo contra la reacción. Los ejemplos del disolvente son los mismos que los ejemplos del disolvente utilizado para producir el compuesto (2). Aunque no hay limitaciones particulares en la cantidad de disolvente, generalmente es de 1 a 100 ml con respecto a 1 g del compuesto (9).

La temperatura de reacción varía de -20 °C hasta el punto de ebullición del disolvente. Aunque el tiempo de reacción varía según la escala de reacción, generalmente es de minutos a horas.

A continuación, la reacción de desbencilación se realiza por reducción catalítica usando un catalizador de paladio o similares. Los ejemplos del catalizador de paladio incluyen paladio negro, paladio carbono y similares. La cantidad de catalizador de paladio es generalmente de 0,01 a 0,1 mol con respecto a 1 mol del compuesto (10).

La reacción se realiza en un disolvente. No hay limitaciones particulares en el solvente. Los ejemplos del disolvente son los mismos que los ejemplos del disolvente utilizado para producir el compuesto (2). Los ejemplos del disolvente también incluyen disolventes de tipo alcohol tales como metanol, etanol, n-propanol, y similares. Aunque no hay limitaciones particulares en la cantidad de disolvente, generalmente es de 1 a 100 ml con respecto a 1 g del compuesto (10).

La temperatura de reacción varía de la temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente. Aunque el tiempo de reacción varía según la escala de reacción, generalmente es de minutos a horas.

c) Se produce un compuesto diana (7) haciendo reaccionar el compuesto (11) con un compuesto arilo representado por la fórmula (12) (en lo sucesivo en el presente documento, puede denominarse "compuesto (12)") en presencia de una base. En la Fórmula (12), X, n, y Cy son como se han definido anteriormente.

La cantidad de compuesto (12) es generalmente de 1 a 2 moles, y preferiblemente de 1,0 a 1,2 con respecto a 1 mol de compuesto (11).

Los ejemplos de la base incluyen hidróxido de metal tal como hidróxido de litio, hidróxido sódico, hidróxido potásico, hidróxido de magnesio, hidróxido de calcio; alcóxido metálico tal como metóxido de sodio, etóxido de sodio, metóxido potásico, etóxido de potasio, t-butóxido de potasio; hidruro metálico tal como hidruro de sodio, hidruro de potasio, hidruro de calcio; base orgánica como trietilamina, diisopropilamina, piridina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undeceno-7-eno (DBU), 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano. La cantidad de la base es generalmente de 1 a 2 mol con respecto a 1 mol del compuesto (11).

La reacción se realiza en un disolvente. No hay limitaciones particulares en el disolvente siempre que esté inactivo contra la reacción. Los ejemplos del disolvente son los mismos que los ejemplos del disolvente utilizado para producir el compuesto (2). Aunque no hay limitaciones particulares en la cantidad de disolvente, generalmente es de 1 a 100 ml con respecto a 1 g del compuesto (11).

La temperatura de reacción varía de -20 °C hasta el punto de ebullición del disolvente. Aunque el tiempo de reacción varía según la escala de reacción, generalmente es de minutos a horas.

Después de que se completan las reacciones, se puede realizar un procedimiento de postratamiento ordinario y, si es necesario, se pueden realizar métodos conocidos, tal como la destilación, la recristalización o la cromatografía en columna, para purificar y aislar el compuesto diana.

La estructura del compuesto diana puede identificarse y confirmarse mediante un análisis conocido tal como espectroscopia IR, espectroscopia de RMN, espectroscopia de masas o análisis elemental.

[Agente de control de plagas]

El compuesto de ariloxiurea de la presente invención o una sal del mismo es eficaz para prevenir diversas plagas (incluyendo ácaros) u organismos nocivos tales como patógenos de plantas o similares.

[Acaricida]

5 Lo siguiente proporciona una explicación del acaricida que incluye el compuesto de la presente invención como un principio activo. Dado que el compuesto de la presente invención tiene acción insecticida en insectos adultos, insectos inmaduros, larvas, huevos de insectos y similares, se puede usar para prevenir organismos dañinos como los ácaros presentes en los cultivos agrícolas. En particular, el acaricida tiene un efecto de prevención superior  
10 contra el ácaro presente en cultivos agrícolas, árboles frutales, flores y plantas ornamentales y árboles.

A continuación se muestran ejemplos de ácaros a prevenir.

15 (1) Acaridida de Orden Astigmata:

(a) Ácaros pertenecientes a la familia Acaridae, por ejemplo, *Rhizoglyphus echinopus* y *Rhizoglyphus robini* de *Rhizoglyphus* spp.; *Tyrophagus putrescentiae*, *Tyrophagus neiswanderi*, *Tyrophagus perniciosus* y *Tyrophagus similis* de *Tyrophagus* spp.; y otros tales como *Acarus siro*, *Aleuroglyphus ovatus*, *Mycetoglyphus fungivorus*;

20 (2) Actinedida del orden Prostigmata

(a) Ácaros pertenecientes a la familia Tetranychidae, por ejemplo, *Bryobia praetiosa* y *Bryobia rubrioculus* de *Bryobia* spp.; por ejemplo, *Eotetranychus boreus*, *otetranychus geniculatus*, *Eotetranychus pruni*, *Eotetranychus uncatatus*, *Eotetranychus shii*, *Eotetranychus suginamensis*, *Eotetranychus celtis*, *Eotetranychus smithi*, *Eotetranychus asiaticus* y *Eotetranychus kankitus* de *Eotetranychus* spp.; por ejemplo, *Oligonychus mangiferus*, *Oligonychus perseae*, *Oligonychus pustulosus*, *Oligonychus karamatus*, *Oligonychus hondoensis*, *Oligonychus ilicis*, *Oligonychus ununguis*, *Oligonychus shinkajii* y *Oligonychus orthius* de *Oligonychus* spp.; por ejemplo, *Panonychus citri*, *Panonychus mori* y *Panonychus ulmi* de *Panonychus* spp.; por ejemplo, *Tetranychus viennensis*, *Tetranychus quercivorus*, *Tetranychus ludeni*, *Tetranychus phaselus*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai* y *Tetranychus urticae* de *Tetranychus* spp.; *Aponychus corpuzae* y *Aponychus firmianae* de *Aponychus* spp.; *Sasanychus akitanus* y *Sasanychus pusillus* de *Sasanychus* spp.; *Shizotetranychus celarius*, *Shizotetranychus miscanthi*, *Shizotetranychus longus*, *Shizotetranychus schizopus* y *Shizotetranychus recki* de *Shizotetranychus* spp.; y otros tales como *Tuckerella pavoniformis*, *Tetranychina harti*, *Yezonychus sapporensis*;

(b) Ácaros pertenecientes a la familia Tenuipalpidae, por ejemplo, *Brevipalpus lewisi*, *Brevipalpus russulus*, *Brevipalpus obovatus* y *Brevipalpus phoenicis* de *Brevipalpus* spp.; por ejemplo, *Tenuipalpus pacificus* y *Tenuipalpus zhizhilashviliae* de *Tenuipalpus* spp.; y otros tales como *Dolichotetranychus floridanus*;

(c) Ácaros pertenecientes a la familia Eriophyidae, por ejemplo, *Aceria diospiri*, *Aceria ficus*, *Aceria japonica*, *Aceria kuko*, *Aceria paradianthi*, *Aceria tilingi*, *Aceria tulipae* y *Aceria zoysiea* de *Aceria* spp.; por ejemplo, *Eriophyes chibaensis* y *Eriophyes emarginatae* de *Eriophyes* spp.; por ejemplo, *Aculops lycopersici* y *Aculops pelekassi* de *Aculops* spp.; por ejemplo, *Aculus fockeui*, *Aculus schlechtendali*, que pertenecen a *Aculus* spp.; y otros tales como *Colomerus vitis*, *Calepitrimerus vitis*, *Phyllocotruta citri*, *Paracalacarus podocarp*, *Calacarus carinatus*, *Acaphylla theavagrans*, *Paraphytoptus kikis*, *Epitrimerus piri*;

(d) Ácaros pertenecientes a la familia Transonemidae, por ejemplo, *Tarsonemus bilobatus* y *Tarsonemus waiti* de *Tarsonemus* spp.; otros tales como *Phytonemus pallidus*, *Polyphagotarsonemus latus*;

(e) Ácaros pertenecientes a la familia Penthaleidae, por ejemplo, *Penthaleus erythrocephalus* y *Penthaleus major* de *Penthaleus* spp.;

50 Además, el acaricida de la presente invención tiene un efecto de prevención superior contra el parásito del ácaro en animales. Los ejemplos de parásitos del ácaro en animales incluyen los ácaros, que son parásitos en la espalda, las axilas, la parte inferior del muslo y el muslo interno de los animales que son huéspedes (animal huésped) para obtener fuentes nutricionales tales como sangre, caspa de los animales para vivir. Los ejemplos de animales huésped incluyen perros, gatos, ratones, ratas, hámsteres, cobayas, ardillas, conejos, hurones; aves de compañía  
55 (por ejemplo, paloma, loro, urraca, gorrión de java, periquito, bengalí, canario); vacas, caballos, cerdos, ovejas, cabras; aves de corral (por ejemplo, patos, pollos, codornices, gallinas); abejas (por ejemplo, *apis mellifera*, abeja japonesa); y similares.

A continuación se muestran ejemplos de ácaros a prevenir.

60 (1) Ácaro del orden Mesostigmata

(a) Ácaros pertenecientes a la familia Dermanyssidae, por ejemplo, *Dermanyssus gallinae*;

(b) Ácaros pertenecientes a la familia Macronyssidae, por ejemplo, *Ornithonyssus sylviarum*, *Ornithonyssus bursa* y *Ornithonyssus bacoti* de *Ornithonyssus* spp.;

(c) Ácaros pertenecientes a la familia Laelapidae, por ejemplo, *Laelaps echidninus* y *Laelaps jettmari* de



Laelaps spp.; Tropilaelaps clarae;

(d) Ácaros pertenecientes a la familia Varroidae, por ejemplo, Varroa destructor, Varroa jacobsoni y Varroa underwoodi de Varroa spp.;

5 (2) Garrapata del orden Metastigmata

(a) Ácaros pertenecientes a la familia Argasidae, por ejemplo, Argas persicus y Argas reflexus de Argas spp.; por ejemplo, Ornithodoros moubata, que pertenece a Ornithodoros spp.;

10 (b) Ácaros pertenecientes a la familia Ixodidae, por ejemplo, Haemaphysalis concinna, Haemaphysalis punctata, Haemaphysalis cinnabarina, Haemaphysalis otophila, Haemaphysalis leachi, Haemaphysalis longicornis, Haemaphysalis mageshimaensis, Haemaphysalis yeni, Haemaphysalis campanulata, Haemaphysalis pentalagi, Haemaphysalis flava, Haemaphysalis megaspinosa, Haemaphysalis japonica y Haemaphysalis douglasi de Haemaphysalis spp.; por ejemplo, Amblyomma americanum, Amblyomma variegatum, Amblyomma maculatum, Amblyomma hebraeum, Amblyomma cajennense y Amblyomma testudinarium de Amblyomma spp.; por ejemplo, Ixodes ricinus, Ixodes hexagonus, Ixodes canisuga, Ixodes pilosus, Ixodes rubicundus, Ixodes scapularis, Ixodes holociclus, Ixodes ovatus, Ixodes persulcatus e Ixodes nipponensis de Ixodes spp.; por ejemplo, Rhipicephalus (Boophilus) microplus), Rhipicephalus (Boophilus) decoloratus), Rhipicephalus (Boophilus) annulatus), Rhipicephalus (Boophilus) calceratus), que pertenecen a Boophilus spp.; por ejemplo, Rhipicephalus evertsi, Rhipicephalus sanguineus, Rhipicephalus bursa, Rhipicephalus appendiculatus, Rhipicephalus capensis, Rhipicephalus turanicus y Rhipicephalus zambeziensis de Rhipicephalus spp.; por ejemplo, Dermacentor marginatus, Dermacentor reticulatus, Dermacentor pictus, Dermacentor albipictus, Dermacentor andersoni y Dermacentor variabilis de Dermacentor spp.;

25 (3) Acaridida del orden Astigmata

(a) Ácaros pertenecientes a la familia Psoroptidae, por ejemplo, Psoroptes ovis, Psoroptes cuniculi, Psoroptes equi, que son Psoroptes spp.; por ejemplo, Chorioptes bovis, que pertenece a Chorioptes spp.; Otodectes cynotis, que pertenece a Otodectes spp.;

30 (b) Ácaros pertenecientes a la familia Sarcoptidae, por ejemplo, Sarcoptes scabiei, Sarcoptes canis, Sarcoptes bovis, Sarcoptes ovis, Sarcoptes rupicaprae, Sarcoptes equi y Sarcoptes suis de Sarcoptes spp.; por ejemplo, Notoedres cati, que pertenece a Notoedres spp.;

(c) Ácaros pertenecientes a la familia Knemidokoptidae, por ejemplo, Knemidokoptes mutans, que pertenece a Knemidokoptes spp.;

35 (4) Actinedida del orden Prostigmata

(a) Ácaros pertenecientes a la familia Demodixidae, por ejemplo, Demodex canis, Demodex bovis, Demodex ovis, Demodex caprae, Demodex equi, Demodex caballi, Demodex suis y Demodex cati de Demodex spp.;

40 (b) Ácaros pertenecientes a la familia Trombiculidae, por ejemplo, Trombicula alfreddugesi y Trombicula akamushi de Trombicula spp.;

(c) Ácaros pertenecientes a la familia Tarsonemidae, por ejemplo, Acarapis woodi, que pertenece a Acarapis spp.;

45 (Agente de control de plagas)

Además, el compuesto de la presente invención se puede usar para prevenir organismos nocivos tales como plagas distintas de los ácaros presentes en cultivos agrícolas, plagas sanitarias, plagas de granos almacenados, plagas en la ropa y plagas domésticas.

50 A continuación se muestran ejemplos de plagas a prevenir.

(1) Plagas de Lepidopteran, por ejemplo, Spodoptera litura, Mamestra brassicae, Agrotis ypsilon, Autographa nigrisigna, Plutella xylostella, Adoxophyes honmai, Homona magnanima, Carposina sasakii, Grapholita molesta, Phyllocnistis citrella, Caloptilia theivora, Phyllonorycter ringoniella, Lymantria dispar, Euproctis pseudoconsersa, Chilo suppressalis, Cnaphalocrocis medinalis, Ostrinia nubilalis, Hyphantria cunea, Cadra cautella, Heliothis spp., Helioverpa, Agrotis spp., Tinea translucens, Cydia pomonella, Pectinophora gossypiella, o similares;

55 (2) Plagas de Hemipteran, por ejemplo, Myzus persicae, Aphis gossypii, Lipaphis erysimi, Rhopalosiphum padi, Riptortus clavatus, Acrosternum hilare, Unaspis yanonensis, Pseudococcus comstocki, Trialeurodes vaporariorum, Bemisia tabaci, Bemisia argentifolii, Psylla piricola, Stephanitis nashi, Nilaparvata lugens, Laodelphax stratella, Sogatella furcifera, Nephotettix cincticeps, o similares;

(3) Plagas de Coleopteran, por ejemplo, Phyllotreta striolata, Aulacophora indica, Leptinotarsa decemlineata, Lissorhoptrus oryzophilus, Sitophilus oryzae, Callosobruchus chinensis, Popillia japonica, Anomala rufocuprea, Diabrotica spp., Lasioderma serricorne, Lyctus brunneus, Monochamus alternatus, Anoplophora malasiaca, Agriotes spp., Epilachna vigintioctomaculata, Tenebroides mauritanicus, Anthonomus grandis, o similares;

65 (4) Plagas de Dipteran, por ejemplo, Bactrocera cucurbitae, Bactrocera dorsalis, Delia platura, Hydrellia griseola,

*Drosophila melanogaster*, o similares;

(5) Plagas de Thysanopteran, por ejemplo, *Thrips palmi*, *Scirtothrips dorsalis*, o similares;

(6) Plagas de Hymenopteran, por ejemplo, *Monomorium pharaonis*, *Vespa simillima*, *Athalia rosae*, o similares;

(7) Plagas de Orthopteran, por ejemplo, *Locusta migratoria*, o similares;

5 (8) Plagas de Blattodea, por ejemplo, *Blattella germanica*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, o similares;

(9) Plagas de Isopteran, por ejemplo, *Coptotermes formosanus*, *Reticulitermes speratus*, o similares;

(10) Nematodos parásitos de plantas, por ejemplo, *Meloidogyne incognita*, *Pratylenchus* spp., *Heterodera* glicinas, *Aphelenchoides besseyi*, *Bursaphelenchus xylophilus*, o similares.

10

[Ectoparasitocida]

Además, El compuesto de la presente invención es superior en la prevención de ectoparásitos distintos de ácaros parásitos en animales.

15

A continuación se muestran ejemplos de Phthiraptera a prevenir.

(1) Piojo del orden Anoplura

20

(a) Piojo perteneciente a la familia Haematopinidae, por ejemplo, *Haematopinus asini*, *Haematopinus eurystemus* y *Haematopinus suis* de *Haematopinus* spp.;

(b) Piojo perteneciente a la familia Linognathidae, por ejemplo, *Linognathus setosus*, *Linognathus vituli*, *Linognathus ovillus*, *Linognathus oviformis*, *Linognathus pedalis* y *Linognathus stenopsis* de *Linognathus* spp.; por ejemplo, *Solenopotes capillatus* de *Solenopotes* spp.;

25

(2) Piojo mordedor del orden Amblycera

(a) Piojo mordedor perteneciente a la familia Menoponidae, por ejemplo, *Menacanthus stramineus*, *Menacanthus cornutus* y *Menacanthus pallidulus* de *Menacanthus* spp.; por ejemplo, *Menopon gallinae* perteneciente a *Menopon* spp.;

30

(3) Piojo mordedor del orden Ischnocera

(a) Piojo mordedor perteneciente a la familia Philopteridae, por ejemplo, *Columbicola columbae* de *Columbicola* spp.; por ejemplo, *Cuclotogaster heterographus* de *Cuclotogaster* spp.; por ejemplo, *Goniodes dissimilis*, *Goniodes gigas*, *Goniodes gallinae* de *Goniodes* spp.; por ejemplo, *Lipeurus caponis* de *Lipeurus* spp.;

35

(b) Piojo mordedor de la familia Trichodectidae, por ejemplo, *Bovicola bovis*, *Bovicola ovis*, *Bovicola limbata*, *Bovicola caprae* y *Bovicola equi* de *Bovicola* spp.; por ejemplo, *Trichodectes canis* de *Trichodectes* spp.; por ejemplo, *Felicola subrostrata* de *Felicola* spp.;

40

Los ejemplos de Siphonaptera se muestran a continuación.

(a) Pulga perteneciente a la familia Tungidae, por ejemplo, *Tunga penetrans* de *Tunga* spp.;

45

(b) Pulga perteneciente a la familia Pulicidae, por ejemplo, *Ctenocephalides canis* y *Ctenocephalides felis* de *Ctenocephalides* spp.; por ejemplo, *Archaeopsylla erinacei* de *Archaeopsylla* spp.; por ejemplo, *Xenopsylla cheopis* de *Xenopsylla* spp.; por ejemplo, *Pulex irritans* de *Pulex* spp.; por ejemplo, *Echidnophaga gallinacea* de *Echidnophaga* spp.;

50

(c) Pulga perteneciente a la familia Ceratophyllidae, por ejemplo, *Ceratophyllus gallinae* y *Ceratophyllus anisus* de *Ceratophyllus* spp.; por ejemplo, *Nosopsyllus fasciatus* de *Nosopsyllus* spp.;

(d) Pulga de la familia Leptopsyllidae, por ejemplo, *Leptopsylla segnis* de *Leptopsylla* spp.;

Los ejemplos de exoparásitos a prevenir también incluyen Hemiptera.

55

Los ejemplos de Hemiptera se muestran a continuación.

(a) Insecto perteneciente a la familia Cimicidae, por ejemplo, *Cimex lectularius* de *Cimex* spp.;

(b) Insecto perteneciente a la familia Reduviidae, y Triatominae, por ejemplo, *Panstrongylus* spp.; por ejemplo, *Rhodnius prolixus* de *Rhodnius* spp.; por ejemplo, *Triatoma infestans* de *Triatoma* spp.;

60

El ectoparasitocida de la presente invención también es eficaz para prevenir la plaga de Diptera de los insectos mordedores (mosca masticadora, mosca adulta chupadora de sangre, larva de díptero móvil, gusano de mosca parásito).

65

Los ejemplos de los Diptera se muestran a continuación.

