

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-100879-00000-0000

Fecha: 2011-08-09 15:12:18 Dep. 2030 DIR. NUEVASOR
Tra. 11 PATENTE/II Evt. 378 FASE NACIONAL I
Act. 411 PRESENTACIÓN Folios: 227

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

PCT
SOLICITUD

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
INVENTARIO

PATENTE DE INVENCION

11-100879

21. EXPEDIENTE N°

54. TÍTULO HERBICIDAS NOVEDOSOS.

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL C07D 309/10

71. SOLICITANTE Syngenta Limited

DOMICILIO Guildford, Surrey, Reino Unido de la Gran Bretaña

74. APODERADO DILIA MARIA RODRIGUEZ D'ALEMAN

22. BOGOTÁ, D.C.

Resumen, Cur
16-08-2011



No. 11-100879- -00000-0000

Fecha: 2011-08-09 15:13:16 Dep. 3020 DIR. NUEVASOR
Tra. 11 PATENTE I/II Eje: 378 FASE NACIONAL
Act. 411 PRESENTACION Folios: 227

**FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL**

SOLICITUD DE:

1

☒

Patente de Invención

☐

Patente de Modelo de Utilidad

☒

Capítulo I.

☐

Capítulo II.

2

**SOLICITANTE
(71)**

Nombre: **Syngenta Limited**

Dirección: European Regional Centre, Priestley
Road, Surrey Research Park, Guildford, Surrey
GU2 7YH, Reino Unido de la Gran Bretaña.

Nacionalidad o Domicilio: Guildford, Surrey,
Reino Unido de la Gran Bretaña

Lugar de Constitución: Reino Unido de la
Gran Bretaña.

Teléfono:

Fax:

E-mail

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número

3

**REPRESENTANTE
O APODERADO
(74)**

Nombre: **DILIA MARIA RODRIGUEZ
D'ALEMAN**

Dirección: Cra. 11 No. 86-53 piso 6

Teléfono: 6 162051/61 Fax: 6 161889

E-mail: clarkemodet@clarkemodet.com.co

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número 41.654.882 T.P. 20924
CSJ

4

**INVENTOR (ES)
(72)**

Nombre: **VER HOJA ANEXA**

Dirección:

Nacionalidad o domicilio:

5

PCT (86)

Solicitud Internacional No. PCT/EP2010/050074 Fecha 06 de enero de 2010

Publicación Internacional No. WO 2010/081755 A1 Fecha 22 de julio de 2010

6

TÍTULO (54) HERBICIDAS NOVEDOSOS.

7

Clasificación Internacional (51) C07D 309/10

8

Prioridad

SI

☒

NO

☐

(33) País de Origen
REINO UNIDO

(32) Fecha

15 de enero de 2009

(31) Número de Solicitud

0900641.2

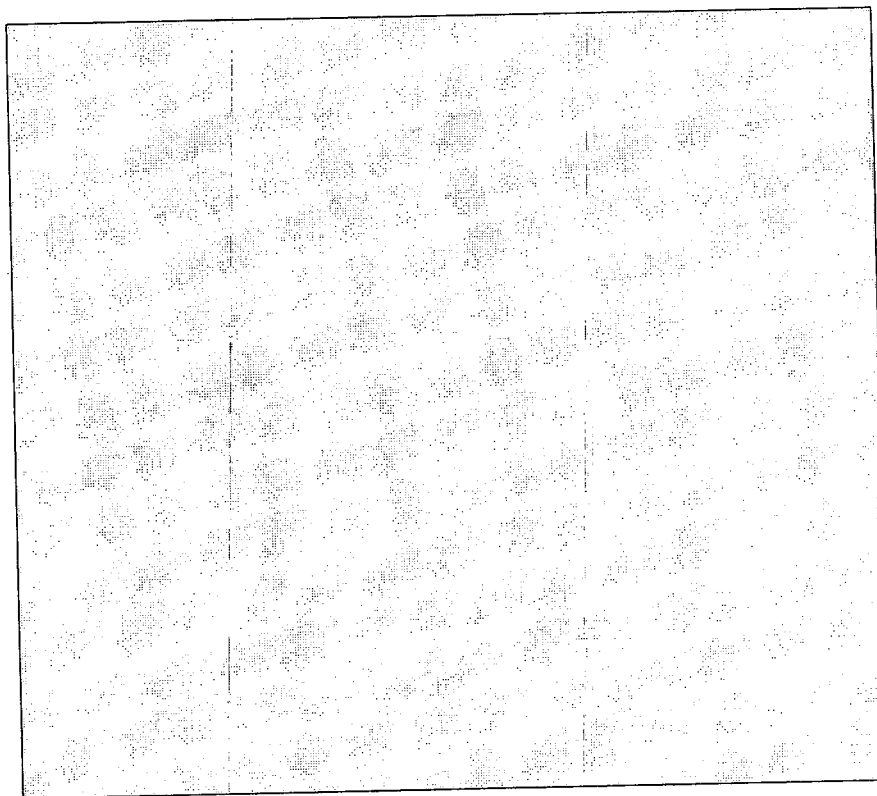
9 Comprobante de pago No. 11-72209 // 11-57899 // 11-72825