(1) Orden Nematocera

(a) Mosquito perteneciente a la familia Culicidae, por ejemplo, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens pallens*, *Culex tarsalis*, *Culex pipiens molestus*, *Culex pipiens fatigans*, *Culex tritaeniorhynchus summorosus* de *Culex* spp.; *Armigeres subalbatus* de *Armigeres* spp.; por ejemplo, *Anopheles gambiae*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles sinensis*, *Anopheles lesteri* de *Anopheles* spp.; por ejemplo, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Aedes togoi*, *Aedes vexans nipponii* de *Aedes* spp.;

(b) Mosca negra perteneciente a la familia Simuliidae, por ejemplo, *Simulium reptans*, *Simulium ornatum*, *Simulium venustum*, *Simulium salopiense* de *Simulium* spp.; por ejemplo, *Prosimulium yezoense* de *Prosimulium* spp.;

(c) Chinche perteneciente a la familia Ceratopogonidae, por ejemplo, *Culicoides arakawae*, *Culicoides pictimargo*, *Culicoides kibunensis*, *Culicoides homotomus*, *Culicoides oxistoma*, *Culicoides nipponensis*, *Culicoides punctatus*, *Culicoides maculatus*, *Culicoides matsuzawai* de *Culicoides* spp.;

(2) Orden Brachycera

(a) Mosca perteneciente a la familia Tabanidae, por ejemplo, *Tabanus bromius*, *Tabanus spodopterus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus sudeticus*, *Tabanus trigonus*, *Tabanus chrysurus*, *Tabanus trigeminus*, *Tabanus fulvimeidioides* y *Tabanus iyoensis* de *Tabanus* spp.; por ejemplo, *Chrysops caecutiens*, *Chrysops relictus*, *Chrysops suavis*, *Chrysops japonicus* de *Chrysops* spp.;

(b) Mosca perteneciente a la familia Muscidae, por ejemplo, *Musca domestica*, *Musca bezzii*, *Musca hervei*, *Musca conducens* y *Musca stabulans* de *Musca* spp.; por ejemplo, *Stomoxys calcitrans* de *Stomoxys* spp.; por ejemplo, *Haematobia irritans*, *Haematobia irritans exigua* y *Haematobia stimulans* de *Haematobia* spp.; *Fannia canicularis* de *Fannia* spp.;

(c) *Glossina* spp. perteneciente a la familia Glossinidae;

(d) Mosca perteneciente a la familia Hippoboscidae, por ejemplo, *Melophagus ovinus* de *Melophagus* spp.;

(e) Fly perteneciente a la familia Calliphoridae, por ejemplo, *Calliphora lata* de *Calliphora* spp.; por ejemplo, *Lucilia (Phaenicia) cuprina*, *Lucilia (Phaenicia) sericata* y *Lucilia illustris* de *Lucilia* spp.; por ejemplo, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya cloropyga* y *Chrysomya bezziana* de *Chrysomya* spp.;

(f) Mosca perteneciente a la familia Oestridae, por ejemplo, *Cuterebra* spp. de la familia Cuterebrinae; por ejemplo, *Hypoderma bovis* e *Hypoderma lineatum* de *Hypoderma* spp. de Hypodermatinae family; por ejemplo, *Gasterophilus intestinalis*, *Gasterophilus haemorroidalis*, *Gasterophilus inermis*, *Gasterophilus nasalis*, *Gasterophilus nigricornis* y *Gasterophilus pecorum* de *Gasterophilus* spp. de Gasterophilinae family; por ejemplo, *Oestrus ovis* de *Oestrus* spp. de Oestrinae family;

[Fungicida]

Lo siguiente proporciona una explicación del fungicida que incluye el compuesto de la presente invención como un principio activo. El compuesto de la presente invención puede usarse para prevenir enfermedades de plantas derivadas de una amplia gama de tipos de hongos, tales como hongos pertenecientes a la familia Oomycetes, Ascomycetes, Deuteromycetes o Basidiomycetes, porque tiene una acción fungicida superior.

Las enfermedades de las plantas a prevenir se muestran a continuación.

Remolacha azucarera:

Mancha foliar por *Cercospora* (*Cercospora beticola*)  
 Pobredumbre de la raíz por *Aphanomyces* (*Aphanomyces cochlioides*)  
 Pobredumbre de la raíz (*Thanatephorus cucumeris*)  
 Tizón de la hoja (*Thanatephorus cucumeris*) o similares

Cacahuetes:

Mancha foliar negra (*Mycosphaerella arachidis*)  
 Tizón de la hoja negro (*Mycosphaerella berkeleyi*) o similares

Pepinos:

Mildíu polvoroso (*Sphaerotheca fuliginea*)  
 Mildíu lanoso (*Pseudoperonospora cubensis*)  
 Tizón del tallo gomoso (*Mycosphaerella melonis*)  
 Marchitamiento por *Fusarium* (*Fusarium oxisporum*)  
 Pobredumbre por *Sclerotinia* (*Sclerotinia sclerotiorum*)  
 Moho gris (*Botrytis cinerea*)  
 Antracnosis (*Colletotrichum ohriculare*)  
 Sarna (*Cladosporium cucumerinum*)

## ES 2 708 678 T3

Mancha foliar por *Corynespora* (*Corynespora cassicola*)  
Marchitamiento fúngico (*Pythium debaryanum*, *Rhizoctonia solani* Kuhn)  
Mancha bacteriana (*Pseudomonas syringae* pv. *Lecrymans*) o similares

5 Tomates:

Moho gris (*Botrytis cinerea*)  
Moho foliar (*Cladosporium fulvum*)  
Tizón tardío (*Phytophthora infestans*) o similares

10

Berenjenas:

Moho gris (*Botrytis cinerea*)  
Pobredumbre negra (*Corynespora melongenae*)  
Mildiú polvoroso (*Erysiphe cichoracearum*)  
Moho foliar (*Mycovellosiella natrassii*) o similares

15

Fresas:

Moho gris (*Botrytis cinerea*)  
Mildiú polvoroso (*Sphaerotheca humuli*)  
Antracnosis (*Colletotrichum acutatum*. *Colletotrichum fragariae*)  
Pobredumbre por *Phytophthora* (*Phytophthora cactorum*) o similares

20

25 Cebollas:

Pobredumbre del cuello (*Botrytis allii*)  
Moho gris (*Botrytis cinerea*)  
Tizón foliar (*Botrytis squamosa*)  
Mildiú lanoso (*Peronospora destructor*)

30

Repollo:

Hernia de la col (*Plasmodiophora brassicae*)  
Pobredumbre blanda por bacterias (*Erwinia carotovora*)  
Mildiú lanoso (*Peronospora parasitica*) o similares

35

Frijoles:

Pobredumbre del tallo (*Sclerotinia sclerotiorum*)  
Moho gris (*Botrytis cinerea*) o similares

40

Manzanas:

Mildiú polvoroso (*Podosphaera leucotricha*)  
Sarna (*Venturia inaequalis*)  
Roya de las flores (*Monilinia mali*)  
Mancha de la fruta (*Mycosphaerella pomii*)  
Chancro por *Valsa* (*Valsa mali*)  
Mancha por *Alternaria* (*Alternaria mali*)  
Roya (*Gymnosporangium yamadae*)  
Pobredumbre anular (*Botryosphaeria berengeriana*)  
Antracnosis (*Glomerella cingulata*. *Colletotrichum acutatum*)  
Mancha (*Diplocarpon mali*)  
Motas de mosca (*Zygophiala jamaicensis*)  
Manchas de hollín (*Gloeodes pomigena*) o similares

45

50

55

Caquis:

Mildiú polvoroso (*Phyllactinia kagicola*)  
Antracnosis (*Gloeosporium kaki*)  
Mancha foliar angular (*Cercospora kaki*) o similares

60

Melocotones:

Pobredumbre parda (*Monilinia fructicola*)

65

Sarna (*Cladosporium carpophilum*)  
 Pobredumbre por *Phomopsis* (*Phomopsis* sp.) o similares

Cerezas:

5 Pobredumbre parda (*Monolinia fructicola*) o similares

Uvas:

10 Moho gris (*Botrytis cinerea*)  
 Mildiú polvoroso (*Uncinula necator*)  
 Pobredumbre de la maduración (*Glomerella cingulata*. *Colletotrichum acutatum*)  
 Mildiú lanoso (*Plasmopara viticola*)  
 Antracnosis (*Elsinoe ampelina*)  
 15 Tizón foliar (*Pseudocercospora vitis*)  
 Pobredumbre negra (*Guignardia bidwellii*) o similares

Peras:

20 Sarna (*Venturia nashicola*)  
 Roya (*Gymnosporangium asiaticum*)  
 Mancha negra (*Alternaria kikuchiana*)  
 Pobredumbre anular (*Botryosphaeria berengeriana*)  
 Mildiú polvoroso (*Phyllactinia mali*) o similares

25

Té:

Tizón gris (*Pestalotia theae*)  
 Antracnosis (*Collectotrichum theae-sinensis*) o similares

30

Cítricos:

Sarna (*Elsinoe fawcetti*)  
 Moho azul (*Penicillium italicum*)  
 35 Moho verde común (*Penicillium digitatum*)  
 Moho gris (*Botrytis cinerea*)  
 Melanosis (*Diaporthe citri*)  
 Chancro (*Xanthomonas campestris* pv. *Citri*) o similares

40

Trigo:

Mildiú polvoroso (*Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*)  
 Tizón por *Fusarium* (*Gibberella zeae*)  
 Roya de la hoja (*Puccinia recondita*)  
 45 Pobredumbre de la raíz parduzca (*Pythium iwayamai*)  
 Moho de la nieve (*Monographella nivalis*)  
 Mancha ocular (*Pseudocercospora herpotrichoides*)  
 Mancha foliar moteada (*Septoria tritici*)  
 Mancha de la gluma (*Leptosphaeria nodorum*)  
 50 Tizón de la nieve por *Typhula* (*Typhula incarnata*)  
 Tizón de la nieve por *Sclerotinia* (*Myriosclerotinia borealis*)  
 Pudrición de la corona y raíz (*Gaeumanomyces graminis*) o similares

Cebada:

55 Estriado (*Pirenophora graminia*)  
 Mancha foliar (*Rhynchosporium secalis*)  
 Carbón volador (*Ustilago tritici*, *U. nuda*) o similares

60 Arroz:

Añublo (*Piricularia oryzae*)  
 Añublo de la vaina (*Rhizoctonia solani*)  
 Enfermedad de Bakanae (*Gibberella fujikuroi*)  
 65 Mancha parda (*Cochliobolus niyabeanus*)  
 Tizón de los semilleros (*Pythium graminicolum*)

Tizón foliar bacteriano (*Xanthomonas oryzae*)  
Tizón bacteriano de los semilleros (*Burkholderia plantarii*)  
Estríado pardo bacteriano (*Acidovorax avenae*)  
Pobredumbre del grano bacteriana (*Burkholderia glumae*) o similares

5

Tabaco:

Pobredumbre del tallo por *Sclerotinia* (*Sclerotinia sclerotiorum*)  
Mildíu polvoroso (*Erysiphe cichoracearum*) o similares

10

Tulipanes:

Moho gris (*Botrytis cinerea*) o similares

15

Agrostis:

Tizón de la nieve por *Sclerotinia* (*Sclerotinia borealis*)  
Tizón del brote bacteriano (*Pythium aphanidermatum*) o similares

20

Hierba cana:

Mildíu polvoroso (*Erysiphe graminis*) o similares

25

Semillas de soja:

Mancha púrpura de la semilla (*Cercospora kikuchii*)  
Mildíu lanoso (*Peronospora manshurica*)  
Pobredumbre del tallo y la raíz por *Phytophthora* (*Phytophthora sojae*) o similares

30

Patatas, tomates:

Tizón tardío (*Phytophthora infestans*) o similares

35

El compuesto de la presente invención causa poco daño químico, demuestra bajos niveles de toxicidad en peces y animales de sangre caliente, y es un compuesto que tiene un grado de seguridad particularmente alto.

El agente de control de plagas de la presente invención contiene como principio activo al menos un tipo de compuesto seleccionado de los compuestos de la presente invención.

40

Además, aunque el agente de control de plagas de la presente invención solo puede contener el compuesto de la presente invención, también puede contener vehículos tales como un vehículo sólido, un vehículo líquido o un vehículo gaseoso. Además, el agente de control de plagas de la presente invención puede tener el compuesto de la presente invención impregnado en un material de base tal como una placa de cerámica porosa o tela no tejida. Además, se puede añadir un tensioactivo u otro adyuvante según sea necesario.

45

El agente de control de plagas de acuerdo con la presente invención puede formularse en una forma que pueda ser adoptada normalmente por productos químicos agrícolas, concretamente, en forma de un polvo dispersable en agua, gránulos, polvo, emulsión, polvo soluble en agua, suspensión, polvo granular dispersable en agua, preparación fluida, microcápsulas, aerosol, bruma, agente de transpiración por calor, fumigante o cebo venenoso.

50

Los ejemplos de los aditivos y vehículos usados cuando se formula una preparación sólida incluyen polvos vegetales tales como polvo o harina de soja, polvos finos minerales tales como tierra de diatomeas, apatita, escayola, talco, bentonita, pirofilita o arcilla; y compuestos orgánicos e inorgánicos tales como benzoato de sodio, urea o sulfato de sodio.

55

Los ejemplos de los disolventes utilizados al formular preparaciones líquidas incluyen queroseno, xileno e hidrocarburos aromáticos a base de petróleo, ciclohexano, ciclohexanona, dimetilformamida, dimetilsulfóxido, alcoholes, acetona, tricloroetileno, metil isobutil cetona, aceites minerales, aceites vegetales y agua.

60

Los ejemplos de los vehículos gaseosos usados cuando se formulan propulsores incluyen gas butano, LPG, éter dimetílico y gas dióxido de carbono.

65

Los ejemplos de los materiales de base del cebo venenoso incluyen componentes de cebo tales como polvo de grano, aceite vegetal, azúcar o celulosa cristalina, antioxidantes tales como dimetilhidroxitolueno o ácido nordihidroguaiarético, conservantes tales como ácido deshidroacético, preventivos de la ingestión accidental de niños pequeños y mascotas, tales como pimienta de cayena en polvo, fragancias que atraen insectos, tal como la

fragancia de queso o la fragancia de cebolla.

Se puede añadir un agente tensioactivo de acuerdo con la necesidad de obtener una forma uniforme y estable durante la formulación. No hay limitaciones en cuanto a los tensioactivos a añadir. Los ejemplos de tensioactivos incluyen tensioactivos no iónicos tales como polioxietileno alquil fenil éteres, éteres alquílicos de polioxietileno, ésteres de ácidos grasos superiores de polioxietileno, ésteres de ácidos grasos superiores de polioxietileno sorbitán o triestiril fenil éteres de polioxietileno; ésteres de sulfonato de alquil fenil éteres de polioxietileno, alquilbencenosulfonato, sulfato de alcohol graso superior, sulfonatos de alquilnaftaleno, policarboxilatos, sulfonatos de lignina, condensados de formaldehído de sulfonatos de alquilnaftaleno y copolímeros de anhídrido isobutileno-maleico.

La cantidad del compuesto de la presente invención contenida en la preparación es preferiblemente del 0,01 al 90 % en peso, y más preferiblemente del 0,05 al 85 % en peso.

El polvo dispersable en agua, emulsión, preparación fluida, polvo soluble en agua, polvo granular dispersable en agua, que se obtienen de esta manera se pueden preparar en forma de solución, suspensión o emulsión y se diluyen con agua a una concentración prescrita a pulverizar sobre plantas o el suelo, o en el caso de utilizarlo en forma de polvo o gránulos, puede pulverizarse directamente sobre plantas o el suelo.

Además, en el caso de usarlo como un acaricida para la prevención de epidemias, se puede usar directamente una preparación que se suministra en forma de solución de aceite, aerosol, bruma, cebo envenenado o lámina miticida.

Además, en el caso de usar el agente de control de plagas de la presente invención para prevenir los ácaros parasitarios de animal del ganado tal como vacas o cerdos, y mascotas tales como perros o gatos, el compuesto de la presente invención se puede usar en una relación de 0,01 mg a 1000 mg por 1 kg de animal huésped.

Se puede aplicar un acaricida para prevenir los ácaros usando un método veterinario conocido. Los ejemplos de dichos métodos incluyen métodos en los cuales el acaricida se administra a un animal mediante un comprimido, cápsula, líquido de inmersión, aditivo alimentario, supositorio o inyección (intramuscular, subcutánea, intravenosa o inyección intraabdominal) cuando se administra con el propósito de control sistémico, métodos en los que se administra una preparación líquida oleosa o acuosa pulverizando, vertiendo o manchando cuando se administra con fines de control no sistémico, y métodos en los que el acaricida se mezcla con una resina y el producto amasado se moldea en una forma adecuada tal como la de un collar o una etiqueta de oreja que luego se adhiere al animal.

El agente de control de plagas de la presente invención puede mezclarse o combinarse con fungicidas, otros insecticidas o acaricidas, nematocidas, pesticidas del suelo, reguladores de plantas, sinergistas, fertilizantes, mejoradores del suelo o piensos para animales y similares.

La siguiente lista enumera ejemplos típicos de fungicidas, otros insecticidas o acaricidas, nematocidas, pesticidas del suelo y reguladores de plantas que pueden usarse mezclando con el agente de control de plagas de la presente invención.

Los ejemplos de insecticidas, acaricidas, nematocidas y pesticidas del suelo incluyen:

(1) a base de (tio)fosfato orgánico: tal como acefato, azametifos, azinfos-metilo, azinfos-etilo, bromofosetilo, bromfenvinfos, BRP, clorpirifos, clorpirifos-metilo, clorpirifos-etilo, clorfenvinfos, cadusafos, carbofenotión, cloretoxifos, clormefos, cumafós, cianofenfos, cianofos, CYAP, diazinón, diclorvos, dicrotofos, dimetoato, disulfotón, demeton-S-metilo, dimetilvinfos, demeton-S-metil sulfona, dialifos, diazinón, diclofentiión, dioxabenzofos, disulfotón, etiión, etoprofos, etrimfos, EPN, fenamifos, fenitrotion, fentiión, fensulfotiión, flupirazofos, fonofos, formotiión, fosmetilán, heptenofos, isazofos, yodofenfos, isofenfos, isoxatiión, iprobenfos, malatiión, mevinfos, metamidofos, metidatiión, monocrotofos, mecarbam, metacrifos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paraoxon, paratiión, paratiión-metilo, fentoato, fosalona, fosmet, fosfamidiión, forato, foxim, pirimifos-metilo, pirimifos-etilo, profenofos, protiofos, fostiazeto, fosfocarb, propafos, propetamfos, protoato, piridafentiión, piraclafos, quinalfos, salitiión, sulprofos, sulfotep, tetraclorvinfos, terbufos, triazofos, triclorfon, tebupirimfos, temefos, tiometón, vamidotiión, piraclafos;

(2) a base de carbamato: alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, carbarilo, carbofurano, carbosulfán, fenoxicarb, fenotiocarb, metiocarb, metomilo, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, triazamato, etiofencarb, fenobucarb, MIPC, MPMC, MTMC, piridafentiión, furatiocarb, XMC, aldoxicarb, alilxicarb, aminocarb, bendiocarb, bufencarb, butacarb, butocarboxim, butoxicarboxim, cloetocarb, dimetilan, formetanato, isoprocab, metam-sodio, metolcarb, tiofanox, trimetacarb, xilicarb;

(3) a base de piretroide: aletrina, bifentrina, ciflutrina,  $\beta$ -ciflutrina, cihalotrina, lambdacihalotrina, cifenotrina, cipermetrina, alfacipermetrina, betacipermetrina, zetacipermetrina, deltametrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, imiprotrin, permetrina, praletrina, piretrina, piretrina I, piretrina II, resmetrina, silafluofeno, flualinato, teflutrina, tetrametrina, tralometrina, transflutrina, proflutrina, dimeflutrina, acrinatrina, cicloprotrina, halfenprox, flucirinato, bioaletrina, bioetanometrina, biopermetrina, bioresmetrina, transpermetrina, empentrina, fenflutrina, fenpiritrina, flubrocitrinato, lufenoprox, flumetrina, metoflutrina, fenotrina, protrifenbuto,

piresmetrina, teraletrina;

(4) reguladores del crecimiento:

5 (a) inhibidores de la síntesis de quitina: clorfluazurón, diflubenzurón, fluciclozurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, teflubenzurón, triflumurón, bistriflurón, nobifumurón, buprofezina, hexitiazox, etoxazol, clofentezina, fluazurón, penflurón;

(b) antagonistas de ecdisona: halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida, cromafenozida, azadiractina;

(c) sustancias de tipo hormona juvenil: piriproxifeno, metopreno, diofenolan, epofeneonano, hidropreno, kinopreno, tripreno;

10 (d) inhibidores de la biosíntesis de lípidos: espiroclorfenol, espiromesifen, espirotetramat, flonicamid;

(5) compuestos agonistas/antagonistas del receptor de nicotina: acetamiprid, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid, tiametoxam, nitiazina, nicotina, bensultap, cartap;

(6) compuestos antagonistas de GABA:

15

(a) acetoclor, etiprol, fipronilo, vaniliprol, pirafluprol, piriprol;

(b) compuesto de organocloro: camfecloro, clordano, endosulfano, HCH,  $\gamma$ -HCH, heptaclor, metoxiclor;

20 (7) insecticidas de lactona macrocíclica: abamectina, emamectina, milbemectina, lepimectina, espinosad, ivermectina, seramectina, doramectina, epinomectina, moxidectina;

(8) compuestos de METI I: fenazaquina, piridaben, tebufenpirad, tolfenpirad, flufenirim, hidrametilnon, fenpiroximato, pirimidifen, dicofol;

(9) compuestos de METI II y III: acequinocilo, fluacripirim, rotenona;

(10) compuestos del agente de desacomplamiento: clorfenapir, dinobuton, dinocap, DNOC;

25 (11) compuestos del inhibidor de la fosforilación oxidativa: cihexitina, diafentiurón, óxido de fenbutatina, propargita, azociclotina;

(12) compuestos de interrupción de la muda: ciromazina;

(13) compuestos del inhibidor de oxidasa de función mixta: butóxido de piperonilo;

(14) compuestos bloqueadores del canal de sodio: indoxacarb, metaflumizona;

30 (15) pesticidas microbianos: agentes BT, agentes virales patógenos de insectos, agentes fúngicos patógenos de insectos, agentes fúngicos patógenos de nematodos, bacillus, beauveria bassiana, metarhizium anisopliae, paecilomyces, thuringiensin, verticillium;

(16) agonista del receptor de latrofilina: depsipéptido, ciclopepsipéptido, ciclopepsipéptido de 24 miembros, Emodepside;

35 (17) agonista de octopamina: amitraz;

(18) agonista del derivado de rianodina: flubendiamida, clorantraniliprol, ciantraniliprol;

(19) inhibidor de ATPasa estimulado por magnesio: tiociclam, tiosultap, nereistoxina;

(20) antialimentario: pimetozina;

(21) inhibidor del crecimiento de los ácaros: clofentezina, etoxazol;

40 (22) otros compuestos: benclotiaz, bifenazato, piradaililo, azufre, cienopirafen, ciflumetofen, amidoflumet, tetradifon, clordimeform, 1,3-dicloropropeno, DCIP, fenisobromolato, benzomato, metaldehído, espinetoram, pirifluquinzaon, benzomato, bromopropilato, quinometionato, clorobencilato, cloropicrina, clotiazoben, diciclanilo, fenoxacrim, fentripanilo, flubenzimina, flufenazina, gossypure, japonilure, metoxadiazona, aceite, oleato de potasio, sulfuramid, tetrasul, triaratenol;

45 Fungicidas:

(1) a base de benzoimidazol: benomilo, carbendazima, fuberidazol, tiabendazol, tiofanato de metilo o similares;

(2) fungicidas a base de dicarboxiimida: clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolina o similares;

50 (3) fungicidas de DMI: imdazalilo, oxpoconazol, pefurazoato, procloraz, triflumizol, triforina, pirifenox, fenarimol, nuarimol, azaconazol, bitertanol, bromconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipuconazol, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefón, triadimenol, triticonazol, etaconazol, furconazol-cis o similares;

55 (4) a base de fenilamida: benalaxil furalaxilo, metalaxilo, metalaxil-M, oxadixilo, ofurace o similares;

(5) a base de amina: aldimorfo, dodemorfo, fenpropimorfo, tridemorfo, fenpropidina, piperalina, espiroxamina o similares;

(6) a base de fosfotiolato: EDDP, iprobenfos, pirazofos o similares;

(7) a base de ditiolano: isoprotiolano o similares;

60 (8) a base de carboxamida: benodanilo, boscalid, carboxina, fenfurano, flutolanilo, furametpir, mepronilo, oxicarboxina, pentiopirad, tifulzamida o similares;

(9) a base de hidroxil(2-amino)pirimidina: bupirimato, dimetirimol, etirimol o similares;

(10) fungicidas de AP (a base de anilino pirimidinas): ciprodinilo, mepanipirim, pirimetanilo o similares;

(11) a base de N-fenilcarbamat: dietofencarb o similares;

65 (12) Fungicidas de Qol (a base de inhibidor de Qo ): azoxistrobina, picoxistrobina, piraclostrobina, kresoxim-metilo, trifloxistrobina, dimoxistrobina, metominostrobin, orisastrobina, famoxadona, fluoxastrobina,



- fenamidona, metominofeno o similares;
- (13) fungicidas de PP (a base de fenilpirrol): fepiconilo, fludioxonilo o similares;
- (14) a base de quinolina: quinoxifeno o similares;
- 5 (15) fungicidas de AH (a base de hidrocarburo aromático): bifenilo, cloroneb, diclorano, quintoceno, tecnazeno, tolclofos-metilo o similares;
- (16) a base de MBI-R: ftalida, piroquilón, triciclazol o similares;
- (17) a base de MBI-D: carpropamid, diclocimet, fenoxanilo o similares;
- (18) agentes de SBI: fenhexamid, piributicarb, terbinafina o similares;
- 10 (19) fenilureas: pencycuron o similares;
- (20) fungicidas de Qil (inhibidores de Qi): ciazofamid o similares;
- (21) a base de benzamida: zoxamida o similares;
- (22) a base de enopiraurona: blastidina, mildiomicina o similares;
- (23) a base de hexopiranosilo: kasugamicina o similares;
- 15 (24) a base de glucopiranosilo: estreptomina, validamicina o similares;
- (25) a base de cianoacetoamida: cimoxanilo o similares;
- (26) a base de carbamato: idocarb, propamocarb, protiocarb, policarbamato o similares;
- (27) agentes de desacoplamiento: binapacril, dinocap, ferimzona, fluazinam o similares;
- (28) compuestos de estaño orgánico: acetato de trifenilestaño, cloruro de trifenilestaño, hidróxido de trifenilestaño o similares;
- 20 (29) ésteres de fosfato: ácido fosfónico, tolclofos-metilo, fosetilo o similares;
- (30) a base de ftalamida: tecloftalam o similares;
- (31) a base de benzotriazina: triazóxido o similares;
- (32) a base de benceno sulfonamida: flusulfamida o similares;
- 25 (33) piridazinonas: diclomezina o similares;
- (34) fungicida de CAA (a base de amida carboxílica): dimetomorf, flumorf, bentiavalicarb, iprovalicarb, mandipropamida o similares;
- (35) tetraciclinas: oxitetraciclina o similares;
- (36) a base de tiocarbamato: metasulfocarb o similares; y,
- 30 (37) otros compuestos: etridiazol, polioxinas, ácido oxolínico, hidroxiisoxazol, octinolina, siltiofam, diflumentorim, acibenzolar-s-metilo, probenazol, tiadinilo, etaboxam, ciflufenamid, proquinazid, metrafenona, fluopicolida, hidróxido cúprico, cobre orgánico, azufre, ferbam, manzeb, maneb, metiram, propineb, tiuram, zineb, ziram, captano, captafol, folpet, clortalonilo, diclofluanida, tolifluanida, dodina, guazatina, acetato de iminocadina, dodecibenceno sulfonato de iminocadina, anilazina, ditianona, cloropicrina, dazomet, sal metam sódica, cinometionat, ciprofuram, siltiofam, agrobacterium, fluoroimida.

Los ejemplos de los reguladores del crecimiento de las plantas incluyen:

ácido abscísico, ácido indol butírico, uniconazol, clozato de etilo, etefon, cloxifonac, clormequat, extracto de clorella, peróxido de calcio, cianamida, diclorprop, giberelina, daminozida, alcohol decílico, trinexapac-etilo, cloruro de mepiquat, paclobutrazol, cera de parafina, butóxido de piperonilo, piraflufen etilo, flurprimidol, prohidrojasmon, prohexadiona-calcio, bencilaminopurina, pendimetalina, forclorfenuron, hidrazida maleato potásica, 1-naftilacetoamida, 4-CPA, MCPB, colina, sulfato de oxiquinolona, clozato de etilo, butralina, 1-metilciclopropeno, clorhidrato de aviglicina.

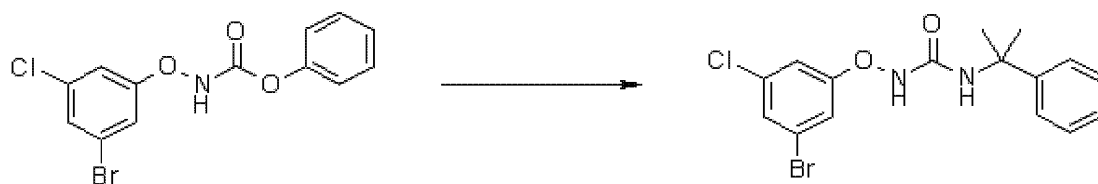
### Ejemplos

A continuación se proporcionan Ejemplos y Ejemplos de referencia ("Ref.") para explicar la presente invención más específicamente. Sin embargo, la presente invención no está limitada por los siguientes Ejemplos.

Ejemplos de referencia

(i) Producción de 1-(3-bromo-5-clorofenoxi)-3-(2-fenilpropan-2-il)urea

[Fórmula química 18]



Se disolvieron 3,00 g de 3-bromo-5-clorofenoxicarbamato de fenilo en 50 ml de tetrahidrofurano. La solución resultante se añadió a una mezcla de 1,54 g de cumilamina y 1,15 g de trietilamina, seguido de agitación durante 5 horas, mientras se calentaba a reflujo. Después, el disolvente de reacción se eliminó por destilación a presión

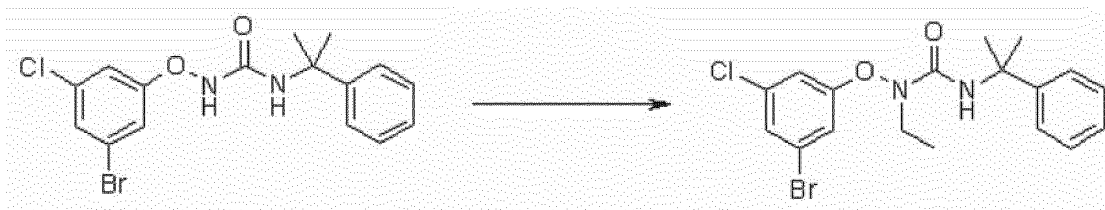
reducida. El residuo resultante se purificó parcialmente por cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: hexano: acetato de etilo = 3:1). El cristal en bruto resultante se lavó con hexano para obtener 1-(3-Bromo-5-clorofenoxi)-3-(2-fenilpropan-2-il)urea (2,89 g, rendimiento: 86 %).

- 5 Las propiedades físicas de 1-(3-bromo-5-clorofenoxi)-3-(2-fenilpropan-2-il)urea se muestran a continuación.  
 $^1\text{H}$  RMN ( $\text{CDCl}_3/\text{TMS}$ ,  $\delta$  (ppm)) 7,39-7,17(m, 9H), 5,79 (s, 1H), 1,73 (s, 6H)

(ii) Producción 1-(3-bromo-5-clorofenoxi)-1-etil-3-(2-fenilpropan-2-il)urea (compuesto n.º 1-24)

10

[Fórmula química 19]



15

Se disolvieron 2,89 g de 1-(3-bromo-5-clorofenoxi)-3-(2-fenilpropan-2-il)urea en 30 ml de N,N-dimetilformamida. La solución resultante se añadió a una mezcla de 5,18 g de carbonato potásico y 1,17 g de yodoetano seguido de agitación durante una noche a temperatura ambiente. Después se añadió acetato de etilo a la solución resultante. La mezcla resultante se lavó con cloruro de amonio, y la capa orgánica se secó con sulfato de magnesio. Tras la filtración, el disolvente se eliminó por destilación. Los residuos resultantes se purificaron por cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: hexano: acetato de etilo = 5 : 1) para obtener el compuesto diana de 1-(3-bromo-5-clorofenoxi)-1-etil-3-(2-fenilpropan-2-il)urea (2,86 g, rendimiento: 92 %),

20

Las propiedades físicas de 1-(3-bromo-5-clorofenoxi)-1-etil-3-(2-fenilpropan-2-il)urea se muestran a continuación.

$^1\text{H}$  RMN ( $\text{CDCl}_3/\text{TMS}$ ,  $\delta$  (ppm)) 7,34-7,32(m, 4H), 7,28-7,22(m, 3H), 7,15 (t, 1H). 5,91 (s, 1H), 3,60 (c, 2H). 1,68 (s, 6H), 1,12 (t, 3H)

25

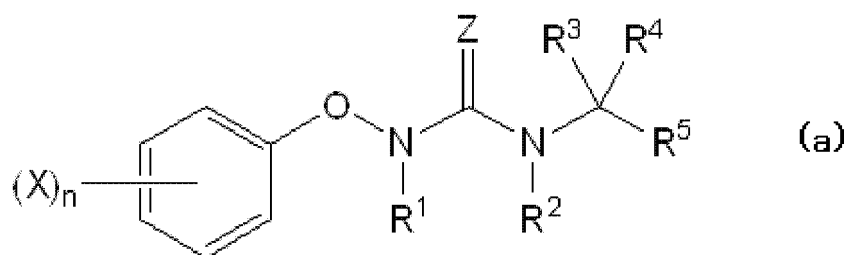
Los Ejemplos y Ejemplos de referencia obtenidos por los métodos descritos anteriormente se muestran en las Tablas 1 a 17. Las Tablas 1 a 10 muestran los sustituyentes para el Compuesto (a), incluyendo compuestos de la invención y compuestos de referencia. Las Tablas 11 a 14 muestran los sustituyentes para el Compuesto (b), incluyendo compuestos de la invención y compuestos de referencia. Las Tablas 15 a 17 muestran los sustituyentes para los Compuestos de referencia (c) y (d). Además, las Tablas 1 a 17 muestran solo una parte de los compuestos de ariloxiurea de la presente invención. Todas las tablas de referencia comprenden compuestos que están fuera del alcance del presente conjunto de reivindicaciones.

30

Además, las abreviaturas descritas en las tablas tienen los significados que se definen a continuación:

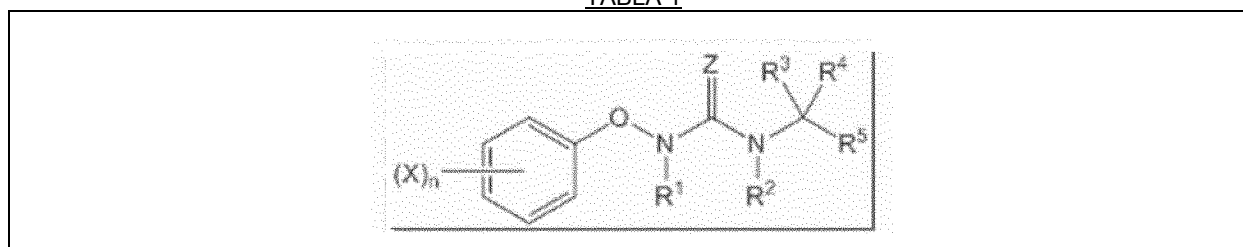
35

[Fórmula química 20]



40 [Tabla 1]

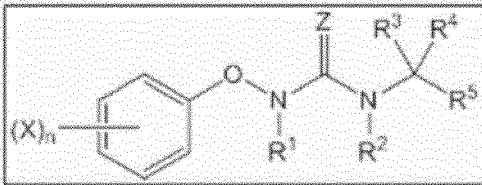
TABLA 1



ES 2 708 678 T3

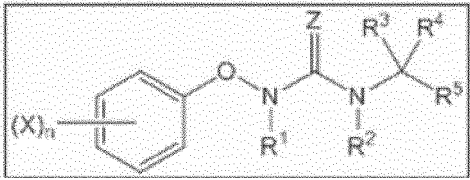
N.º	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
Ref. 1-1	Et	H	Me	Me	Me	3-Br-6-Cl	O	80-81
Ref. 1-2	Et	H	Me	Me	Me	3-CF <sub>3</sub>	O	aceite viscoso
Ref. 1-3	Et	H	Me	Me	Me	3-Br-5-Cl	O	aceite viscoso
Ref. 1-4	Et	H	Me	Me	Me	2-Cl-5-(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	O	aceite viscoso
Ref. 1-5	Et	H	Me	Me	Me	3,5-Cl <sub>2</sub>	O	aceite viscoso
Ref. 1-6	Et	H	Me	Me	Me	3-OH-4-NO <sub>2</sub>	O	82-83
Ref. 1-7	Et	H	Me	Me	Me	4-Ac	O	63-65
Ref. 1-8	Et	H	Me	Me	Me	3-Cl-5-CN	O	aceite viscoso
Ref. 1-9	Et	H	Me	Me	Me	3-Cl-5-OMe	O	aceite viscoso
Ref. 1-10	Et	H	Me	Me	Me	3-Br-4,5-Cl <sub>2</sub>	O	59-63
Ref. 1-11	Et	H	Me	Me	Me	3-Cl-5-(4-Cl-Ph)	O	95-97
Ref. 1-12	Et	H	Me	Me	Me	3-Cl-5-(4-OMe-Ph)	O	aceite viscoso
Ref. 1-13	Et	H	Me	Me	Me	4-NO <sub>2</sub>	O	92-94
Ref. 1-14	Et	H	Me	Me	Me	3-Br-5-OMe	O	aceite viscoso
Ref. 1-15	Et	H	Me	Me	Me	3-Br-5-Me	O	aceite viscoso
Ref. 1-16	Et	H	Me	Me	Me	2,4-Cl <sub>2</sub>	O	aceite viscoso
Ref. 1-17	Et	H	Me	Me	Me	2,5-Me <sub>2</sub> -4-NO <sub>2</sub>	O	123-125
Ref. 1-18	Et	H	Me	Me	Me	3-Br-5-CO <sub>2</sub> Me	O	124-126
Ref. 1-19	Et	H	Me	Me	Me	2,3,5-Br <sub>3</sub>	O	aceite viscoso
Ref. 1-20	Et	H	Me	Me	Me	3,5-Br <sub>2</sub> -4-Cl	O	91-93
Ref. 1-21	Et	H	Me	Me	Me	3,4,5-Br <sub>3</sub>	O	86-88
Ref. 1-22	Et	H	Me	Me	Me	3-Br-2-Cl	O	aceite viscoso
Ref. 1-23	Et	H	Me	Me	Me	3,5-Br <sub>2</sub> -4-OMe	O	87-89
1-24	Et	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-Gl	O	92-93
1-25	Et	H	Me	Me	Ph	3,4-Cl <sub>2</sub>	O	74-76

[Tabla 2]

								
N.º	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
1-26	Et	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-CF <sub>3</sub>	O	112-114
1-27	Et	H	Me	Me	Ph	3,5-Br <sub>2</sub>	O	103-105
1-28	Et	H	Me	Me	Ph	3-Br-4,5-Cl <sub>2</sub>	O	100-102
1-29	Et	H	Me	Me	Ph	3,5-Cl <sub>2</sub>	O	91-93
1-30	Et	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-F	O	67-69

1-31	Et	H	Me	Me	Ph	3,5-F <sub>2</sub>	0	94-96
1-32	Et	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-CN	0	108-110
1-33	Et	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-NO <sub>2</sub>	0	111-113
1-34	Et	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-SO <sub>2</sub> Me	0	127-129
1-35	Et	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-OMe	0	aceite viscoso
1-36	Et	H	Me	Me	Ph	4-CF <sub>3</sub>	0	112-114
1-37	Et	H	Me	Me	Ph	2,5-Me <sub>2</sub> -4-NO <sub>2</sub>	0	87-89
1-38	Et	H	Me	Me	Ph	2,3,5-Br <sub>3</sub>	0	124-126
1-39	Et	H	Me	Me	Ph	3,4-Br <sub>2</sub>	0	81-83
1-40	Et	H	Me	Me	Ph	3-Br-4-Cl	0	89-91
1-41	Et	H	Me	Me	Ph	3,5-Br <sub>2</sub> -4-Cl	0	114-116
1-42	Et	H	Me	Me	Ph	3,4,5-Br <sub>3</sub>	0	97-99
1-43	Et	H	Me	Me	Ph	3-Br-2-Cl	0	67-69
1-44	Et	H	Me	Me	Ph	5-Br-2-Cl	0	67-69
1-45	Et	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-CO <sub>2</sub> Me	0	87-89
1-46	Et	H	Me	Me	Ph	-	0	aceite viscoso
1-47	Et	H	Me	Me	Ph	3-Cl	0	69-71
1-48	Et	H	Me	Me	Ph	2-Cl	0	50-52
1-49	Et	H	Me	Me	Ph	2,6-Cl <sub>2</sub>	0	153-155
Ref. 1-50	Et	H	Me	Me	CH=N-OMe	3-Br-5-Cl	0	aceite viscoso

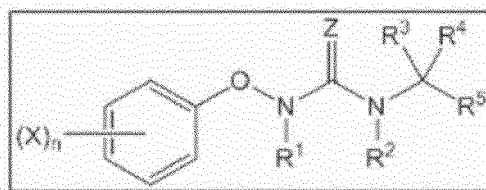
[Tabla 3]

								
N.º	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
1-51	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	0	130-131
Ref. 1-52	Et	H	Me	Me	Bn	3-Br-5-Cl	0	aceite viscoso
1-53	Et	H	Me	Me	3-Me-Ph	3-Br-5-Cl	0	76-77
1-54	Et	H	Me	Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Br-5-Cl	0	100-102
1-55	Et	H	Me	Me	6-Me-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	0	aceite viscoso
1-56	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Br <sub>2</sub> -4-Cl	0	aceite viscoso
Ref. 1-57	Et	H	Me	Me	CO <sub>2</sub> Et	3-Br-5-Cl	0	67-69
Ref. 1-58	Et	H	Me	Me	CO <sub>2</sub> H	3-Br-5-Cl	0	138-140
Ref. 1-59	Et	H	Me	Me	CN	3-Br-5-Cl	0	193-195
1-60	Et	H	Me	Me	3-Me-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	0	84-86
1-61	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Cl <sub>2</sub>	0	119-121
1-62	Et	H	Me	Me	5-Me-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	0	101-103

ES 2 708 678 T3

1-63	Et	H	Me	Me	4-Me-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	68-70
1-64	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Br <sub>2</sub> -4-OMe	O	aceite viscoso
1-65	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Br <sub>2</sub>	O	115-117
1-66	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Br <sub>2</sub> -4-OCHF <sub>2</sub>	O	aceite viscoso
1-67	Et	H	Me	Me	CONHEt	3-Br-5-Cl	O	158-160
1-68	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	117-119
1-69	Et	H	Me	Me	Pi-4-ilo	3-Br-5-Cl	O	120-121
1-70	Et	H	Me	Me	2-Me-Ph	3-Br-5-Cl	O	107-109
1-71	Et	H	Me	Me	CONEt <sub>2</sub>	3-Br-5-Cl	O	111-113
1-72	Et	H	Me	Me	4-Me-Ph	3-Br-5-Cl	O	96-98
1-73	Et	H	Me	Me	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Br-5-Cl	O	109-111
1-74	Me	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	98-100
1-75	Et	Et	Me	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	aceite viscoso

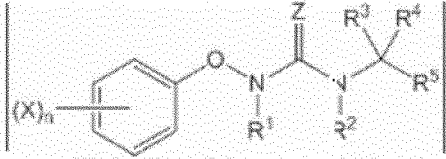
[Tabla 4]



N.º	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
1-76	<sup>n</sup> Pr	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	93-95
1-77	-C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -		Me	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	aceite viscoso
1-78	Bn	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	128-130
1-79	alilo	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	103-105
1-80	CH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	113-115
1-81	Pr	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	134-136
1-82	<sup>o</sup> Bu	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	97-99
1-83	CH <sub>2</sub> OMe	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	120-122
1-84	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	119-121
1-85	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	98-100
1-92	<sup>i</sup> Pr	H	Me	Me	3-Me-Ph	3-Br-5-Cl	O	119-120
1-86	-C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> -		Me	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	123-125
1-87	Ac	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	132-134
1-88	<sup>i</sup> Bu	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	118-120
1-89	CO <sub>2</sub> Ma	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	180-182
1-90	Et	H	H	H	Ph	3-Br-5-Cl	O	140-141
1-91	Et	H	Me	H	Ph	3-Br-5-Cl	O	130-131
1-93	Et	H	H	H	Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	aceite viscoso

1-94	Me	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	128-130
1-95	Et	Me	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	amorfo
1-96	<sup>n</sup> Pr	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	aceite viscoso
1-97	CH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	131-133
1-98	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	aceite viscoso
1-99	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Br <sub>2</sub> -4-F	O	aceite viscoso
1-100	Et	H	Me	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Br-5-Cl	O	121-123

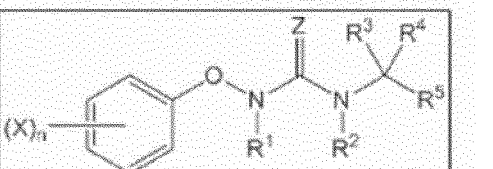
[Tabla 5]