Fecha 27 de julio de 2011 // 15 de junio de 2011 // 28 de julio de 2011

Recibido: 14/ 2011-08-11/ 14/100

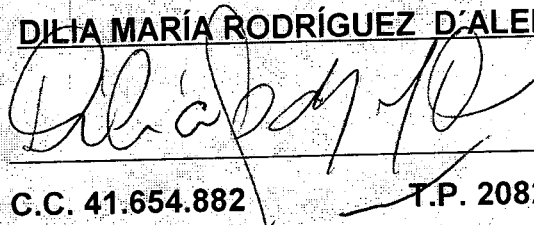
- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud
- ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica
- ☒ Poderes si fuere el caso
- ☐ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante
- ☒ Declaraciones Regla 4.17
- ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☐ Copia del examen preliminar internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen Preliminar (IPEA).
- ☐ Traducción del examen preliminar internacional efectuado por la IPEA
- ☐ De ser el caso copia de contrato de acceso.
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas
- ☐ De ser el caso, certificado de deposito del material biológico
- ☐ Arte final 12 X 12 .
- ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.
- ☐ De ser el caso, modificaciones efectuadas a la solicitud internacional
- ☐ Otros

11 FIGURA CARACTERÍSTICA



12 Solicito la concesión de la patente

NOMBRE : DILIA MARÍA RODRÍGUEZ D'ALEMAN

FIRMA: 

C.C. 41.654.882

T.P. 20824

ANEXO

INVENTORES

- 1.) MATHEWS, Christopher, John**
(SYNGENTA LIMITED, Jeallotts Hill, International Research Center, Bracknell Berkshire RG42 6EY, Reino Unido de la Gran Bretaña);
- 2.) FINNEY, John**
(SYNGENTA LIMITED, Jeallotts Hill, International Research Center, Bracknell Berkshire RG42 6EY, Reino Unido de la Gran Bretaña);
- 3.) SCUTT, James Nicholas**
(SYNGENTA LIMITED, Jeallotts Hill, International Research Center, Bracknell Berkshire RG42 6EY, Reino Unido de la Gran Bretaña);
- 4.) ROBINSON, Louisa**
(SYNGENTA LIMITED, Jeallotts Hill, International Research Center, Bracknell Berkshire RG42 6EY, Reino Unido de la Gran Bretaña);
- 5.) DELANEY, John Stephen**
(SYNGENTA LIMITED, Jeallotts Hill, International Research Center, Bracknell Berkshire RG42 6EY, Reino Unido de la Gran Bretaña).

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

- / -

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0072209

Bogotá D.C., Julio 27 de 2011 - 16:34:02

RECIBIDO DE : CLARKE MODET

NI 830.008.643

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	432287553	27/07/2011	39.655.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	VR. LINDITARIO	VR. CONCEPTO
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	49 INSCRIPCION DE LICENCIAS Y DERECHOS REALES	515.000.00	515.000.00
				\$515.000.00

SON: **QUINIENTOSQUINCE MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-100879- -00000-0000

Fecha: 2011-08-09 15:12:16 Dep. 2020 DIR. NUEVAS CR.
Tra. 11 PATENTE/III Eje: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 227

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5370000 Fax: (571) 5070284 Línea: 013000-910165 Call Center: (571) 6513240

Julio 27 de 2011 - 16:34:13

3

12-3011

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.093-2

- / -



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0057899

Bogotá D.C., Junio 15 de 2011 - 16:48:11

RECIBIDO DE : CLARKE MODET

NI 830.008.643

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VP PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	155755423	15/06/2011	89.795.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT. PENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNIDITARIO	Vr. CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	82 INVOCACION DE UNA PRIORIDAD EN NUEVAS CREACIONES	162.000.00	162.000.00
			<u>\$162.000.00</u>

SON: ** CIENTO SESENTA Y DOS MIL PESOS MONEDA CORRIENTE ***

Responsable _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-100879- -00000-0000

Fecha: 2011-08-09 15:12:16 Dep. 2020 DIR. NUEVASOR
Tra. 11 PATENTEYII Evs. 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 227

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C. - Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5070000 Fax: (571) 5070284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

Junio 15 de 2011 - 16:48:33

4

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

- / -



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0072825

Bogotá D.C., Julio 28 de 2011 - 16:47:13

RECIBIDO DE : CLARKE MODET

NI 830.008.643

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PAGO	VP. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	432287623	28/07/2011	40.700.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CAUT. REUTISTICO	CONCEPTO	VL. UNIDITARIO	VL. CONCEPTO
1 50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	2.000.00	2.000.00
			<u>\$2.000.00</u>
			=====

SON: **DOS MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-100879-00000-0000

Fecha: 2011-08-09 15:12:16 Desp. 2020 DIR. NUEVASOR
Tra. 11 PATENTE IYII Evg. 378 FASE NACIONAL I
Act. 411 PRESENTACION Folios: 227

S

Sede Central: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C. - Colombia

Web: www.sic.gov.co Email: info@sic.gov.co Correo: (571) 5370000 Fax: (571) 5370284 Línea: 010000-910165 Call Center: (571) 6513290

Julio 28 de 2011 - 16:47:43

COLOMBIA

Carrera 11 N° 86-53 Piso 6 Bogotá Colombia Tel: (57 1) 6181088 Fax: (57 1) 6350824 Email: info@clarkemodet.com.co

PODER

Yo (nosotros), abajo firmante(s)

Clare Dowling

en mi (nuestro) carácter de representante(s) legales de

Syngenta Limited

una sociedad organizada y existente de acuerdo con las leyes de

Inglaterra y Gales

y en actual cumplimiento de su objeto social, con domicilio en

Bracknell, Berkshire, Reino Unido.

por el presente instrumento confiero (conferimos) poder especial a favor de DILIA MARIA RODRIGUEZ D'ALEMAN, con Cédula de Ciudadanía No. 41.654.882 de Bogotá, y tp. 20824 y CLAUDIA LUCIA CARO RAMIREZ, con Cédula de Ciudadanía No. 40.017.374 de Tunja, y tp. 36448, con domicilio en Bogotá, Colombia, para que actuando en su orden en nombre del (de la) otorgante le (la) representen ante cualquier entidad, autoridad y/o persona, especialmente ante las del orden Administrativo, Contencioso Administrativo, Judicial, Tribunales de Arbitramento y/o cualquier otro en lo referente a los siguientes asuntos:

- 1) Solicitar, tramitar, obtener y/o registrar cualquiera de las modalidades de Propiedad Industrial, tales como: patentes de invención, modelos de utilidad, diseños industriales, variedades vegetales, marcas, lemas, nombres y enseñas comerciales y denominaciones de origen; así como sus renovaciones, prórrogas, transferencias, cambios de nombre y/o domicilio, contratos y licencias.
- 2) Solicitar, tramitar, obtener y/o registrar derechos de autor, en cualquiera de sus presentaciones así como la protección de secretos industriales y know-how.
- 3) Solicitar, tramitar, obtener y/o registrar registros sanitarios, permisos y/o licencias de funcionamiento; así como sus renovaciones o prórrogas, transferencias, cambios de nombre y/o domicilio, contratos y licencias.
- 4) Ejercer acciones de oposición, observación, reclamos, reconsideración, reposición, apelación, cancelación administrativa o judicial, nulidad, protección al consumidor, concesión de licencias, protección de secretos industriales y demás acciones y recursos relacionados con derechos derivados de los asuntos arriba indicados y en contra de la competencia desleal, acciones derivadas de la obtención o explotación de licencias, acciones de indemnización de perjuicios. También podrá(n) intervenir en juicios civiles, comerciales, penales, contencioso-administrativos, tutelas y de policía; en acciones o juicios promovidos por el (la) mandante o en contra el (ella).
- 5) Registrar nombres de dominio ante la entidad competente.
- 6) En el ejercicio de este mandato los mandatarios arriba mencionados quedan facultados para: conciliar, cancelar, transigir, comprometer en árbitros, desistir, recibir y tomar posesión de la cosa objeto de litigio y renunciar o desistir a derechos concedidos o en curso de concesión, admitir los hechos del proceso.
- 7) Ratificar o no la agencia oficiosa.
- 8) Así mismo faculto (facultamos) a los mencionados apoderados para recibir notificaciones y designar apoderados judiciales o extrajudiciales, sustituir el presente poder y revocar las sustituciones que hicieron.