								
N.º	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
1-101	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Cl <sub>2</sub> -4-Me	O	aceite viscoso
1-102	Et	H	Me	Me	2-MeO-Ph	3-Br-5-Cl	O	76-78
1-103	Et	H	Me	Me	Pi-3-ilo	3-Br-5-Cl	O	104-106
Ref. 1-104	Et	H	Me	Me	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-Br-5-Cl	O	22,3-1,5279
Ref. 1-105	Et	H	Me	Me	CH <sub>2</sub> OEt	3-Br-5-Cl	O	22,1-1,5214
Ref. 1-106	Et	H	Me	Me	CHO <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Et	3-Br-5-Cl	O	20,8-1,5130
Ref. 1-107	Et	H	Me	Me	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H	3-Br-5-Cl	O	121-123
Ref. 1-108	Et	H	Me	Me	C≡CH	3-Br-5-Cl	O	81-83
Ref. 1-109	Et	H	Me	Me	CH <sub>2</sub> CONH <sub>2</sub> Et	3-Br-5-Cl	O	86-89
1-110	Et	H	Me	Me	CON(Me) <sub>2</sub>	3-Br-5-Cl	O	138-140
1-111	Et	H	Me	Me	CONHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	3-Br-5-Cl	O	105-107
Ref. 1-112	Et	H	Me	Me	Me	3-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> -4	O	aceite viscoso
Ref. 1-113	Et	H	Me	Me	Me	4-MeSO <sub>2</sub>	O	117-118
1-114	Et	H	Me	Me	CONHMe	3-Br-5-Cl	O	146-148
Ref. 1-115	Et	H	Me	Me	CH <sub>2</sub> O(Pi-2-ilo)	3-Br-5-Cl	O	22,4-1,5534
1-116	Et	H	Me	Me	CONH <sup>i</sup> Pr	3-Br-5-Cl	O	amo
1-117	Et	H	Me	Me	CO(Piperidin-1-ilo)	3-Br-5-Cl	O	150-152
1-118	Et	H	Me	Me	CONHPh	3-Br-5-Cl	O	78-80
1-119	Et	H	Me	Me	CONH <sup>n</sup> Bu	3-Br-5-Cl	O	aceite viscoso
1-120	Et	H	Me	Me	CONHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-Br-5-Cl	O	129-131
1-121	Et	H	Me	Me	CONHCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr	3-Br-5-Cl	O	amo
1-122	Et	H	Me	Me	CONHBn	3-Br-5-Cl	O	amo
Ref. 1-123	Et	H	Me	Me	CH <sub>2</sub> NHCO <sub>2</sub> Et	3-Br-5-Cl	O	71-72
1-124	Et	H	Me	Me	CONHCH <sub>2</sub> C≡CH	3-Br-5-Cl	O	aceite viscoso
Ref. 1-125	Et	H	Me	Me	CH=N-OBn	3-Br-S-Cl	O	aceite viscoso

[Tabla 6]

								
N.º	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
Ref. 126	Et	H	Bn	H	CO <sub>2</sub> Me	3-Br-5-Cl	O	115-117
Ref. 1-127	Et	H	Me	Me	CH <sub>2</sub> NHAc	3-Br-5-Cl	O	99-100
Ref. 1-128	Et	H	Me	Me	CH <sub>2</sub> NHCOPh	3-Br-5-Cl	O	154-155
1-129	Et	H	Me	Me	CONH <sup>c</sup> Pr	3-Br-5-Cl	O	155-157
1-130	Et	H	Me	Me	CONH <sup>c</sup> Pen	3-Br-5-Cl	O	133-135
Ref. 1-131	Et	H	Me	H	CO <sub>2</sub> Me	3-Br-5-Cl	O	81-8:3
Ref. 1-132	Et	H	Me	Me	CO <sub>2</sub> Et	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	aceite viscoso
Ref. 1-133	Et	H	Me	Me	CO <sub>2</sub> H	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	150-152
1-134	Et	H	Me	Me	CONH <sup>s</sup> Bu	3-Br-5-Cl	O	amo
1-135	Et	H	Me	Me	CONHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	aceite viscoso
1-136	Et	H	Me	Me	CONH <sup>i</sup> Pr	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	amo
1-137	Et	H	Me	Me	CONH <sup>c</sup> Hex	3-Br-5-Cl	O	amo
1-138	Et	H	Me	Me	CONH <sup>t</sup> Bu	3-Br-5-Cl	O	143-145
Ref. 1-139	Et	H	Me	H	CO <sub>2</sub> H	3-Br-5-Cl	O	127-129
Ref. 1-140	Et	H	Me	Me	C(Me)=N-OMe	3-Br-5-Cl	O	57-58
1-141	Et	H	Me	H	CONH <sup>i</sup> Pr	3-Br-5-Cl	O	161-163
1-142	Et	H	Me	H	CONHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-Br-5-Cl	O	154-156
Ref. 1-143	Et	H	Me	Me	<sup>c</sup> Hex	3-Br-5-Cl	O	85-86
Ref. 1-144	Et	H	Me	Me	Et	3-Br-5-Cl	O	206-15166
Ref. 1-145	Et	H	Me	Me	C(Me)=N-OCH <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pr	3-Br-5-Cl	O	116-117
Ref. 1-146	Et	H	Me	Me	C(Me)=N-OBn	3-Br-5-Cl	O	76-77
Ref. 1-147	Et	H	Me	Me	<sup>n</sup> Hex	3-Br-5-Cl	O	210-1,4993
Ref. 1-148	Et	H	Me	Me	<sup>t</sup> Bu	3-Br-5-Cl	O	206-15116
1-149	Et	H	Me	Me	CONHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>	O	99-101
Ref. 1-150	Et	H	Me	Me	CO <sub>2</sub> Et	3,4-Cl <sub>2</sub>	O	56-58

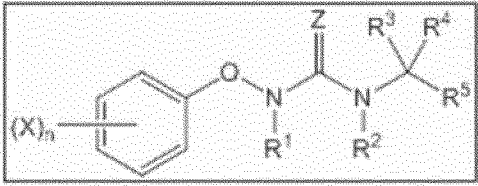
[Tabla 7]

								
N.º	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)

ES 2 708 678 T3

Ref. 1-151	Et	H	Me	Me	CO <sub>2</sub> H	3,4-Cl <sub>2</sub>	O	123-125
1-152	Et	H	Me	Me	CONH <sup>i</sup> Pr	3,4-Cl <sub>2</sub>	O	amo
1-153	Et	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		Ph	3-Br-5-Cl	O	150-152
1-154	Et	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		Ph	3-Br-5-Cl	O	103-105
1-155	Et	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		Ph	3-Br-5-Cl	O	85-87
1-156	Et	H	<sup>i</sup> Pr	H	Ph	3-Br-5-Cl	O	149-151
1-157	Et	H	Ph	H	Ph	3-Br-5-Cl	O	156-158
1-158	Et	H	Ph	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	83-85
1-159	Et	H	Et	Et	Ph	3-Br-5-Cl	O	110-112
1-160	Et	H	Me	Me	2-F-Ph	3-Br-5-Cl	O	98-100
1-161	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,4-Cl <sub>2</sub>	O	20,2-1,5458
1-162	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Br <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O	O	aceite viscoso
1-163	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Br <sub>2</sub> -4- <sup>n</sup> HexO	O	85-87
1-164	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Cl <sub>2</sub> -4-Ph	O	amo
1-165	Et	CH <sub>2</sub> OMe	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	aceite viscoso
1-166	Et	CO <sub>2</sub> Me	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	aceite viscoso
1-167	Et	H	Me	CN	Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	164-165
1-168	Et	Ac	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	117-119
1-169	Et	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	138-140
1-170	Et	CO(SMe)	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	amo
1-171	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-4-ON	O	64-66
1-172	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	4-MeSO <sub>2</sub>	O	aceite viscoso
1-173	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-4-Ac	O	aceite viscoso
1-174	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-4-CHO	O	94-96
1-175	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-4-CO <sub>2</sub> Me	O	aceite viscoso

[Tabla 8]

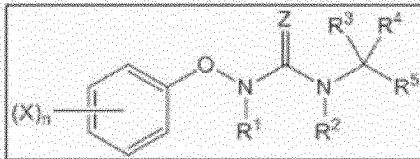
								
N.º	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
1-176	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-4-CO <sub>2</sub> H	O	149-151
1-177	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-4-CHF <sub>2</sub>	O	66-68
1-178	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,4,5-Cl <sub>3</sub>	O	92-94
1-179	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-4-Br	O	61-63
1-180	Et	H	Me	Me	4-MeO-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	aceite viscoso
1-181	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-O-4-NO <sub>2</sub>	O	aceite viscoso



ES 2 708 678 T3

1-182	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-5-I	O	130-132
1-183	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-5-F	O	79-81
1-184	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Me-4-NO <sub>2</sub>	O	aceite viscoso
1-185	Et	H	Me	Me	4-CF <sub>3</sub> -Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	74-76
1-186	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-4,5-Cl <sub>2</sub>	O	aceite viscoso
1-187	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-5-CN	O	130-132
1-188	Et	H	Me	Me	1-Oxi-Pi-2-ilo	3,4-Cl <sub>2</sub>	O	106-107
1-189	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,4-Br <sub>2</sub> -5-Cl	O	104-106
1-190	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Cl <sub>2</sub> -4-CN	O	94-96
1-191	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-5-CF <sub>3</sub>	O	54-96
1-192	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-5-MeO	O	66-68
1-193	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,4-Br <sub>2</sub>	O	20,6-1,5483
1-194	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,4-Br <sub>2</sub> -6-F	O	aceite viscoso
1-195	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	-	O	72-74
1-196	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	O	23,3-1,5070
1-197	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-4-Me	O	55-57
1-198	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl	O	232-1 4955
1-199	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-F-4-Cl	O	47-49
1-200	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-6-Cl	O	aceite viscoso

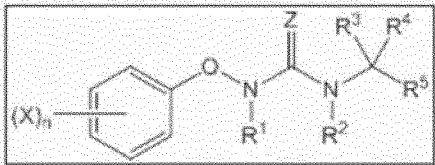
[Tabla 9]

								
N.º	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
1-201	Et	H	Me	Me	4-Ph-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	140-142
1-202	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Me-4-Cl	O	54-56
1-203	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-(GF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	23, 0-1,4604
1-204	Et	H	Me	Me	6-F-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	67-69
1-205	Et	H	Me	Me	6-Cl-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	22,9-1,5661
1-206	Et	H	Me	Me	3-F-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	110-112
1-207	Et	H	Me	Me	6-Cl-Pi-2-ilo	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	amo
1-208	Et	H	Me	Me	5-F-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	98-100
1-209	Et	H	Me	Me	Tiofen-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	85-86
1-210	Et	H	Me	Me	Furan-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	83-84
1-211	Et	H	Me	Me	Tiazit-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	71-72
1-212	Et	H	Me	Me	Pirazin-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	20,5-1,5400
1-213	Et	H	Me	Me	Pirimidin-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	137-138

ES 2 708 678 T3

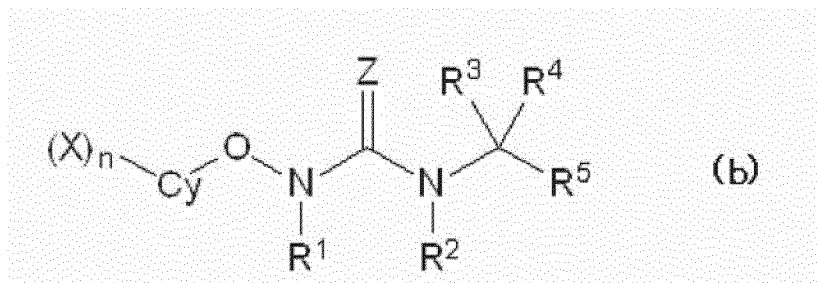
1-214	Et	H	Me	Me	[1,2,4]Oxadiazol-3-ilo	3-Br-5-Cl	O	aceite viscoso
1-215	Et	H	Me	Me	4-Me-tiazol-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	94-96
1-216	Et	H	Me	Me	Pirimidin-4-ilo	3-Br-5-Cl	O	aceite viscoso
1-217	Et	H	Me	Me	1H-Pirazol-3-ilo	3-Br-5-Cl	O	149-150
1-218	Et	H	Me	Me	1-Me-1H-pirazol-3-ilo	3-Br-5-Cl	O	20,5-1,5310
1-219	Et	H	Me	Me	1-Me-1H-pirazol-5-ilo	3-Br-5-Cl	O	138-140
1-220	Et	H	Me	Me	Isoxazol-5-ilo	3-Br-5-Cl	O	aceite viscoso
1-221	Et	H	Me	Me	4-Et-tiazol-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	107-108
1-222	Et	H	Me	Me	4,5-Me <sub>2</sub> -tiazol-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	73-76
1-223	Et	H	Me	Me	1- <sup>t</sup> Bu-1H-pirazol-3-ilo	3-Br-5-Cl	O	94-95
1-224	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	H	Me	Me	Pirimidin-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	154-156
1-225	Et	H	Me	Me	1-CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -1H-pirazol-5-ilo	3-Br-5-Cl	O	112-114

[Tabla 10]

								
N.º	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
1-226	Et	H	Me	Me	[1,2,4]Triazin-3-ilo	3-Br-5-Cl	O	100-101
1-227	Et	H	Me	Me	1-Et-1H-[1,2,4]triazol-3-ilo	3-Br-5-Cl	O	116-118
1-228	Et	H	Me	Me	Piridazin-3-ilo	3-Br-5-Cl	O	amo
1-229	Et	H	Me	Me	2-Me-2H-tetrazol-5-ilo	3-Br-5-Cl	O	aceite viscoso
1-230	Et	H	Me	Me	Pirimidin-2-ilo	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	127-128
1-231	Et	H	Me	Me	4,5-Dihidro-oxazol-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	134-135
1-232	Et	H	Me	Me	5-Me-Pirimidin-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	106-107
1-233	Et	H	Me	Me	Pirimidin-2-ilo	3,4-Cl <sub>2</sub>	O	aceite viscoso
1-234	Et	H	Me	Me	4,5-Me <sub>2</sub> -tiazol-2-ilo	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	119-120
1-235	Et	H	Me	Me	4,5-Me-tiazol-2-ilo	3,4-Cl <sub>2</sub>	O	204-1,5520
1-236	Et	H	Me	Me	4-Me-Pirimidin-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	aceite viscoso
1-237	Et	H	Me	Me	4-Me-Pirimidin-2-ilo	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	aceite viscoso
1-238	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-4-(Pi-2-ilo)	O	95-97
1-239	Et	H	Me	Me	Quinolin-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	amo

1-240	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-4-C(Me)=N- OMe	O	aceite viscoso
-------	----	---	----	----	----------	------------------------	---	----------------

[Fórmula química 21]



[Tabla 11]

Tabla 11

N.º	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Cy	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
Ref. 2-1	Et	H	Me	Me	Me	Quinolin-6-ilo	3-Br	O	85-89
Ref. 2-2	Et	H	Me	Me	Me	Quinolin-6-ilo	-	O	109-112
Ref. 2-3	Et	H	Me	Me	Me	Quinolin-7-ilo	6-OMe	O	90-92
Ref. 2-4	Et	H	Me	Me	Me	Quinolin-6-ilo	3-Br-7-F	O	116-118
Ref. 2-5	Et	Et	Me	Me	Me	Quinolin-6-ilo	3-Br	O	114-116
Ref. 2-6	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	Me	Me	Me	Quinolin-6-ilo	3-Br	O	105-107
Ref. 2-7	Et	H	Me	Me	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	Quinolin-6-ilo	3-Br	O	67-68
Ref. 2-8	Et	H	Me	Me	C≡CMe	Quinolin-6-ilo	3-Br	O	86-88
Ref. 2-9	Et	H	Me	Me	Me	Quinolin-2-ilo	-	O	101-102
2-10	Et	H	Me	Me	Ph	Quinolin-6-ilo	3-Br	O	115-116
Ref. 2-11	Et	H	Me	Me	CH=N-OMe	Quinolin-6-ilo	3-Br	O	aceite viscoso
Ref. 2-12	Et	H	Me	Me	Me	Quinolin-4-ilo	7-Cl	O	114-116
2-13	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Quinolin-6-ilo	3-Br	O	110-111
Ref. 2-14	Et	H	Me	Me	Bn	Quinolin-6-ilo	3-Br	O	124-125
Ref. 2-15	Et	H	Me	Me	Me	Pirimidin-2-ilo	4-CF <sub>3</sub>	O	aceite viscoso
Ref. 2-16	Et	H	Me	Me	Me	Pirimidin-4-ilo	6-CF <sub>3</sub>	O	aceite viscoso

Ref. 2-17	Et	H	Me	Me	Me	Pirimidin-4-ilo	2-CF <sub>3</sub>	O	75-77
2-18	Et	H	Me	Me	Ph	Pirimidin-2-ilo	4,6-Me <sub>2</sub>	O	61-63
Ref. 2-19	Et	H	Me	Me	Me	Pi-2-ilo	6-CF <sub>3</sub>	O	72-75
Ref. 2-20	Et	H	Me	Me	Me	Pi-2-ilo	6-Cl-5-CN-4-Me	O	75-78
Ref. 2-21	Et	H	Me	Me	Me	Pi-2-ilo	6-Cl-3-CN-4-Me	O	113-115
Ref. 2-22	Et	H	Me	Me	Me	Pi-4-ilo	2,6-Cl <sub>2</sub>	O	115-117
2-23	Et	H	Me	Me	Ph	Pi-2-ilo	4-CF <sub>3</sub>	O	aceite viscoso
2-24	Et	H	Me	Me	Ph	Pi-2-ilo	6-Cl-4-CF <sub>3</sub>	O	97-99
2-25	Et	H	Me	Me	Ph	Pi-2-ilo	6-Br	O	82-85

[Tabla 12]

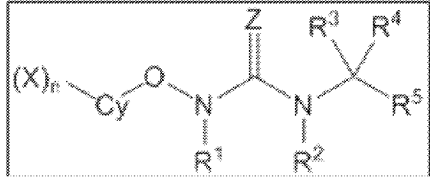
Tabla 12

N.º	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Cy	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
2-26	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	6-Cl-4-CF <sub>3</sub>	O	90-92
Ref. 2-27	Et	H	Me	Me	Me	Piridazin-3-ilo	6-CF <sub>3</sub>	O	119-121
2-28	Et	H	Me	Me	Ph	Piridazin-3-ilo	6-CF <sub>3</sub>	O	124-126
2-29	Et	H	Me	Me	Ph	Piridazin-3-ilo	6-Cl	O	114-116
2-30	Et	H	Me	Me	Ph	Naftalen-2-ilo	-	O	52-54
Ref. 2-31	Et	Ac	Me	Me	Me	Quinolin-6-ilo	3-Br	O	
Ref. 2-32	Et	H	Me	Me	Me	Quinolin-3-ilo	-	O	82-84
2-33	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Quinolin-3-ilo	-	O	vis
Ref. 2-34	Et	H	Me	Me	Me	Quinolin-4-ilo	-	O	vis
2-35	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Quinolin-4-ilo	-	O	vis
2-36	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Quinoxalin-2-ilo	-	O	via
2-37	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Quinolin-6-ilo	-	O	amo
2-38	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Quinolin-2-ilo	-	O	vis
2-39	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Quinolin-6-ilo	-	O	112-114
2-40	C <sub>2</sub> HCF <sub>3</sub>	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Quinolin-6-ilo	3-Br	O	101-103
Ref. 2-41	Et	H	Me	Me	Me	Isoquinolin-6-ilo	-	O	113-115
2-42	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Isoquinolin-6-ilo	-	O	amo
2-43	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Quinolin-6-ilo	2-Me	O	via
2-44	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Quinolin-6-ilo	3-Me	O	amo

2-45	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Isoquinolin-1-ilo	3-Cl	O	109-111
2-46	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-3-ilo	5-Br	O	112-114
2-47	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	5-CF <sub>3</sub> -6-Cl	O	vis
2-48	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	3-Cl-5-CF <sub>3</sub>	O	vis
2-49	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	4-CO <sub>2</sub> Me-6-Cl	O	vis
2-50	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-4-ilo	2,6-Cl <sub>2</sub>	O	87-89

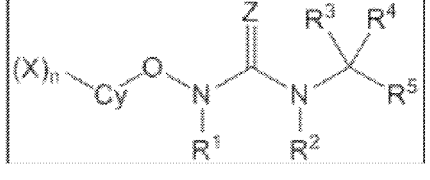
[Tabla 13]

Tabla 13

									
N.º	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Cy	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
2-51	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	4-Me-6-Cl	O	119-121
2-52	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	4-MeO-6-Cl	O	73-75
2-53	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	4-CN-6-Cl	O	vis
2-54	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	6-Cl	O	vis
2-55	Et	H	Me	Me	Pirimidin-2-ilo	Pi-2-ilo	4-CF <sub>3</sub> -6-Cl	O	20,8-1,5101
2-56	Et	H	Me	Me	4,5-Me <sub>2</sub> -tiazol-2-ilo	Pi-2-ilo	4-CF <sub>3</sub> -6-Cl	O	97-98
2-57	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-4-ilo	2-Br-6-Me	O	vis
2-58	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	4-CF <sub>3</sub>	O	230-1,4915
2-59	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-4-ilo	2,6-Br <sub>2</sub>	O	136-138
2-60	Et	H	Me	Me	Pirimidin-2-ilo	Pi-2-ilo	4,6-Cl <sub>2</sub>	O	232-1,5290
2-61	Et	H	Me	Me	Pirimidin-2-ilo	Pi-4-ilo	2,6-Cl <sub>2</sub>	O	140-141
2-62	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	4,6-Cl <sub>2</sub>	O	88-89
2-63	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-4-ilo	2-Br-Cl	O	125-127
2-64	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-4-ilo	2-Cl	O	238-1,5248
2-85	Me	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-4-ilo	2,6-Cl <sub>2</sub>	O	111-112
2-66	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-4-ilo	2-Cl-6-N(Me) <sub>2</sub>	O	84-86
2-67	<sup>n</sup> Pr	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-4-ilo	2,6-Cl <sub>2</sub>	O	amo

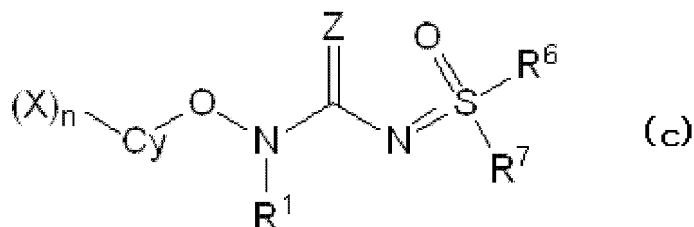
[Tabla 14]

Tabla 14

									
N.º	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Cy	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)

2-68	Et	H	Me	Me	6-Cl-Pi-2-ilo	Pi-4-ilo	2,6-Cl <sub>2</sub>	O	150-151
2-69	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	4-CF <sub>3</sub> -6- <sup>i</sup> Pr	O	228-1,4891
2-70	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-4-ilo	2-GN-6-Me	O	vis
2-71	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pirimidin-4-ilo	2-M-6-Cl	O	vis
2-72	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pirimidin-4-ilo	2,6-Cl <sub>2</sub>	O	vis
2-73	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-3-ilo	5,6-Cl <sub>2</sub>	O	90-92
2-74	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-4-ilo	2-Br-6-CF <sub>3</sub>	O	vis
2-75	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	4-Br-6-CF <sub>3</sub>	O	vis
2-76	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	4-N(Me)2-8-Cl	O	91-93
2-77	Et	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-3-ilo	6-Cl	O	62-64
2-78	Et	H	Me	Me	Pirimidin-2-ilo	Pi-3-ilo	6-Cl	O	amo

[Fórmula química 22]



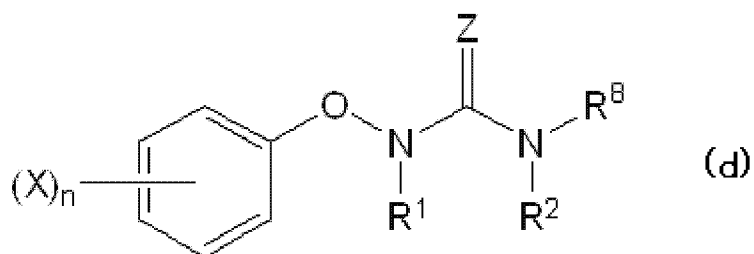
[Tabla 15]

Tabla de referencia 15

N.º	R <sup>1</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Cy	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
3-1	Et	Me	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	
3-2	Et		-C <sub>4</sub> H <sub>8</sub> -	Ph	3-Br-5-Cl	O	amorfo
3-3	Et	Me	Ph	Ph	3-Br-5-Cl	O	amorfo
3-4	Et	Me	Pi-2-ilo	Ph	3-Br-5-Cl	O	amorfo
3-5	Et	Me	Me	Ph	3,5-Cl <sub>2</sub>	O	
3-6	Et		-C <sub>4</sub> H <sub>8</sub> -	Ph	3,5-Cl <sub>2</sub>	O	
3-7	Et	Me	Ph	Ph	3,5-Cl <sub>2</sub>	O	
3-8	Et	Me	Pi-2-ilo	Ph	3,5-Cl <sub>2</sub>	O	
3-9	Et	Me	Me	Ph	3,5-Br <sub>2</sub>	O	
3-10	Et		-C <sub>4</sub> H <sub>8</sub> -	Ph	3,5-Br <sub>2</sub>	O	
3-11	Et	Me	Ph	Ph	3,5-Br <sub>2</sub>	O	
3-12	Et	Me	Pi-2-ilo	Ph	3,5-Br <sub>2</sub>	O	
3-13	Et	Me	Me	Quinolin-6-ilo	-	O	

3-14	Et		-C <sub>4</sub> H <sub>8</sub> -	Quinolin-6-ilo	-	O	
3-15	Et	Me	Ph	Quinolin-6-ilo	-	O	
3-16	Et	Me	Pi-2-ilo	Quinolin-6-ilo	-	O	
3-17	Et	Me	Me	Quinolin-6-ilo	3-Br	O	
3-18	Et		-C <sub>4</sub> H <sub>8</sub> -	Quinolin-6-ilo	3-Br	O	
3-19	Et	Me	Ph	Quinolin-6-ilo	3-Br	O	
3-20	Et	Me	Pi-2-ilo	Quinolin-6-ilo	3-Br	O	
3-21	Et	Me	<sup>n</sup> Bu	Ph	3-Br-5-Cl	O	89-9 1
3-22	Et	Me	Ph	Ph	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	117-120

[Fórmula química 23]



[Tabla 16]

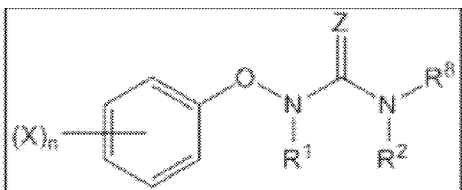
Tabla de referencia 16

N.º	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>8</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
4-1	Et	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	
4-2	Et	H	Ph	3-Br-5-Cl	O	107-109
4-3	Et	H	Indan-1-ilo	3-Br-5-Cl	O	95-96
4-4	Et	H	1,2,3,4-Tetrahidro-naftalen-1-ilo	3-Br-5-Cl	O	106-108
4-5	Et	H	5,6,7,8-Tetrahidro-quinolin-8-ilo	3-Br-5-Cl	O	80-83
4-6	Et	H	2-Ph- <sup>o</sup> Pr	3-Br-5-Cl	O	129-131
4-7	Et	H	Quinolin-8-ilo	3-Br-5-Cl	O	110-111
4-8	Et	H	CO <sub>2</sub> Et	3-Br-5-Cl	O	95-97
4-9	Et	H	CO <sub>2</sub> Me	3-Br-5-Cl	O	
4-10	Et	H	<sup>o</sup> Hex	3-Br-5-Cl	O	
4-11	Et	H	2-F-Ph	3-Br-5-Cl	O	
4-12	Et	H	3-Me-Ph	3-Br-5-Cl	O	
4-13	Et	H	3-GF <sub>3</sub> -Ph	3-Br-5-Cl	O	
4-14	Et	H	Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	
4-15	Et	H	6-Me-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	

4-16	Et	H	4-MeO-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	
4-17	Et	H	4-CF <sub>3</sub> -Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	
4-18	Et	H	6-F-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	
4-19	Et	H	Tiofen-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	
4-20	Et	H	Tiazol-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	
4-21	Et	H	Pirazin-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	
4-22	Et	H	Pirimidin-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	

[Tabla 17]

Tabla de referencia 17

						
N.º	R <sup>1</sup>	R <sub>2</sub>	R <sup>8</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
4-23	Et	Et	Ph	3-Br-5-Cl	O	
4-24	alilo	H	Ph	3-Br-5-Cl	O	
4-25	CH <sub>2</sub> OMe	H	Ph	3-Br-5-Cl	O	
4-26	ch <sub>2</sub> c≡ch	H	Ph	3-Br-5-Cl	O	
4-27	Et	CH <sub>2</sub> OMe	Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	
4-28	Et	CO <sub>2</sub> Me	Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	
4-29	Et	Ac	Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	

[Tabla 18]

N.º	<sup>1</sup> H RMN (CDCl <sub>3</sub> , δ ppm)
1-2	7,48~7,30 (m, 4H), 5,51 (s, 1H), 3,64 (c, 2H), 1,34 (s, 9H), 115 (t, 3H)
1-3	7,22~7,21 (m, 2H), 7,11 (t, 1H), 544 (s, 1H), 362 (c, 2H), 1,35 (s, 9H), 1,13 (t, 3H)
1-4	7,77 (s, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,65~7,54 (m, 3H), 7,46 (d, 1H), 7,25~7,22 (m, 1H), 5,87 (s, 1H), 3,72 (c, 2H), 1,37 (s, 9H), 1,23 (t, 3H)
1-5	7,06 (s, 3H), 5,43 (s, 1H), 3,62 (c, 2H), 1,35 (s, 9H), 1, 13 (t, 3H)
1-8	7,42 (dd, 1H), 7,35~7,33 (m, 2H), 5,41 (s, 1H), 3,63 (c, 2H), 1,35 (s, 9H), 1,14 (t, 3H)
1-9	6,75 (t, 1H), 6,62~6,59 (m, 2H), 5,47 (s, 1H), 3,79 (s, 3H), 3,62 (c, 2H), 1,34 (s, 9H), 1,14 (t, 3H)
1-12	7,52~7,47 (m, 2H), 7,24 (t, 1H), 7,20 (dd, 1H), 7,00~6,95 (m, 2H), 5,54 (s, 1H), 3,86 (s, 3H), 3,65 (c, 2H), 1,35 (s, 9H), 1,17 (t, 3H)
1-14	6,90 (t, 1H), 6,76 (t, 1H), 6,63 (t, 1H), 5,47 (a, 1H), 3,78 (s, 3H), 3,61 (c, 2H), 1,34 (s, 9H), 1,14 (t, 3H)
1-15	7,11 (s, 1H), 7,03 (s, 1H), 6,87 (s, 1H), 5,49 (a, 1H), 3,61 (c, 2H), 2,32 (s, 3H), 1,34 (s, 9H), 1,13 (t, 3H)
1-16	7,38 (d, 1H), 7,30~7,19 (m, 2H), 5,75 (a, 1H), 3,66 (c, 2H), 1,28 (s, 9H), 1,19 (t, 3H)
1-19	7,52 (d, 1H), 7,44 (d, 1H), 5,73 (a, 1H), 3,67 (c, 2H), 1,34 (s, 9H), 1,19 (t, 3H)
1-22	7,36~7,30 (m, 2H), 7,12 (t, 1H), 5,76 (a, 1H), 3,67 (c, 2H), 1,35 (s, 9H), 1,19 (t, 3H)



ES 2 708 678 T3

N.º	<sup>1</sup> H RMN (CDCl <sub>3</sub> , δ ppm)
1-35	7,39~7,19 (m, 5H), 6,96 (t, 1H), 6,79 (t, 1H), 6,67 (t, 1H), 5,95 (a, 1H), 3,80 (s, 3H), 3,59 (c, 2H), 1,67 (s, 6H), 1,13 (t, 3H)

[Tabla 19]

N.º	<sup>1</sup> H RMN (CDCl <sub>3</sub> , δ ppm)
1-46	7,39~7,09 (m, 9H), 7,07 (t, 1H), 6,06 (a, 1H), 3,62 (c, 2H), 1,67 (s, 6H), 1,14 (t, 3H)
1-50	7,33 (s, 1H), 7,24~7,21 (m, 2H), 7,12 (t, 1H), 6,53 (s, 1H), 3,77 (s, 3H), 3,65 (c, 2H), 1,50 (s, 6H), 1,17 (t, 3H)
1-52	7,24~7,01 (m, 8H), 5,32 (s, 1H), 3,64 (c, 2H), 2,98 (s, 2H), 1,35 (s, 9H), 1, 15 (t, 3H)
1-55	8,71 (s, 1H), 7,57 (t, 1H), 7,34 (t, 1H), 7,23 (t, 1H), 7,18 (t, 1H), 7,15 (d, 1H), 6,99 (d, 1H), 3,71 (c, 2H), 2,40 (s, 3H), 1,73 (s, 6H), 1,20 (t, 3H)
1-56	8,44 (ddd, 1H), 8,16 (a, 1H), 7,70 (dt, 1H), 7,55 (s, 2H), 7,37 (dd, 1H), 7,17 (ddd, 1H), 3,68 (c, 2H), 1,74 (s, 6H), 1,19 (t, 3H)
1-64	8,46 (d, 1H), 8,05 (a, 1H), 7,69 (dt, 1H), 7,43 (s, 2H), 7,37 (d, 1H), 7,17 (dd, 1H), 3,85 (s, 3H), 3,67 (c, 2H), 1,74 (s, 6H), 1,18 (t, 3H)
1-66	8,44 (ddd, 1H), 8,16 (a, 1H), 7,70 (dt, 1H), 7,51 (s, 2H), 7,38 (d, 1H), 7,18 (ddd, 1H), 6,56 (t, 1H), 3,68 (c, 2H), 1,74 (s, 6H), 1,19 (t, 3H)
1-75	7,50~7,45 (m, 3H) 7,36~7,29 (m, 3H) 7,24~7,18 (m, 2H), 3,28 (c, 2H), 3,12 (c, 2H), 1,55 (s, 6H), 0,95 (t, 3H), 0,89 (t, 3H)
1-77	7,42~7,25 (m, 5H), 7,21 (t, 1H), 7,14 (t, 1H), 7,10 (t, 1H), 3,51 (t, 2H), 3,25 (t, 2H), 1,83 (s, 6H)
1-93	8,50 (d, 1H), 7,65 (dt, 1H), 7,28~7,15 (m, 5H), 6,74 (t, 1H), 4,55 (d, 2H), 3,70 (c, 2H), 1,18 (t, 3H)
1-95	8,55 (ddd, 1H), 7,64 (dt, 1H), 7,49~7,31 (m, 4H), 7,11 (ddd, 1H), 3,25 (c, 2H), 2,91 (s, 3H), 1,56 (s, 6H), 0,91 (t, 3H)
1-96	8,43 (ddd, 1H), 8,05 (a, 1H), 7,69 (dt, 1H), 7,39~7,32 (m, 2H), 7,22~7,14 (m, 3H), 3,59 (t, 2H), 1,73 (s, 6H), 1,72~1,57 (m, 2H), 0,92 (t, 3H)

[Tabla 20]

N.º	<sup>1</sup> H RMN (CDCl <sub>3</sub> , δ ppm)
1-98	8,45~8,41 (m, 2H), 7,70 (ddd, 1H), 7,40~7,15 (m, 5H), 4,38 (s, 2H), 2,24 (t, 1H), 1,75 (s, 6H)
1-99	8,44 (ddd, 1H), 8,13 (a, 1H), 7,70 (dt, 1H), 7,44 (d, 2H), 7,38 (d, 1H), 7,17 (ddd, 1H), 3,68 (c, 2H), 1,74 (s, 6H), 1,19 (t, 3H)
1-101	8,45 (ddd, 1H), 8,02 (a, 1H), 7,69 (dt, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,23 (s, 2H), 7,16 (ddd, 1H), 3,67 (c, 2H), 2,39 (s, 3H), 1,74 (s, 6H), 1,18 (t, 3H)
1-112	7,90 (d, 1H), 7,14 (dd, 1H), 7,02 (d, 1H), 5,42 (s, 1H), 3,63 (c, 1H), 3,37~3,33 (m, 2H), 3,01 (dd, 2H), 2,55~2,47 (m, 2H), 1,33 (s, 9H), 1,13 (t, 3H)
1-116	7,24~7,22 (m, 2H), 7,12 (t, 1H), 6,42 (a, 1H), 5,98 (a, 1H), 4,08~3,96 (m, 1H), 3,63 (c, 2H), 1,56 (s, 6H), 1,18~1,13 (m, 9H)
1-119	7,23~7,22 (m, 2H), 7,11 (t, 1H), 6,40 (a, 1H), 6,26 (a, 1H), 3,64 (c, 2H), 3,26 (c, 2H), 1,57 (s, 6H), 1,55~1,24 (m, 4H), 1,15 (t, 3H), 0,93 (t, 3H)
1-121	7,27~7,23 (m, 2H), 7,12 (t, 1H) 6,41 (a, 1H), 6,29 (a, 1H), 3,64 (c, 2H), 3,13 (c, 2H), 1,58 (s, 6H), 1,16 (t, 3H), 1,03~0,86 (m, 1H), 0,55~0,48 (m, 2H), 0,18~0,23 (m, 2H)
1-122	7,36~7,09 (m, 8H), 6,59 (a, 1H), 6,29 (a, 1H), 4,46 (d, 2H), 3,62 (c, 2H), 1,56 (s, 6H), 1,11 (t, 3H)
1-124	7,24~7,21 (m, 2H), 7,11 (t, 1H), 6,64 (a, 1H), 6,17 (a, 1H), 4,07~4,04 (m, 2H), 3,64 (c, 2H), 2,25~2,23 (m, 1H), 1,57 (s, 6H), 1,16 (t, 3H)

## ES 2 708 678 T3

N.º	<sup>1</sup> H RMN (CDCl <sub>3</sub> , δ ppm)
1-125	7,40 (s, 1H), 7,36~7,21 (m, 7H), 7,12 (t, 1H), 6,56 (a, 1H), 4,97 (s, 2H), 3,64 (c, 2H), 1,51 (s, 6H), 1,15 (t, 3H)
1-132	7,24 (s, 2H), 6,20 (a, 1H), 4,19 (c, 2H), 3,62 (c, 2H), 1,55 (s, 6H), 1,27 (t, 3H) 1,14 (t, 3H)
1-134	7,22~7,21 (m, 2H), 7,10 (t, 1H), 6,42 (a, 1H), 5,95 (a, 1H), 3,88~3,84 (m, 1H), 3,62 (c, 2H), 1,55 (s, 6H), 1,50~1,42 (m, 2H), 1,13 ~ 1,10 (m, 6H), 0,89 (t, 3H)
1-135	7,21 (s, 2H), 7,08 (a, 1H), 5,95 (a, 1H), 3,97~3,90 (m, 1H), 3,64 (c, 2H), 1,55 (s, 6H), 1,14 (t, 3H)

[Tabla 21]

N.º	<sup>1</sup> H RMN (CDCl <sub>3</sub> , δ ppm)
1-136	7,22 (s, 2H), 6,52 (a, 1H), 5,86 (a, 1H), 4,05~4,00 (m, 1H), 3,62 (c, 2H), 1,55 (s, 6H), 1,15~1,12 (m, 9H)
1-137	7,21~7,20 (m, 2H), 7,10 (t, 1H), 6,43 (a, 1H), 6,02 (a, 1H), 3,72 ~ 3,70(m, 1H), 3,62 (c, 2H), 1,89~1,85 (m, 2H), 1,70~1,60(m, 2H), 1,59~1,50 (m, 2H), 1,54 (s, 6H), 1,36~1,30 (m, 2H), 1,22~1,06(
1-152	7,37 (d, 1H), 7,28 (d, 1H), 7,01~6,99 (m, 1H), 6,41 (a, 1H), 5,95 (a, 1H), 4,12~4,01 (m, 1H), 3,62 (c, 2H), 1,53 (s, 6H), 1,16~1,12 (m, 9H)
1-162	8,44 (dd, 1H), 8,14 (a, 1H), 7,70 (dt, 1H), 7,47 (s, 2H), 7,38 (d, 1H), 7,17(ddd, 1H), 4,36 (c, 2H), 3,67 (c, 2H), 1,74 (s, 6H), 1,19 (t, 3H)
1-164	8,48 (dd, 1H), 8,12 (a, 1H), 7,71 (dt, 1H), 7,48~7,37 (m, 5H), 7,26 ~7,33(m, 3H), 7,18 (ddd, 1H), 3,72 (c, 2H), 1,77 (s, 6H), 1,23 (t, 3H)
1-165	8,55 (dd, 1H), 7,64 (dt, 1H), 7,50~7,38(m,4H), 7,12 (ddd, 1H), 4,26 (s, 2H), 3,33 (s, 3H), 3,24 (c, 2H), 1,58 (s, 6H), 0,87 (t, 3H)
1-166	8,56 (dd, 1H), 7,65 (dt,1H), 7,55~7,44 (m, 4H), 7,13 (dd, 1H) 3,68 (s, 3H), 3,31 (c, 2H), 1,57 (s, 6H), 0,91 (t, 3H)
1-170	8,55 (dd, 1H), 7,66 (dt, 1H) 7,54~7,43 (m, 4H), 7,13 (dd, 1H), 3,31 (c, 2H), 2,21 (s, 3H), 1,57 (s, 6H), 0,92 (t, 3H)
1-172	8,36 (d, 1H), 8,17 (s, 1H), 7,93 (dd, 2H), 7,69 (ddd, 1H), 7,42~7,35 (m, 3H), 7,14 (dd, 1H), 3,72 (c, 2H), 3,28 (s, 3H), 1,74 (s, 6H), 1,20 (t, 3H)
1-173	8,40 (dd,1H), 8,12 (a, 1H), 7,72~7,66 (m,2H), 7,38~7,29 (m, 2H), 7,20~7,13 (m, 2H), 3,70 (c, 2H), 2,65 (s, 3H), 1,74 (s, 6H), 1,20 (t, 3H)
1-175	8,39 (d, 1H), 8,13 (a, 1H), 7,89 (d, 1H), 7,68 (dt, 1H), 7,38~7,35 (m, 2H), 7,19~7,12 (m, 2H), 3,90 (s, 3H), 3,70 (c, 2H), 1,73 (s, 6H), 1,19 (t, 3H)
1-180	8,27 (d, 1H), 8,07 (a, 1H), 7,33 (dd, 1H), 7,22~7,18 (m, 2H), 6,84 (d, 1H), 6,69 (dd, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,67 (c, 2H), 1,72 (s, 6H), 1,21 (t, 3H)

[Tabla 22]

N.º	<sup>1</sup> H RMN (CDCl <sub>3</sub> , δ ppm)
1-181	8,38 (dd, 1H), 8,29 (a, 1H), 8,01 (d, 1H), 7,70 (dt, 1H), 7,46 (d, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,28~7,15 (m, 2H), 3,72 (c, 2H), 1,74 (s, 6H), 1,21 (t, 3H)
1-184	8,37 (dd, 1H), 8,16 (a, 1H), 8,09 (d, 1H), 7,69 (dt, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,20~7,13 (m, 3H), 3,69 (c, 2H), 2,65 (s, 3H), 1,74 (s, 6H), 1,20 (t, 3H)
1-186	8,43 (dd, 1H), 8,17 (a, 1H), 7,70 (dt, 1H), 7,51 (d, 1H), 7,39~7,36 (m, 2H), 7,17 (dd, 1H), 3,68 (c, 2H), 1,74 (s, 6H), 1,19 (t, 3H)
1-194	8,42 (ddd, 1H), 8,26(a, 1H), 7,73(d, 1H), 7,68(dt, 1H), 7,42~7,35 (m, 2H), 7,15 (ddd, 1H), 3,70 (c, 2H), 1,74 (s, 6H), 1,21 (t, 3H)
1-200	8,44 (d, 1H), 8,23 (s, 1H), 7,68 (ddd, 1H), 7,61 (d, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,25 (d, 1H), 7,15 (ddd, 1H), 7,12 (dd, 1H), 3,72 (c, 2H), 1,75 (s, 6H), 1,23 (t, 3H)