Dado y firmado en

a los

días de

Clare Dowling
Firma / signature

Clare DOWLING, Authorised Signatory, Syngenta Limited

POWER OF ATTORNEY

I (we), the undersigned:- Clare DOWLING

legal representative(s) of:- SYNGENTA Limited

an organization existing under the laws of:- England & Wales

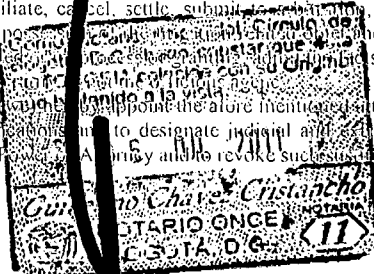
and in present execution of its business activity, domiciled at:- Bracknell, Berkshire, United Kingdom

do hereby grant POWER OF ATTORNEY to DILIA MARIA RODRIGUEZ D'ALEMAN, identification card No. 41.654.882 of Bogotá, and tp. 20824 and CLAUDIA LUCIA CARO RAMIREZ, tp. 36448, identification card No. 40.017.374 of Tunja, residing in Bogotá, Colombia, to act in the order of their appointment in behalf of grantor before any entity, authority and/or natural or juridical person, specially before those Administrative, Administrative-Contentious, Judicial, arbitration courts, and/or any other, in all matters concerning the following:

- 1) To apply, process, obtain and/or register any of the modalities of Industrial Property, such as: Patents of Invention, Utility Models, Designs, plant varieties, Marks, Slogans, Trade Names and emblems and appellations of Origin; as well as their renewals, assignments, changes of name and/or domicile, agreements and licenses.
- 2) To apply, process, obtain and/or register copyrights of any kind as well as protection of industrial secrets or know-how.
- 3) To apply, process, obtain and/or register sanitary registrations, operating authorizations and/or licenses; as well as their renewals or assignments, changes of name and/or domicile, agreements and licenses.
- 4) To bring actions of opposition, observations, claims, reconsideration, appeal or legal remedies, cancellations, nullity, protection to the consumer, granting of licenses, protection of trade secrets and other actions related with rights derived from the above-mentioned matters and against the unfair competition, actions resulting from the obtaining or exploitation of licenses, recovering damages actions. They can also intervene or participate in Civil, Commercial, Criminal or Contentious-Administrative Trials; the actions for writ mandamus, police actions; in actions, lawsuits or litigations instituted by the grantor or against him.
- 5) To register domain names before the competent entity.
- 6) To the effect of this mandate the above-named proxy are empowered to: conciliate, cancel, settle, submit to arbitration, withdraw and to receive and take possession of the thing that is the object of the case and waive or renounce the rights granted by the court or the arbitral tribunal.
- 7) To receive and take possession of the thing that is the object of the case.
- 8) I (we) hereby appoint the above mentioned attorneys with powers to receive notifications and to designate judicial and extrajudicial attorneys, substitute this Power of Attorney and to revoke such substitutions

Granted and signed at: Bracknell, United Kingdom

on this 27th day of July 2009



CERTIFICADO NOTARIAL

(Cuando el solicitante es SOCIEDAD)

(Poderes otorgados en: El Salvador, Estados Unidos, México y Venezuela)