ES 2 708 678 T3

N.º	<sup>1</sup> H RMN (CDCl <sub>3</sub> , δ ppm)
1-207	7,78 (s, 1H), 7,66 (dd, 1H), 7,36 (d, 2H), 7,28 (d, 1H), 7,20 (d, 1H), 3,69 (c, 2H), 1,72 (s, 6H), 1,20 (t, 3H)
1-214	8,64 (s, 1H), 7,27 (dd, 1H), 7,24 (dd, 1H), 7,17 (dd, 1H), 6,15(s, 1H), 3,61 (c, 2H), 1,76 (s, 6H), 1,15 (t, 3H)
1-216	9,12 (s, 1H), 8,71 (d, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,34~7,32 (m, 1H), 7,26~7,21 (m, 2H), 7,13 (a, 1H), 3,64 (c, 2H), 1,71 (s, 6H), 1, 17 (t, 3H)
1-220	8,16 (dd, 1H), 7,25~7,24 (m, 2H), 7,13 (t, 1H), 6,13 (t, 1H), 5,93 (a, 1H), 3,59 (c, 2H), 1,72 (s, 6H), 1,12 (t, 3H)
1-228	9,10 (dd, 1H), 7,57 (dd, 1H), 7,49~7,46 (m, 1H), 7,30 (t, 1H), 7,27 ~ 7,18(m, 3H), 3,62 (c, 2H), 1,81 (s, 6H), 1,15 (t, 3H)
1-229	8,94 (a, 1H), 8,15 (d, 1H), 7,80~7,70 (m, 3H), 7,51~7,44 (m, 3H), 7,34 (t, 1H), 7,20 (t, 1H), 3,74(c, 2H), 1,82 (s, 6H), 1,23 (t, 3H)
1-230	8,43~8,42 (m, 1H), 7,98 (s, 1H), 7,68 (ddd, 1H), 7,37 (dd, 1H), 7,32 (d, 1H), 7,29 (d, 1H), 7,16~7,12 (m, 2H), 3,97 (s, 3H), 3,68 (c, 2H), 2,20 (s, 3H), 1,73 (s, 6H), 1, 18 (t, 3H)
1-233	8,68 (d, 2H), 7,71 (s, 1H), 7,41 (d, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,16 (dd, 1H), 7,10 (dd, 1H), 3,68 (c, 2H), 1,79 (s, 6H), 1,19 (t, 3H)

[Tabla 23]

N.º	<sup>1</sup> H RMN (CDCl <sub>3</sub> , δ ppm)
1-236	8,54 (d, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,34(dd,2H), 7,23 (dd, 1H), 7,20(dd, 1H), 3,70 (c, 2H), 2,45 (s, 3H), 1,78 (s, 6H), 1,20 (t, 3H)
1-237	8,54 (d, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,35 (s, 2H), 7,01 (d, 1H), 3,70 (c, 2H), 2,45 (s, 3H), 1,77 (s, 6H), 1,20 (t, 3H)
2-11	8,83 (d, 1H), 8,24 (d, 1H), 8,07 (d, 1H), 7,54 (d, 1H), 7,36-7,19(m, 2H), 6,05 (s, 1H), 3,69 (c, 2H), 1,68 (s, 6H), 1,18 (t, 3H)
2-15	8,89 (d, 1H), 7,46 (d, 1H), 5,56 (s, 1H), 3,82 (c, 2H), 1,35 (s, 9H), 1,20 (t, 3H)
2-16	9,02 (s, 1H), 7,57 (s, 1H), 5,53 (s, 1H), 3,73 (s a, 2H), 1,35 (s, 9H), 1,19 (t, 3H)
2-23	8,48 (d, 1H), 7,49 (s, 1H), 7,38-7,19(m, 6H), 6,15 (a, 1H), 3,70 (c, 2H), 1,67 (s, 6H), 1,18 (t, 3H)
2-33	8,92 (d, 1H), 8,38 (d, 1H), 8,34 (a, 1H), 8,09(d, 1H), 7,94 (d, 1H), 7,77 (d, 1H), 7,69-7,51(m, 3H), 7,36 (d, 1H), 7,12 (dd, 1H), 3,79 (c, 2H), 1,75 (s, 6H), 1,26 (t, 3H)
2-34	8,82 (d, 1H), 8,18-8,12(m, 2H), 7,77(dt, 1H), 7,58(dt, 1H), 7,28 (d, 1H), 5,50 (a, 1H), 3,75 (c, 2H), 1,33 (s, 9H), 1,22 (t, 3H)
2-35	8,79 (d, 1H), 8,65 (a, 1H), 8,42 (dd, 1H), 8,11 (d, 1H), 7,94 (dd, 1H), 7,79 (dt, 1H), 7,66-7,60(m, 2H), 7,34-7,29(m, 2H), 7,03(ddd,1H), 3,85 (c, 2H), 1,74 (s, 6H), 1,26 (t, 3H)
2-36	8,91 (s, 1H), 8,34 (ddd, 1H), 8,19 (a, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,78-7,63(m, 3H), 7,36 (dd, 1H), 7,12 (dd, 1H), 3,89 (c, 2H), 1,75 (s, 6H), 1,26 (t, 3H)
2-37	8,81 (dd, 1H), 8,36 (dd, 1H), 8,11-8,07(m, 3H), 7,68-7,59(m, 3H), 7,40-7,35(m, 2H), 7,11 (dd, 1H), 3,77 (c, 2H), 1,75 (s, 6H), 1,24 (t, 3H)
2-38	8,34 (dd, 1H), 8,19 (d, 1H), 7,96 (d, 1H), 7,79 (a, 1H), 7,78 (d, 1H), 7,69 (t, 1H), 7,61 (t, 1H), 7,51-7,41(m, 2H), 7,34 (d, 1H), 7,06 (dd,1H), 3,80 (c, 2H), 1,71 (s, 6H), 1,23 (t, 3H)

[Tabla 24]

N.º	<sup>1</sup> H RMN (CDCl <sub>3</sub> , δ ppm)
2-42	9,15 (s, 1H), 8,46 (d, 1H), 8,33 (d, 1H), 8,13 (a, 1H), 7,95 (d, 1H), 7,64 (dt, 1H), 7,60 (d, 1H), 7,56 (d, 1H), 7,48(dd, 1H), 7,35(d, 1H), 7,10 (dd, 1H), 3,76 (c, 2H), 1,73 (s, 6H), 1,23 (t, 3H)
2-43	8,37 (d, 1H), 8,05 (s, 1H), 8,00 (dd, 1H), 7,97 (d, 1H), 7,65(ddd, 1H), 7,57~7,55 (m, 2H), 7,36 (d, 1H), 7,27 (d, 1H), 7,11 (ddd, 1H), 3,76 (c, 2H), 2,72 (s, 3H), 1,74 (s, 6H), 1,24 (t, 3H)

ES 2 708 678 T3

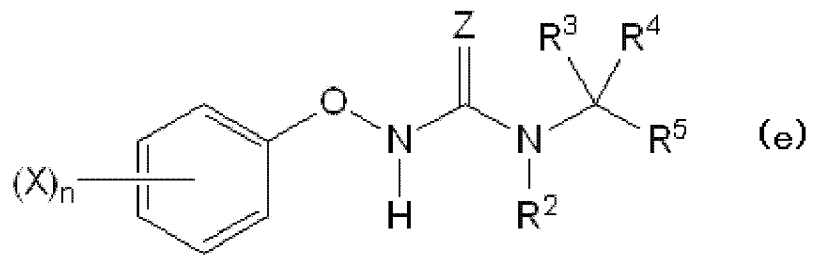
2-44	866 (d, 1H), 8,38~8,36 (m, 1H), 8,07~8,03 (m, 2H), 7,83 (s, 1H), 7,65 (ddd, 1H), 7,54~7,51 (m, 2H), 7,36 (dd, 1H), 7,11 (ddd, 1H), 3,76 (c, 2H), 2,50 (s, 3H), 1,74 (s, 6H), 1,24 (t, 3H)
2-47	8,42 (dd, 1H), 8,14 (a, 1H), 8,03(d, 1H),7,68(dt, 1H), 7,36 (d, 1H), 7,29 (d, 1H), 7,15 (ddd, 1H), 3,74 (a, 2H), 1,73 (s, 6H), 1,26 (t, 3H)
2-48	8,43~8,38 (m, 2H), 8,27 (a, 1H), 7,96 (d, 1H), 7,68 (dt, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,16~7,13 (m, 1H), 3,87 (c, 2H), 1,74 (s, 6H), 1,22 (t, 3H)
2-49	8,42 (d, 1H), 8,02 (a, 1H), 7,73 (s, 1H), 7,66~7,63 (m, 2H), 7,34 (d, 1H), 7,13 (dd, 1H), 3,94 (s, 3H), 3,69 (a, 2H), 1,71 (s, 6H), 1,21 (t, 3H)
2-53	8,42~840 (m, 1H), 8,16(a, 1H), 7,68(dt, 1H), 7,44 (s, 1H), 7,35 (d, 1H), 7,30 (s, 1H), 7,15 (dd, 1H), 3,73 (a, 2H), 1,72 (s, 6H), 1,21 (t, 3H)
2-54	8,42 (d, 1H), 7,88 (a, 1H), 7,69~7,64 (m, 2H), 7,34 (d, 1H), 7,17~7,06 (m, 3H), 3,71 (c, 2H), 1,70 (s, 6H), 1,0 (t, 3H)
2-57	8,39 (dd, 1H), 8,14 (a, 1H), 7,68 (dt, 1H), 7,36 (d, 1H), 7,21(s, 1H), 7,17~7,15 (m, 1H), 6,98 (s, 1H), 3,70 (a, 2H), 2,51 (s, 3H), 1,72(s, 6H), 1,17 (t, 3H)
2-67	8,40~8,39 (m, 1H), 8,29 (s, 1H), 7,71 (ddd, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,20 ~ 7,17(m, 3H), 3,61 (a, 2H), 1,73 (s, 6H), 1,70~1,62 (m, 2H), 0,94 (t, 3H)
2-70	8,38~8,37 (m, 1H), 8,28 (s, 1H), 7,71 (ddd, 1H), 7,41 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,26 (d, 1H), 7,18 (ddd, 1H), 3,72 (a, 2H), 2,59 (s, 3H), 1,74 (s, 6H), 1,20 (t, 3H)
2-71	8,39~8,38 (m, 1H), 8,06 (a, 1H), 7,66 (dt, 1H), 7,34 d, 1H), 7,15 ~ 7,12(m, 2H), 3,90~ 3,50(a, 2H), 2,68 (s, 3H), 1,71 (s, 6H), 1,20 (t, 3H)

[Tabla 25]

N.º	<sup>1</sup> H RMN (CDCl <sub>3</sub> , δ ppm)
2-72	8,43 (d, 1H), 8,27 (s, 1H), 7,70 (ddd, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,28 (s, 1H), 7,18 (dd, 1H), 3,75 (a, 2H), 1,74 (s, 6H), 1,23 (t, 3H)
2-74	8,41 (s, 1H), 8,37~8,35 (m, 1H), 7,72 (ddd, 1H), 7,60 (d, 1H), 7,52 (d, 1H), 7,39~7,36 (m, 1H), 7,18 (ddd, 1H), 3,74 (a, 2H), 1,74 (s, 6H), 1,22 (t, 3H)
2-75	8,39 (d, 1H), 8,23 (s, 1H), 7,71 (s, 1H), 7,68 (dd, 1H), 7,58 (s, 1H), 7,35 (d, 1H), 7,14 (dd, 1H), 3,76 (a, 2H), 1,73 (s, 6H), 1,24(t, 3H)
2-78	8,65 (d, 2H), 8,36 (d, 1H), 7,84 (a, 1H), 7,57 (dd, 1H), 7,28 (d, 1H), 7,15 (t, 1H), 3,69 (c, 2H), 1,77 (s, 6H), 1,25 (t, 3H)
3-2	7,15 (d, 2H), 7,03 (t, 1H), 3,75 (c, 2H), 3,65~3,55 (m,2H), 3,30~3,21 (m,2H), 2,39~2,18 (m, 4H), 1,22 (t, 3H)
3-3	7,87 (d, 2H), 7,70~7,55 (m, 3H), 7,19~7,16 (m, 2H), 7,07 (t, 1H), 3,76 (c, 2H), 3,34 (s, 3H), 1,23 (t, 3H)
3-4	8,74 (d, 1H), 8,19 (d, 1H), 7,97 (dt, 1H), 7,56 (dd, 1H), 7,13(d, 2H), 7,02 (t, 1H), 3,72 (c, 2H), 3,41 (s, 3H), 1,19 (t, 3H)

Los compuestos intermedios para su uso en la preparación de los compuestos de la invención y los compuestos de referencia se muestran en las tablas 26 a 40. Las Tablas 26 a 34 muestran los sustituyentes para el intermedio (e). Las Tablas 35 a 37 muestran los sustituyentes para el intermedio (f). La Tabla 38 muestra los sustituyentes para el intermedio (g). La Tabla 30 muestra los sustituyentes para el intermedio (h).

[Fórmula química 24]



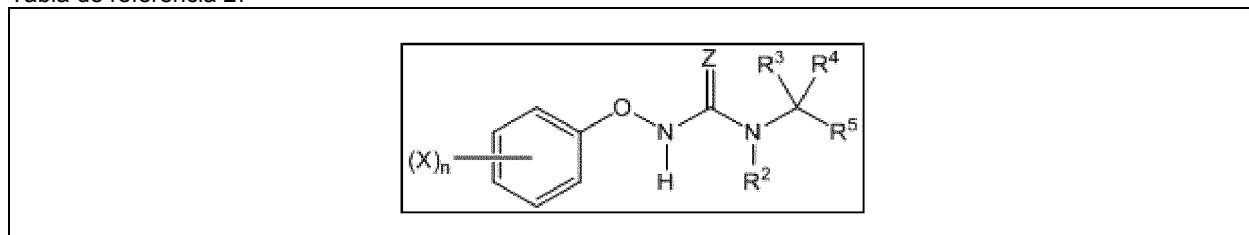
[Tabla 26]

Tabla 26

N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
5-1	H	Me	Me	Me	3-Br-6-Cl	O	
5-2	H	Me	Me	Me	3-CF <sub>3</sub>	O	
5-3	H	Me	Me	Me	3-Br-5-Cl	O	
5-4	H	Me	Me	Me	2-Cl-5-(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	O	
5-5	H	Me	Me	Me	3,5-Cl <sub>2</sub>	O	
5-6	H	Me	Me	Me	3-OH-4-NO <sub>2</sub>	O	
5-7	H	Me	Me	Me	4-Ac	O	
5-8	H	Me	Me	Me	3-Cl-5-CN	O	
5-9	H	Me	Me	Me	3-Cl-5-OMe	O	
5-10	H	Me	Me	Me	3-Br-4,5-Cl <sub>2</sub>	O	
5-11	H	Me	Me	Me	3-Cl-5-(4-Cl-Ph)	O	
5-12	H	Me	Me	Me	3-Cl-5-(4-OMe-Ph)	O	
5-13	H	Me	Me	Me	4-NO <sub>2</sub>	O	
5-14	H	Me	Me	Me	3-Br-5-OMe	O	
5-15	H	Me	Me	Me	3-Br-5-Me	O	
5-16	H	Me	Me	Me	2,4-Cl <sub>2</sub>	O	
5-17	H	Me	Me	Me	2,5-Me <sub>2</sub> -4-NO <sub>2</sub>	O	
5-18	H	Me	Me	Me	3-Br-5-CO <sub>2</sub> Me	O	
5-19	H	Me	Me	Me	2,3,5-Br <sub>3</sub>	O	
5-20	H	Me	Me	Me	3,5-Br <sub>2</sub> -4-Cl	O	
5-21	H	Me	Me	Me	3,4,5-Br <sub>3</sub>	O	
5-22	H	Me	Me	Me	3,5-Br <sub>2</sub> -4-OMe	O	
5-23	H	Me	Me	Me	3,5-Br <sub>2</sub> -4-OMe	O	
5-24	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	130-131
5-25	H	Me	Me	Ph	3,4-Cl <sub>2</sub>	O	

[Tabla 27]

Tabla de referencia 27



N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
5-26	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-CF <sub>3</sub>	O	
5-27	H	Me	Me	Ph	3,5-Br <sub>2</sub>	O	
5-28	H	Me	Me	Ph	3-Br-4,5-Cl <sub>2</sub>	O	
5-29	H	Me	Me	Ph	3,5-Cl <sub>2</sub>	O	
5-30	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-F	O	
5-31	H	Me	Me	Ph	3,5-F <sub>2</sub>	O	
5-32	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-CN	O	
5-33	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-NO <sub>2</sub>	O	
5-34	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-SO <sub>2</sub> Me	O	
5-35	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-OMe	O	
5-36	H	Me	Me	Ph	4-CF <sub>3</sub>	O	
5-37	H	Me	Me	Ph	2,5-Me <sub>2</sub> -4-NO <sub>2</sub>	O	
5-38	H	Me	Me	Ph	2,3,5-Br <sub>3</sub>	O	
5-39	H	Me	Me	Ph	3,4-Br <sub>2</sub>	O	
5-40	H	Me	Me	Ph	3-Br-4-Cl	O	
5-41	H	Me	Me	Ph	3,5-Br <sub>2</sub> -4-Cl	O	
5-42	H	Me	Me	Ph	3,4,5-Br <sub>3</sub>	O	
5-43	H	Me	Me	Ph	3-Br-2-Cl	O	
5-44	H	Me	Me	Ph	5-Br-2-Cl	O	
5-45	H	Me	Me	Ph	3-Br-5-CO <sub>2</sub> Me	O	
5-46	H	Me	Me	Ph	-	O	
5-47	H	Me	Me	Ph	3-Cl	O	140-142
5-48	H	Me	Me	Ph	2-Cl	O	125-127
5-49	H	Me	Me	Ph	2,6-Cl <sub>2</sub>	O	185-187
5-50	H	Me	Me	=N-O	3-Br-5-Cl	O	99-101

[Tabla 28]

Tabla de referencia 28

N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
5-51	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	163-165
5-52	H	Me	Me	Bn	3-Br-5-Cl	O	

5-53	H	Me	Me	3-Me-Ph	3-Br-5-Cl	O	153-154
5-54	H	Me	Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Br-5-Cl	O	138-139
5-55	H	Me	Me	6-Me-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	152-153
5-56	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Br <sub>2</sub> -4-Cl	O	
5-57	H	Me	Me	CO <sub>2</sub> Et	3-Br-5-Cl	O	111-113
5-58	H	Me	Me	CO <sub>2</sub> H	3-Br-5-Cl	O	
5-59	H	Me	Me	CN	3-Br-5-Cl	O	186-188
5-60	H	Me	Me	3-Me-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	162-164
5-61	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Cl <sub>2</sub>	O	
5-62	H	Me	Me	5-Me-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	147-149
5-63	H	Me	Me	4-Me-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	174-176
5-64	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Br <sub>2</sub> -4-OMe	O	
5-65	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Br <sub>2</sub>	O	
5-66	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Br <sub>2</sub> -4-OCHF <sub>2</sub>	O	
5-67	H	Me	Me	CONHEt	3-Br-5-Cl	O	
5-68	H	Me	Me	Pi-2-ilo	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	
5-69	H	Me	Me	Pi-4-ilo	3-Br-5-Cl	O	199-202
5-70	H	Me	Me	2-Me-Ph	3-Br-5-Cl	O	177-179
5-71	H	Me	Me	CONEt <sub>2</sub>	3-Br-5-Cl	O	
5-72	H	Me	Me	4-Me-Ph	3-Br-5-Cl	O	139-141
5-73	H	Me	Me	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Br-5-Cl	O	173-175
5-74	H	H	H	Ph	3-Br-5-Cl	O	176-177
5-75	H	Me	H	Ph	3-Br-5-Cl	O	131-132

[Tabla 29]

Tabla de referencia 29

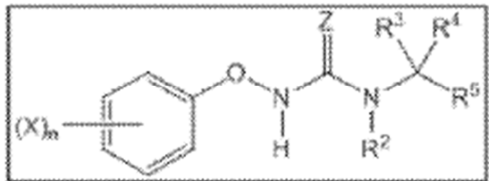
N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
5-76	H	H	H	Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	152-153
5-77	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Br <sub>2</sub> -4-F	O	
5-78	H	Me	Me	4-CF <sub>3</sub> -PH	3-Br-5-Cl	O	182-184
5-79	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Cl <sub>2</sub> -4-Me	O	
5-80	H	Me	Me	2-MeO-Ph	3-Br-5-Cl	O	162-164



5-81	H	Me	Me	Pi-3-ilo	3-Br-5-Cl	O	
5-82	H	Me	Me	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-Br-5-Cl	O	
5-83	H	Me	Me	CH <sub>2</sub> OEt	3-Br-5-Cl	O	88-90
5-84	H	Me	Me	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Et	3-Br-5-Cl	O	89-91
5-85	H	Me	Me	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H	3-Br-5-Cl	O	
5-86	H	Me	Me	C≡CH	3-Br-5-Cl	O	144-146
5-87	H	Me	Me	CH <sub>2</sub> CONH <sub>2</sub>	3-Br-5-Cl	O	
5-88	H	Me	Me	CON(Me) <sub>2</sub>	3-Br-5-Cl	O	
5-89	H	Me	Me	CONHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	3-Br-5-Cl	O	
5-90	H	Me	Me	Me	3-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> -4	O	
5-91	H	Me	Me	Me	4-MeSO <sub>2</sub>	O	
5-92	H	Me	Me	CONHMe	3-Br-5-Cl	O	
5-93	H	Me	Me	CH <sub>2</sub> O(Pi-2-ilo)	3-Br-5-Cl	O	124-126
5-94	H	Me	Me	CONH <sup>i</sup> Pr	3-Br-5-Cl	O	
5-95	H	Me	Me	CO(Piperidin-1-ilo)	3-Br-5-Cl	O	
5-96	H	Me	Me	CONHPh	3-Br-5-Cl	O	
5-97	H	Me	Me	CONH <sup>n</sup> Bu	3-Br-5-Cl	O	
5-98	H	Me	Me	CONHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-Br-5-Cl	O	
5-99	H	Me	Me	CONHCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr	3-Br-5-Cl	O	
5-100	H	Me	Me	CONHBn	3-Br-5-Cl	O	

[Tabla 30]

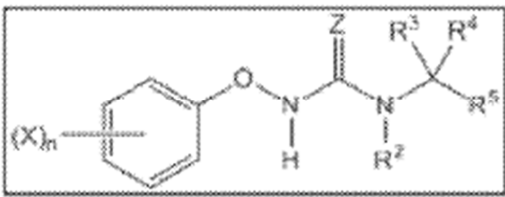
Tabla de referencia 30

							
N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
5-101	H	Me	Me	CH <sub>2</sub> NHCO <sub>2</sub> Et	3-Br-5-Cl	O	121-124
5-102	H	Me	Me	CONHCH <sub>2</sub> C≡CH	3-Br-5-Cl	O	
5-103	H	Me	Me	CH=N-OBn	3-Br-5-Cl	O	106-108
5-104	H	Bn	H	CO <sub>2</sub> Me	3-Br-5-Cl	O	119-121
5-105	H	Me	Me	CH <sub>2</sub> NHAc	3-Br-5-Cl	O	181-183
5-106	H	Me	Me	CH <sub>2</sub> NHCOPh	3-Br-5-Cl	O	114-117
5-107	H	Me	Me	CONH <sup>o</sup> Pr	3-Br-5-Cl	O	

5-108	H	Me	Me	CONH <sup>o</sup> Pen	3-Br-5-Cl	O	
5-109	H	Me	H	CO <sub>2</sub> Me	3-Br-5-Cl	O	140-142
5-110	H	Me	Me	CO <sub>2</sub> Et	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	142-144
5-111	H	Me	Me	CO <sub>2</sub> H	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	
5-112	H	Me	Me	CONH <sup>s</sup> Bu	3-Br-5-Cl	O	
5-113	H	Me	Me	CONHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	
5-114	H	Me	Me	CONH <sup>i</sup> Pr	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	
5-115	H	Me	Me	CONH <sup>o</sup> Hex	3-Br-5-Cl	O	
5-116	H	Me	Me	CONH <sup>t</sup> Bu	3-Br-5-Cl	O	
5-117	H	Me	H	CO <sub>2</sub> H	3-Br-5-Cl	O	
5-118	H	Me	Me	C(Me)=NOMe	3-Br-5-Cl	O	146-147
5-119	H	Me	H	CONH <sup>i</sup> Pr	3-Br-5-Cl	O	
5-120	H	Me	H	CONHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-Br-5-Cl	O	
5-121	H	Me	Me	<sup>o</sup> Hex	3-Br-5-Cl	O	
5-122	H	Me	Me	Et	3-Br-5-Cl	O	87-88
5-123	H	Me	Me	C(Me)=N-OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr	3-Br-5-Cl	O	154-155
5-124	H	Me	Me	C(Me)=N-OBn	3-Br-5-Cl	O	107-108
5-125	H	Me	Me	<sup>n</sup> Hex	3-Br-5-Cl	O	

[Tabla 31]

Tabla de referencia 31

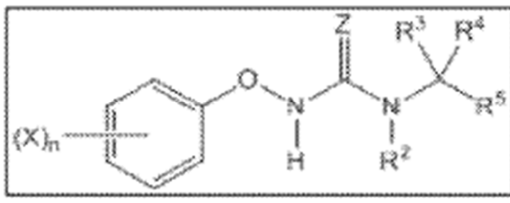
							
N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
5-126	H	Me	Me	<sup>t</sup> Bu	3-Br-5-Cl	O	
5-127	H	Me	Me	CONHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub>	O	amo
5-128	H	Me	Me	CO <sub>2</sub> Et	3,4-Cl <sub>2</sub>	O	
5-129	H	Me	Me	CO <sub>2</sub> Et	3,4-Cl <sub>2</sub>	O	
5-130	H	Me	Me	CONH <sup>i</sup> Pr	3,4-Cl <sub>2</sub>	O	
5-131	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		Ph	3-Br-5-Cl	O	196-198
5-132	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		Ph	3-Br-5-Cl	O	145-147
5-133	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		Ph	3-Br-5-Cl	O	184-186
5-134	H	<sup>i</sup> Pr	H	Ph	3-Br-5-Cl	O	122-124

ES 2 708 678 T3

5-135	H	Ph	H	Ph	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	184-186
5-136	H	Ph	Me	Ph	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	190-192
5-137	H	Et	Et	Ph	3-Br-5-Cl	O	167-169
5-138	H	Me	Me	2-F-Ph	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	109-111
5-139	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,4-Cl <sub>2</sub>	O	
5-140	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Br <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O	O	
5-141	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Br <sub>2</sub> -4- <sup>n</sup> HexO	O	
5-142	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Cl <sub>2</sub> -4-Ph	O	
5-143	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	214-215
5-144	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	172-174
5-145	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-4-CN	O	
5-146	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-4-CN	O	
5-147	H	Me	Me	Pi-2-ilo	4-MeSO <sub>2</sub>	O	
5-148	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-4-CHO	O	
5-149	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-4-CO <sub>2</sub> Me	O	
5-150	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-4-CO <sub>2</sub> H	O	

[Tabla 32]

Tabla de referencia 32

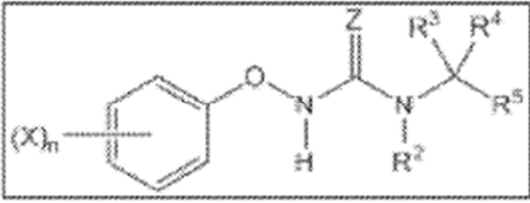
							
N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
5-151	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-4-CHF <sub>2</sub>	O	
5-152	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,4,5-Cl <sub>3</sub>	O	
5-153	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-4-Br	O	
5-154	H	Me	Me	4-MeO-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	150-152
5-155	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-4-NO <sub>2</sub>	O	
5-156	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	
5-157	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-5-F	O	
5-158	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Me-4-NO <sub>2</sub>	O	
5-159	H	Me	Me	4-CF <sub>3</sub> -Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	129-131
5-160	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-4,5-Cl <sub>2</sub>	O	
5-161	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-5-CN	O	

ES 2 708 678 T3

5-162	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,4-Br <sub>2</sub> -4-CN	O	
5-163	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-Cl <sub>2</sub> -4-CN	O	
5-164	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-5-CF <sub>3</sub>	O	
5-165	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-5-MeO	O	
5-166	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,4-Br <sub>2</sub>	O	
5-167	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,4-Br <sub>2</sub> -6-F	O	
5-168	H	Me	Me	Pi-2-ilo	-	O	124-126
5-169	H	Me	Me	Pi-2-ilo	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	O	59-61
5-170	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-4-Me	O	156-158
5-171	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl	O	123-125
5-172	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-F-4-Cl	O	132-134
5-173	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Br-6-Cl	O	
5-174	H	Me	Me	4-Ph-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	130-132
5-175	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Me-4-Cl	O	153-155

[Tabla 33]

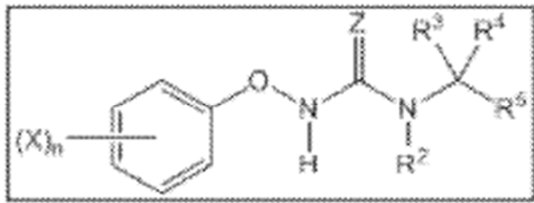
Tabla de referencia 33

							
N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
5-176	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	
5-177	H	Me	Me	6-F-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	108-110
5-178	H	Me	Me	6-Cl-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	
5-179	H	Me	Me	3-F-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	160-162
5-180	H	Me	Me	6-Cl-Pi-2-ilo	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	
5-181	H	Me	Me	5-F-Pi-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	132-134
5-182	H	Me	Me	Tiofen-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	
5-183	H	Me	Me	Furan-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	
5-184	H	Me	Me	Tiazol-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	152-154
5-185	H	Me	Me	Pirazin-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	
5-186	H	Me	Me	Pirimidin-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	196-197
5-187	H	Me	Me	[1,2,4]Oxadiazol-3-ilo	3-Br-5-Cl	O	
5-188	H	Me	Me	4-Me-tiazol-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	166-167

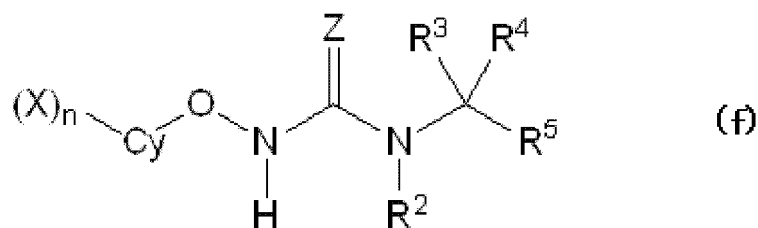
5-189	H	Me	Me	Pirimidin-4-ilo	3-Br-5-Cl	O	
5-190	H	Me	Me	1H-Pirazol-3-ilo	3-Br-5-Cl	O	160-161
5-191	H	Me	Me	1-Me-1H-pirazol-3-ilo	3-Br-5-Cl	O	
5-192	H	Me	Me	1-Me-1H-pirazol-5-ilo	3-Br-5-Cl	O	
5-193	H	Me	Me	Isoxazol-5-ilo	3-Br-5-Cl	O	
5-194	H	Me	Me	4-Et-tiazol-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	117-119
5-195	H	Me	Me	4,5-Me <sub>2</sub> -tiazol-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	136-138

[Tabla 34]

Tabla de referencia 34

							
N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
5-196	H	Me	Me	1- <sup>t</sup> Bu-1H-pirazol-3-ilo	3-Br-5-Cl	O	
5-197	H	Me	Me	1-CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -1H-pirazol-5-ilo	3-Br-5-Cl	O	
5-198	H	Me	Me	[1,2,4]Triazin-3-ilo	3-Br-5-Cl	O	196-197
5-199	H	Me	Me	1-Et-1H-[1,3,4]triazol-3-ilo	3-Br-5-Cl	O	
5-200	H	Me	Me	Piridazin-3-ilo	3-Br-5-Cl	O	amo
5-201	H	Me	Me	2-Me-2H-tetrazol-5-ilo	3-Br-5-Cl	O	130-131
5-202	H	Me	Me	Pirimidin-2-ilo	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	
5-203	H	Me	Me	4,5-Dihidro-oxazol-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	183-185
5-204	H	Me	Me	5-Me-Pirimidin-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	183-184
5-205	H	Me	Me	Pirimidin-2-ilo	3,4-Cl <sub>2</sub>	O	
5-206	H	Me	Me	4,5-Me <sub>2</sub> -tiazol-2-ilo	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	174-175
5-207	H	Me	Me	4,5-Me <sub>2</sub> -tiazol-2-ilo	3,4-Cl <sub>2</sub>	O	170-171
5-208	H	Me	Me	4-Me-Pirimidin-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	
5-209	H	Me	Me	4-Me-Pirimidin-2-ilo	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	
5-210	H	Me	Me	Pi-2-ilo	3-Cl-4-(Pi-2-ilo)	O	
5-211	H	Me	Me	Quinolin-2-ilo	3-Br-5-Cl	O	129-131

[Fórmula química 25]



[Tabla 35]

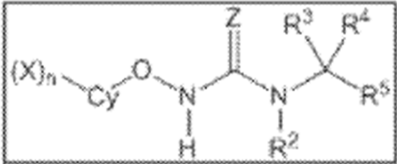
Tabla 35

N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Cy	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)	
6-1	H	Me	Me	Me	Quinolin-6-ilo	3-Br	O	180-179	
6-2	H	Me	Me	Me	Quinolin-6-ilo	-	O		
6-3	H	Me	Me	Me	Quinolin-7-ilo	6-OMe	O		
6-4	H	Me	Me	Me	Quinolin-6-ilo	3-Br-7-F	O		
6-5	H	Me	Me	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	Quinolin-6-ilo	3-Br	O		
6-6	H	Me	Me	C≡CMe	Quinolin-6-ilo	3-Br	O		
6-7	H	Me	Me	Me	Quinolin-2-ilo	-	O		
6-8	H	Me	Me	Ph	Quinolin-6-ilo	3-Br	O		
6-9	H	Me	Me	CH=N-Ome	Quinolin-6-ilo	3-Br	O		
6-10	H	Me	Me	Me	Quinolin-4-ilo	7-Cl	O		
6-11	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Quinolin-6-ilo	3-Br	O		
6-12	H	Me	Me	Bn	Quinolin-6-ilo	3-Br	O		
6-13	H	Me	Me	Me	Pirimidin-2-ilo	4-CF <sub>3</sub>	O		
6-14	H	Me	Me	Me	Pirimidin-4-ilo	6-CF <sub>3</sub>	O		
6-15	H	Me	Me	Me	Pirimidin-4-ilo	2-CF <sub>3</sub>	O		
6-16	H	Me	Me	Ph	Pirimidin-2-ilo	4,6-Me <sub>2</sub>	O		
6-17	H	Me	Me	Me	Pi-2-ilo	6-CF <sub>3</sub>	O		
6-18	H	Me	Me	Me	Pi-2-ilo	6-Cl-5-CN-4-Me	O		
6-19	H	Me	Me	Me	Pi-2-ilo	6-Cl-3-CN-4-Me	O		
6-20	H	Me	Me	Me	Pi-4-ilo	2,6-Cl <sub>2</sub>	O		
6-21	H	Me	Me	Ph	Pi-2-ilo	4-CF <sub>3</sub>	O		
6-22	H	Me	Me	Ph	Pi-2-ilo	6-Cl-4-CF <sub>3</sub>	O		

6-23	H	Me	Me	Ph	Pi-2-ilo	6-Br	O	
6-24	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	6-Cl-4-CF <sub>3</sub>	O	
6-25	H	Me	Me	Me	Piridazin-3-ilo	6-CF <sub>3</sub>	O	

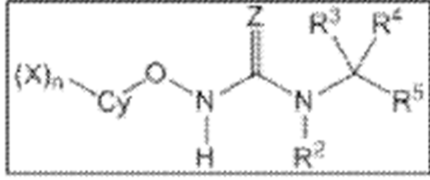
[Tabla 36]

Tabla 36

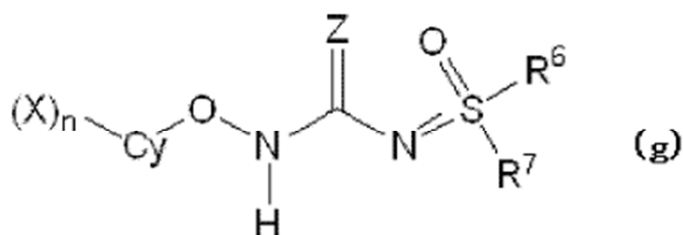
								
N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Cy	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
6-26	H	Me	Me	Ph	Piridazin-3-ilo	6-CF <sub>3</sub>	O	
6-27	H	Me	Me	Ph	Piridazin-3-ilo	6-Cl	O	
6-28	H	Me	Me	Ph	Naftalen-2-ilo	-	O	125-127
6-29	Ac	Me	Me	Me	Quinolin-6-ilo	3-Br	O	166-168
6-30	H	Me	Me	Me	Quinolin-6-ilo	-	O	
6-31	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Quinolin-3-ilo	-	O	
6-32	H	Me	Me	Me	Quinolin-3-ilo	-	O	
6-33	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Quinolin-4-ilo	-	O	
6-34	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Quinoxalin-2-ilo	-	O	
6-35	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Quinolin-6-ilo	-	O	149-151
6-36	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Quinolin-6-ilo	-	O	
6-37	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Quinolin-2-ilo	-	O	
6-38	H	Me	Me	Me	Isoquinolin-6-ilo	-	O	
6-39	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Isoquinolin-6-ilo	-	O	
6-40	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Quinolin-6-ilo	2-Me	O	
6-41	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Quinolin-6-ilo	3-Me	O	
6-42	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Isoquinolin-1-ilo	3-Cl	O	
6-43	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-3-ilo	5-Br	O	
6-44	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	5-CF <sub>3</sub> -6-Cl	O	
6-45	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	3-Cl-5-CF <sub>3</sub>	O	amo
6-46	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	4-CO <sub>2</sub> Me-6-Cl	O	
6-47	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-4-ilo	2,6-Cl <sub>2</sub>	O	
6-48	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	4-Me-6-Cl	O	
6-49	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	4-MeO-6-Cl	O	
6-50	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	4-CN-6-Cl	O	

[Tabla 37]

Tabla 37

								
N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Cy	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
6-51	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	6-CF <sub>3</sub>	O	
6-52	H	Me	Me	Pirimidin-2-ilo	Pi-2-ilo	4-CF <sub>3</sub> -6-Cl	O	139-140
6-53	H	Me	Me	4,5-Me <sub>2</sub> -tiazol-2-ilo	Pi-2-ilo	4-CF <sub>3</sub> -6-Cl	O	138-139
6-54	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-4-ilo	2-Br-6-Me	O	
6-55	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	4-CF <sub>3</sub>	O	
6-56	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-4-ilo	2,6-Br <sub>2</sub>	O	
6-57	H	Me	Me	Pirimidin-2-ilo	Pi-2-ilo	4,6-Cl <sub>2</sub>	O	178-179
6-58	H	Me	Me	Pirimidin-2-ilo	Pi-4-ilo	2,6-Cl <sub>2</sub>	O	155-156
6-59	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	4,6-Cl <sub>2</sub>	O	136-137
6-60	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-4-ilo	2-Br-6-Cl	O	
6-61	H	Me	Me	Me	Pi-4-ilo	2-Cl	O	
6-62	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-4-ilo	2-Cl-6-N(Me) <sub>2</sub>	O	
6-63	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	4-CF <sub>3</sub> -6- <sup>i</sup> Pr	O	
6-64	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-4-ilo	2-CN-6-Me	O	
6-65	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pirimidin-4-ilo	2-Me-6-Cl	O	
6-66	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pirimidin-4-ilo	2,6-Cl <sub>2</sub>	O	
6-67	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-3-ilo	5,6-Cl <sub>2</sub>	O	111-113
6-68	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-4-ilo	2-Br-6-CF <sub>3</sub>	O	
6-69	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-2-ilo	4-Br-6-CF <sub>3</sub>	O	
6-70	H	Me	Me	Pi-2-ilo	Pi-3-ilo	6-Cl	O	154-126
6-71	H	Me	Me	Pirimidin-2-ilo	Pi-3-ilo	6-Cl	O	120-122

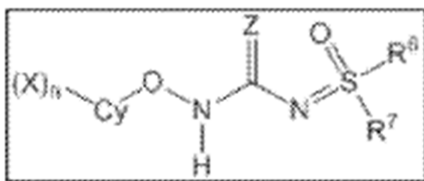
[Fórmula química 26]



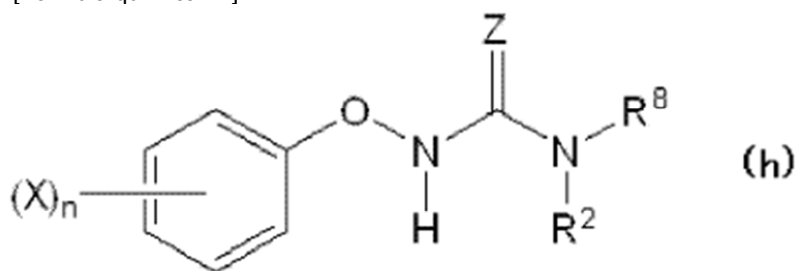


[Tabla 38]

Tabla 38

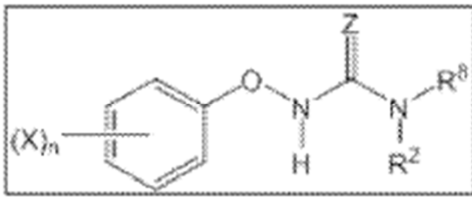
						
N.º	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Cy	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
7-1	Me	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	
7-2	-C <sub>4</sub> H <sub>8</sub> -		Ph	3-Br-5-Cl	O	137-139
7-3	Me	Ph	Ph	3-Br-5-Cl	O	127-129
7-4	Me	Pi-2-ilo	Ph	3-Br-5-Cl	O	158-160
7-5	Me	<sup>n</sup> Bu	Ph	3-Br-5-Cl	O	114-116
7-6	Me	Ph	Ph	4-Br-3,5-Cl <sub>2</sub>	O	193-195

[Fórmula química 27]



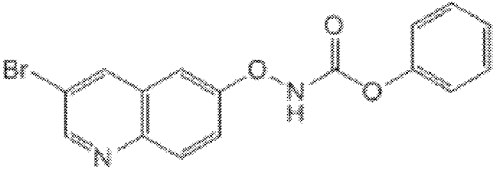
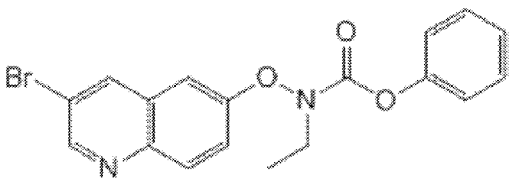
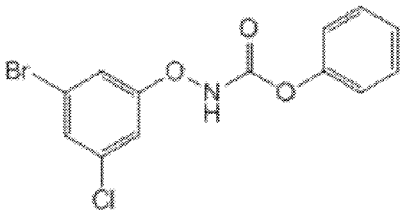
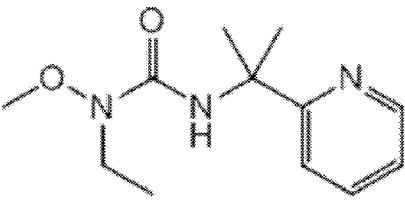
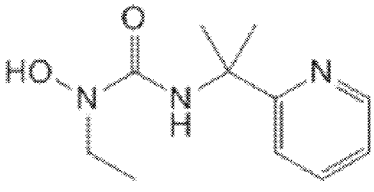
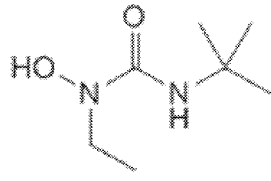
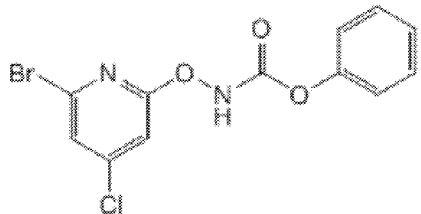
[Tabla 39]

Tabla 39

					
N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>8</sup>	(X) <sub>n</sub>	Z	Punto de fusión (°C)
8-1	Me	Ph	3-Br-5-Cl	O	124-126
8-2	H	Ph	3-Br-5-Cl	O	174-176
8-3	H	Indan-1-ilo	3-Br-5-Cl	O	192-193
8-4	H	1,2,3,4-Tetrahidro-naftalen-1-ilo	3-Br-5-Cl	O	181-184
8-5	H	5,6,7,8-Tetrahidro-quinolin-8-ilo	3-Br-5-Cl	O	193-
8-6	H	2-Ph- <sup>o</sup> Pr	3-Br-5-Cl	O	167-171
8-7	H	Quinolin-8-ilo	3-Br-5-Cl	O	188-189

8-8	H	CO <sub>2</sub> Et	3-Br-5-Cl	O	171-173
-----	---	--------------------	-----------	---	---------

[Tabla 40]

Tabla 40		
N.º	Estructura	Punto de fusión
9-1		118-120
9-2		amo
9-3		127-129
9-4		vis
9-5		73-75
9-6		59-81
9-7		131-133

Entre los compuestos mostrados en el <sup>1</sup>H RMN (CDCl<sub>3</sub>) se midió para los siguientes compuestos. Los resultados de la medición se muestran a continuación.