A los _____ días del mes de _____ de _____
el Notario que suscribe DA FE de que:

1. _____
(nombre de la persona que firma el poder)

mayor de edad y domiciliado en _____
y letra el documento que antecede. _____ firmó de su puño

2. Conoce al (a la) otorgante y que este (a) está legalmente capacitado para el otorgamiento.

3. El otorgante ha firmado el referido documento en su carácter de _____
de la persona jurídica _____

4. La citada persona jurídica con sede en _____ está legalmente constituida, que tiene actualmente existencia legal y que el acto para el cual se ha otorgado este poder está comprendido entre los que constituyen su objeto social.
5. El otorgante tiene efectivamente la representación que ostenta, que esta es legítima y que está facultado para otorgar este poder.
6. Las anteriores certificaciones de los puntos 3, 4 y 5, me constan porque he tenido a la vista los documentos auténticos.

Notario Público

NOTA: A continuación de lo anterior, el Cónsul de Colombia debe autenticar la firma del Notario Público.

CERTIFICADO NOTARIAL (Cuando el solicitante es INDIVIDUO)

A los _____ días del mes de _____ de _____
el Notario que suscribe DA FE de que:

1. _____
(nombre de la persona que firma el poder)

mayor de edad y domiciliado en _____
firmó en su presencia el documento que antecede, conoce al otorgante y que este está legalmente capacitado para el otorgamiento.

Notario Público

NOTA: A continuación de lo anterior, el Cónsul de Colombia debe autenticar la firma del Notario Público.

Para todos los demás países el Señor Cónsul de Colombia o ante quien se otorgue, debe expedir una certificación dejando constancia 1) de la existencia legal de la sociedad, 2) de que esta ejerce actualmente su objeto social, y 3) de que la persona o personas que otorgan el poder están facultadas para hacerlo, dejando constancia así mismo de que tuvo a la vista las pruebas que acrediten tales circunstancias.

LEGALIZACIÓN POR EL CONSUL DE COLOMBIA
O POR APOSTILLA

NOTARIAL CERTIFICATE

(When the applicant is a CORPORATION)

(Powers of attorney granted in: El Salvador, Mexico, U.S.A. and Venezuela)

This _____ day of _____ 2009.
the undersigned Notary CERTIFIES that:

1. CLARE DOWLING
(name of the person who signs the power of attorney)

of _____ legal _____ age and _____ her _____ domiciled in ENGLAND set her hand on the foregoing document.

2. The grantor is to him personally known and that he/she has legal capacity to execute the document.

3. The grantor has executed the foregoing document in his capacity of Authorized representative of the juridical person Syngeon Limited.

4. The mentioned juridical person with place of business in ENGLAND

is duly organized, has actual legal existence and that the purposes for which the power of attorney is granted are within the scope of its corporate purposes.

5. The grantor has in fact the referred quality and that he/she is empowered to grant this power of attorney.

6. I have based the above certifications 3, 4 and 5, on the authentic documents which for such purpose were exhibited to me.

Notary Public

RICHARD GARETH GRIFFITHS
Solicitor & Notary Public
1 Friar St, Reading

NOTA: Then the Colombian Consul must legalize the signature of the Notary Public.

NOTARIAL CERTIFICATE (When the applicant is an INDIVIDUALS)

On this _____ day of _____
the undersigned Notary CERTIFIES that:

1. _____
(name of the person who signs the Power of Attorney)

of legal age and _____
document, the _____ presence the foregoing document, that _____ that he/she has legal capacity to execute the document.

Notary Public

NOTA: Then the Colombian Consul must legalize the signature of the Notary Public.

For all other cases the Colombian Consul or before who it is granted must issue a certificate leaving constancy 1) that the person or persons who grant this Power of Attorney are empowered to do it. The Consul will certify also that the documents evidencing those circumstances were exhibited to him.

LEGALIZATION BY THE COLOMBIAN CONSUL OR BY APOSTILLE.