[Tabla 41]

N.º	<sup>1</sup> H RMN (CDCl <sub>3</sub> , δ ppm)
5-127	7,64~7,45(a, 1 H), 7,39 (d, 1 H), 7,31 (d, 1 H), 7,02 (dd, 1 H), 6,90 (a, 1H), 6,02 (a, 1 H), 3,96~3,88 (m,2H), 1,59 (s, 6H)
6-45	8,73 (a, 1H), 8,48~8,45 (m,2H), 8,38(d,1H), 7,95 (a, 1H), 7,71 (t, 1 H), 7,37 (d, 1H), 7,18 (dd, 1H), 1,75(s, 6H)
9-4	8,52 (dd, 1 H), 7,75 (a, 1 H), 7,66 (t, 1 H), 7,40 (d, 1H), 7,16 (dd, 1H), 3,73 (s,3H), 3,51 (c, 2H), 1,75 (s, 6H), 1,13 (t, 3H)

5 A continuación se muestran algunos ejemplos de preparación del agente de control de plagas de acuerdo con la presente invención. Sin embargo, los aditivos y las relaciones de adición no se limitan a los ejemplos de preparación, y pueden modificarse en un amplio intervalo. Además, el término "partes" utilizado en los ejemplos de preparación indica "partes en peso". Los siguientes son los ejemplos de preparación para uso agrícola y hortícola.

Ejemplo de preparación 1 (polvo humectable)

Compuesto de la presente invención	40 partes
Tierra de diatomeas	53 partes
Sulfato de alcohol graso	4 partes
Sulfonato de alquilnaftaleno	3 partes

10 Lo anterior se mezcla uniformemente y se pulveriza de forma fina para obtener un polvo humectable que incluye un 40 % de principio activo.

Ejemplo de preparación 2 (emulsión)

Compuesto de la presente invención	30 partes
Xileno	33 partes
Dimetilformamida	30 partes
Polioxietileno alquilalil éter	7 partes

15 Lo anterior se mezcla y se disuelve para obtener una emulsión que incluye un 30 % de principio activo.

Los siguientes son los ejemplos de preparación para la prevención de epidemias y animales.

Ejemplo de preparación 3 (polvo granulado)

Compuesto de la presente invención	5 partes
Caolín	94 partes
Carbono blanco	1 parte

20 El compuesto de la presente invención se disolvió en un disolvente orgánico, y se pulverizó en un vehículo, seguido de la evaporación del disolvente a presión reducida. Este tipo de polvo granulado puede mezclarse con alimentos de animales.

Ejemplo de preparación 4 (agente de impregnación)

Compuesto de la presente invención	0,1-1 partes
Aceite de cacahuete	resto

25 El agente de impregnación se esteriliza por filtración mediante un filtro de esterilización después del ajuste.

Ejemplo de preparación 5 (agente de vertido)

## ES 2 708 678 T3

Compuesto de la presente invención	5 partes
Éster del ácido mirístico	10 partes
Isopropanol	resto
Ejemplo de preparación 6 (agente de acción tópica)	
Compuesto de la presente invención	10-15 partes
Éster del ácido palmítico	10 partes
Isopropanol	resto
Ejemplo de preparación 7 (agente de pulverización)	
Compuesto de la presente invención	1 parte
Propilenglicol	10 partes
Isopropanol	resto

### [Experimentos con animales]

5 Los siguientes ejemplos de ensayo demuestran que el compuesto de la presente invención es útil como un principio activo de acaricida.

#### Ejemplo de ensayo 1 Ensayo de eficacia contra *Tetranychus urticae*

10 Se inocularon diez ácaros hembra adultas *Tetranychus urticae* resistentes al fósforo orgánico en las primeras hojas de una planta de frijol plantada en una maceta N.º 3 de 7 a 10 días después de la germinación. A continuación, se preparó una emulsión que tenía la fórmula indicada en el Ejemplo de preparación 2 mencionado anteriormente. Esta emulsión se diluyó con agua hasta una concentración de compuesto de 125 ppm, después de lo cual los líquidos diluidos se pulverizaron en la planta de frijol. La planta de frijol se puso entonces en una habitación con temperatura controlada a una temperatura de 25 °C y una humedad del 65 %. La vida y la muerte de los insectos adultos se investigaron 3 días después de la pulverización. El desarrollo a partir de huevos depositados en adultos se investigó 14 días después de la pulverización.

20 El ensayo mencionado anteriormente se realizó en las emulsiones que contenían el Compuesto N.º 1-3, 1-10, 1-20, 1-21, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-39, 1-41, 1-42, 1-50, 1-51, 1-54, 1-55, 1-56, 1-57, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-65, 1-66, 1-67, 1-68, 1-71, 1-94, 1-96, 1-97, 1-98, 1-99, 1-101, 1-102, 1-103, 1-108, 1-109, 1-110, 1-111, 1-114, 1-116, 1-118, 1-119, 1-120, 1-121, 1-122, 1-124, 1-125, 1-126, 1-129, 1-130, 1-132, 1-133, 1-134, 1-135, 1-136, 1-137, 1-138, 1-140, 1-149, 1-152, 1-160, 1-161, 1-171, 1-177, 1-178, 1-179, 1-180, 1-181, 1-182, 1-183, 1-184, 1-185, 1-186, 1-187, 1-188, 1-189, 1-190, 1-191, 1-192, 1-193, 1-194, 1-196, 1-197, 1-198, 1-199, 1-200, 1-201, 1-202, 1-203, 1-204, 1-205, 1-206, 1-207, 1-209, 1-211, 1-212, 1-213, 1-214, 1-215, 1-216, 1-217, 1-218, 1-220, 1-221, 1-222, 1-223, 1-224, 1-226, 1-227, 1-228, 1-229, 1-230, 1-232, 1-233, 1-234, 1-235, 1-236, 1-237, 2-1, 2-2, 2-4, 2-6, 2-7, 2-8, 2-10, 2-11, 2-13, 2-24, 2-26, 2-33, 2-37, 2-39, 2-40, 2-42, 2-44, 2-46, 2-47, 2-50, 2-51, 2-52, 2-53, 2-55, 2-56, 2-57, 2-58, 2-59, 2-60, 2-61, 2-62, 2-63, 2-64, 2-65, 2-66, 2-67, 2-68, 2-71, 2-72, 3-3, y 3-22. Como resultado, las tasas de mortalidad de insectos para todos los compuestos en el caso de dilución a una concentración de 125 ppm fueron del 90 % o más.

#### Ejemplo de ensayo 2 Ensayo de eficacia contra *Panonychus citri*

35 Ocho ácaros hembra adultas de *Panonychus citri* de la Prefectura de Kanagawa se inocularon en una hoja de mandarina colocada en una placa de Petri. A continuación, se preparó una emulsión que tenía la fórmula indicada en el Ejemplo de preparación 2 mencionado anteriormente. Esta emulsión se diluyó con agua hasta una concentración de compuesto de 125 ppm, después de lo cual los líquidos diluidos se pulverizaron sobre la hoja de mandarina con una torre de pulverización rotatoria. Después, la hoja de mandarina se puso en una habitación con temperatura controlada a una temperatura de 25 °C y una humedad del 65 %. La vida y la muerte de los insectos adultos se investigaron 3 días después de la pulverización. El desarrollo a partir de huevos depositados en adultos se investigó 10 días después de la pulverización.

45 El ensayo mencionado anteriormente se realizó en las emulsiones que contenían el Compuesto N.º 1-3, 1-8, 1-10, 1-24, 1-50, 1-110, 1-111, 1-114, 1-116, 1-119, 1-120, 1-121, 1-122, 1-123, 1-124, 1-129, 1-134, 1-135, 1-149, 1-152, 1-161, 1-171, 1-177, 1-178, 1-179, 1-180, 1-181, 1-182, 1-183, 1-184, 1-185, 1-186, 1-187, 1-188, 1-189, 1-190, 1-192, 1-193, 1-194, 1-197, 1-199, 1-200, 1-201, 1-202, 1-204, 1-205, 1-206, 1-207, 1-209, 1-211, 1-212, 1-213, 1-214, 1-215, 1-216, 1-218, 1-220, 1-222, 1-224, 1-227, 1-229, 1-230, 1-233, 1-234, 1-235, 1-236, 1-237, 2-1, 2-2, 2-4, 2-6, 2-7, 2-10, 2-11, 2-21, 2-33, 2-37, 2-39, 2-40, 2-44, 2-50, 2-51, 2-52, 2-53, 2-55, 2-56, 2-57, 2-59, 2-60, 2-61, 2-62, 2-63, 2-64, 2-65, 2-66, 2-67, 2-68, y 2-71. Como resultado, las tasas de mortalidad de insectos para todos los compuestos en el caso de dilución a una concentración de 125 ppm fueron del 90 % o más.

Ejemplo de ensayo 3 Ensayo de eficacia contra *Panonychus citri*

Ocho ácaros hembra adultas de *Panonychus citri* resistentes a acaricida de la Prefectura de Wakayama se inocularon en una hoja de mandarina colocada en una placa de Petri. A continuación, se preparó una emulsión que tenía la fórmula indicada en el Ejemplo de preparación 2 mencionado anteriormente. Esta emulsión se diluyó con agua hasta una concentración de compuesto de 125 ppm, después de lo cual los líquidos diluidos se pulverizaron sobre la hoja de mandarina con una torre de pulverización rotatoria. Después, la hoja de mandarina se puso en una habitación con temperatura controlada a una temperatura de 25 °C y una humedad del 65 %. La vida y la muerte de los insectos adultos se investigaron 3 días después de la pulverización. El desarrollo a partir de huevos depositados en adultos se investigó 10 días después de la pulverización.

El ensayo mencionado anteriormente se realizó en las emulsiones que contenían el Compuesto N.º 1-20, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-35, 1-41, 1-42, 1-51, 1-60, 1-61, 1-63, 1-65, 1-66, 1-67, 1-68, 1-98, 1-99, 1-101, 1-116, 1-124, 1-161, 1-186, 1-189, 1-230, 2-8, 2-13, 2-26, y 2-50. Como resultado, las tasas de mortalidad de insectos para todos los compuestos en el caso de dilución a una concentración de 125 ppm fueron del 90 % o más.

Ejemplo de ensayo 4 Ensayo de eficacia contra *Tetranychus kanzawai*

Diez ácaros hembra adultas *Tetranychus kanzawai* de la Prefectura de Okayama se inocularon en las primeras hojas de una planta de frijol plantada en una maceta N.º 3 de 7 a 10 días después de la germinación. A continuación, se preparó una emulsión que tenía la fórmula indicada en el Ejemplo de preparación 2 mencionado anteriormente. Esta emulsión se diluyó con agua hasta una concentración de compuesto de 500 ppm o 125 ppm, después de lo cual los líquidos diluidos se pulverizaron en la planta de frijol. La planta de frijol se puso entonces en una habitación con temperatura controlada a una temperatura de 25 °C y una humedad del 65 %. La vida y la muerte de los insectos adultos se investigaron 3 días después de la pulverización. El desarrollo a partir de huevos depositados en adultos se investigó 14 días después de la pulverización.

El ensayo mencionado anteriormente se realizó en las emulsiones que contenían el Compuesto N.º 1-8, 1-10, 1-11, 1-13, 1-16, 1-19, 1-20, 1-21, 1-24, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-41, 1-42, 1-43, 1-46, 1-47, 1-48, 1-56, 1-57, 1-58, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-67, 1-66, 1-71, 1-74, 1-80, 1-94, 1-95, 1-96, 1-98, 1-100, 1-102, 1-104, 1-106, 1-108, 1-109, 1-110, 1-111, 1-115, 1-118, 1-119, 1-121, 1-122, 1-123, 1-124, 1-125, 1-126, 1-127, 1-131, 1-140, 1-144, 1-209, 1-212, 1-218, 1-220, 1-224, 1-225, 1-232, 1-234, 1-235, 1-236, 2-12, 2-22, 2-23, 2-24, 2-34, 2-41, 2-47, 2-55, 2-56, 3-2, 3-3, 3-4, y 4-5. Como resultado, las tasas de mortalidad de insectos para todos los compuestos en el caso de dilución a una concentración de 500 ppm fueron del 90 % o más.

El ensayo mencionado anteriormente se realizó en las emulsiones que contenían el Compuesto N.º 1-3, 1-25, 1-39, 1-40, 1-50, 1-51, 1-53, 1-55, 1-64, 1-65, 1-66, 1-68, 1-93, 1-97, 1-99, 1-101, 1-103, 1-114, 1-116, 1-120, 1-129, 1-130, 1-132, 1-135, 1-136, 1-137, 1-149, 1-150, 1-152, 1-161, 1-162, 1-171, 1-177, 1-178, 1-179, 1-181, 1-182, 1-183, 1-184, 1-185, 1-186, 1-187, 1-188, 1-189, 1-190, 1-191, 1-192, 1-193, 1-194, 1-196, 1-197, 1-198, 1-199, 1-200, 1-201, 1-202, 1-203, 1-204, 1-205, 1-206, 1-207, 1-211, 1-213, 1-214, 1-215, 1-216, 1-222, 1-223, 1-226, 1-227, 1-228, 1-229, 1-230, 1-233, 1-237, 2-5, 2-6, 2-8, 2-10, 2-13, 2-21, 2-26, 2-33, 2-37, 2-39, 2-40, 2-42, 2-44, 2-46, 2-50, 2-51, 2-52, 2-53, 2-57, 2-58, 2-59, 2-60, 2-61, 2-62, 2-63, 2-64, 2-65, 2-66, 2-67, 2-68, 2-71, 2-72, 2-76 y 3-22. Como resultado, las tasas de mortalidad de insectos para todos los compuestos en el caso de dilución a una concentración de 125 ppm fueron del 90 % o más.

Ejemplo de ensayo 5 Ensayo de eficacia contra *Aculops pelekassi*

Veinte ácaros hembra adultas resistentes a acaricida *Aculops pelekassi* se inocularon en una hoja de mandarina colocada en una placa de Petri. A continuación, se preparó una emulsión que tenía la fórmula indicada en el Ejemplo de preparación 2 mencionado anteriormente. Esta emulsión se diluyó con agua hasta una concentración de compuesto de 125 ppm, después de lo cual los líquidos diluidos se pulverizaron sobre la hoja de mandarina con una torre de pulverización rotatoria. Después, la hoja de mandarina se puso en una habitación con temperatura controlada a una temperatura de 25 °C y una humedad del 65 %. La vida y la muerte de los insectos adultos se investigaron 3 días después de la pulverización. El desarrollo a partir de huevos depositados en adultos se investigó 10 días después de la pulverización.

El ensayo mencionado anteriormente se realizó en las emulsiones que contenían el Compuesto N.º 1-3, 1-8, 1-9, 1-10, 1-13, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-41, 1-42, 1-50, 1-51, 1-55, 2-1, 2-2, 2-4, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-13, 2-21, 2-24, y 2-33. Como resultado, las tasas de mortalidad de insectos para todos los compuestos en el caso de dilución a una concentración de 125 ppm fueron del 90 % o más.

Ejemplo de ensayo 6 Ensayo de potencia insecticida contra *Haemaphysalis longicornis*

Se añadieron 0,118 ml de una solución de acetona que tenía una concentración de 400 ppm del compuesto de la presente invención a un vial de vidrio de 20 ml. Se suministró aire al interior del vial de vidrio usando un secador, mientras se giraba el vial de vidrio, volatilizándolo de esta manera la acetona para formar una película delgada en la

pared interior del vial de vidrio. Dado que el área de superficie de la pared interior del vial de vidrio era de 47 cm<sup>2</sup>, la cantidad de solución de fármaco por área de superficie era de 1 µg/cm<sup>2</sup>.

5 Se colocaron de quince a cuarenta garrapatas larvales *Haemaphysalis longicornis* en el vial de vidrio, seguido del cierre del vial de vidrio y se colocó en una habitación con temperatura controlada (25 °C, oscuridad).

La tasa de mortalidad de los insectos se calculó después de 1 día y 2 días.

10 Tasa de mortalidad de los insectos (%) = (el número de garrapatas muertas/el número de garrapatas liberadas) x 100

El ensayo mencionado anteriormente se realizó en el Compuesto N.º 1-161, 2-1, 2-13, y 2-26. Como resultado, todos los compuestos demostraron el 100 % de la tasa de mortalidad de los insectos.

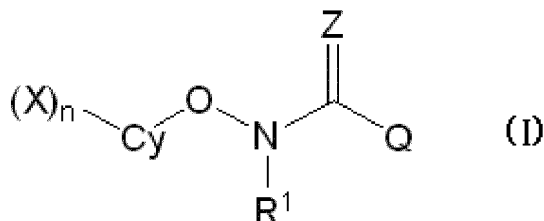
15 De acuerdo con los resultados mencionados anteriormente, el compuesto de la presente invención demuestra una actividad pesticida superior contra el ácaro.

#### **Aplicabilidad industrial**

20 El compuesto de ariloxiurea, o una sal del mismo de acuerdo con la presente invención, puede proteger los cultivos agrícolas contra una infección por organismos nocivos. Además, también tiene aplicaciones de higiene. Particularmente, el compuesto de la presente invención es capaz de reducir eficazmente la infección por ácaros y/o patógenos de plantas.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de ariloxiurea representado por la fórmula (I) o una sal del mismo:



5

en la que, Cy representa un grupo heteroarilo o un grupo arilo C6-10;

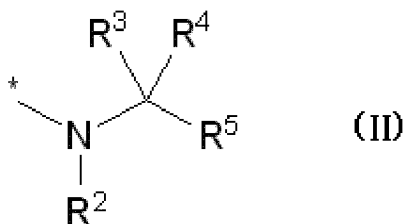
X representa un grupo alquilo C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo cicloalquilo C3-8 sin sustituir o sustituido, grupo alqueno C2-6 sin sustituir o sustituido, grupo alquino C2-6 sin sustituir o sustituido, grupo hidroxilo, grupo alcoxi C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo amino, grupo alquil amino C1-6 sustituido o sin sustituir, grupo acilo C1-7 sin sustituir o sustituido, grupo alcoxycarbonilo C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo alquil sulfonilo C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo alcoxisulfonilo C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo arilo C6-10 sin sustituir o sustituido, grupo heteroarilo sin sustituir o sustituido, grupo hidroximino alquilo C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo nitro, grupo ciano, o un átomo de halógeno;

n representa el número de X unidos a Cy y representa un número entero de 0 a 5; cuando n es 2 o más, X pueden ser iguales o diferentes entre sí, y cuando n es 2 o más, X pueden unirse entre sí para formar un anillo junto con los átomos de carbono o átomos de nitrógeno unidos al mismo;

R<sup>1</sup> representa un grupo alquilo C1-6 sin sustituir o sustituido, un grupo alqueno C2-6 sin sustituir o sustituido o un grupo alquino C2-6 sin sustituir o sustituido;

Q representa un grupo representado por la fórmula (II):

20



en la que,

25

\* representa la posición de enlace;

R<sup>2</sup> representa un átomo de hidrógeno, grupo alquilo C1-6 sin sustituir o sustituido, grupo alqueno C2-6 sin sustituir o sustituido, grupo alquino C2-6 sin sustituir o sustituido, grupo acilo C1-7 sin sustituir o sustituido, grupo alcoxycarbonilo C1-6 sin sustituir o sustituido, R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> pueden unirse juntos para formar un grupo alqueno C2-4 sin sustituir o sustituido;

30

R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> representan cada uno independientemente un grupo alquilo C1-6 sin sustituir o sustituido;

R<sup>5</sup> representa un grupo arilo C6-10 sin sustituir o sustituido, un grupo heteroarilo sin sustituir o sustituido o un grupo aminocarbonilo sin sustituir o sustituido;

35

Z representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre.

2. Un agente de control de plagas, que comprende al menos uno del compuesto de ariloxiurea o una sal del mismo de acuerdo con la reivindicación 1 como principio activo.

40

3. Un acaricida, que comprende al menos uno del compuesto de ariloxiurea o una sal del mismo de acuerdo con la reivindicación 1 como principio activo.

4. Un fungicida, que comprende al menos uno del compuesto de ariloxiurea o una sal del mismo de acuerdo con la reivindicación 1 como principio activo.

45

5. Uso de un compuesto de ariloxiurea o una sal del mismo, compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 como agente de control de plagas.

6. Uso de un compuesto de ariloxiurea o una sal del mismo, compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 como un acaricida.

5 7. Uso de un compuesto de ariloxiurea o una sal del mismo, compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 como fungicida.