APOSTILLE

(Hague Convention of 5 October 1961 / Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

UNITED KINGDOM OF GREAT BRITAIN AND NORTHERN IRELAND

1. Country: United Kingdom of Great Britain and Northern Ireland
Pays: Royaume-Uni de Grande-Bretagne et d'Irlande du Nord

This public document / Le présent acte public

2. Has been signed by Richard Gareth Griffiths
a été signé par

3. Acting in the capacity of Notary Public
agissant en qualité de

4. Bears the seal/stamp of The Said Notary Public
est revêtu du sceau/timbre de

5. at London/à Londres

Certified/Attesté

6. the/le 06 August 2009

7. by Her Majesty's Principal Secretary of State for Foreign and Commonwealth Affairs /
par le Secrétaire d'Etat Principal Secrétaire d'Etat aux Affaires Etrangères et du Commonwealth.

8. Number/sous No. 2009238315

9. Stamp:
timbre

10. Signature: J Hibbert



For the Secretary of State / Pour le Secrétaire d'Etat

If this document is to be used in a country which is not party to the Hague Convention of 5 October 1961, it should be presented to the consular section of the mission representing that country. An apostille or legalisation certificate only confirms that the signature, seal or stamp on the document is genuine. It does not mean that the contents of the document are correct or that the Foreign & Commonwealth Office approves of the contents.

Traducción oficial hecha por Jimena Escobar Uribe, traductora e intérprete oficial según resolución No. 0369 del Ministerio de Justicia, del documento legalizado mediante la APOSTILLA No. I238315 de 6 de agosto de 2009 expedida en Reino Unido de Gran Bretaña, el cual corresponde a un documento de poder otorgado por la sociedad SYNGENTA LIMITED, organizada y existente de acuerdo con las leyes de Inglaterra y Gales, domiciliada en Bracknell, Berkshire, Gran Bretaña y certificación notarial, ambos en inglés con idéntico texto en español, razón por la cual no se hace su traducción.

Jimena Escobar Uribe
JIMENA ESCOBAR URIBE
Traductor e Intérprete Oficial
Resolución No. 0369 Min. Justicia 1995

Documento de poder firmado el 27 de julio de 2009 por Clare Dowling, firmante autorizada de Syngenta Limited. Sello

Certificado notarial expedido el 28 de julio de 2009 y legalizado por sello notarial y firma.

Sello: Richard Gareth Griffiths, abogado y notario público, 1 Friar St., Reading, Inglaterra.

APOSTILLA

(Convención de la Haya de 5 de octubre de 1961)

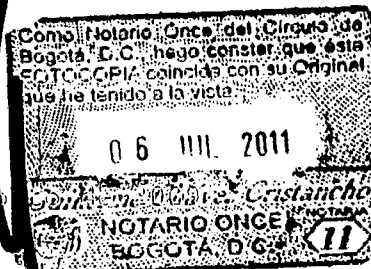
Reino Unido de la Gran Bretaña e Irlanda del Norte

1. Pais: Reino Unido de la Gran Bretaña e Irlanda del Norte
- Este documento público
2. Ha sido firmado por Richard Gareth Griffiths
3. Actuando en su calidad de Notario Público
4. Lleva el sello/estampilla de Dicho Notario Público

CERTIFICADO

5. En Londres

6. El 6 de agosto



8

7. Por el Secretario de Estado Principal de su Majestad para Asuntos Extranjeros y del Commonwealth

8. NO. I238315

9. Sello/Estampilla: Oficina Extranjera y del Commonwealth, Londres

10. Firma R. Bawden

Por el secretario de Estado

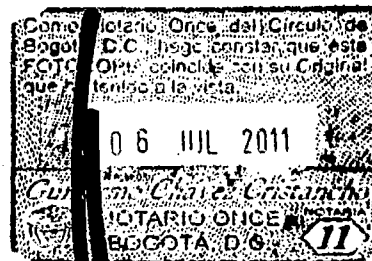
Si este documento va a ser usado en un país que no sea parte de la Convención de la Haya de 5 de octubre de 1961, debe ser presentado a la sección consular de la misión que representa ese país. Una apostilla o certificado de legalización solo confirma que la firma, sello o estampilla sobre el documento es genuina. No significa que el contenido del documento sea correcto o que la Oficina Extranjera y del Commonwealth apruebe su contenido.

Jimena Escobar Uribe
JIMENA ESCOBAR URIBE
 Traductor e Intérprete Oficial
 Resolución No. 0369 Min. Justicia 1995

122111

JIMENA ESCOBAR

100160226 A 9-56

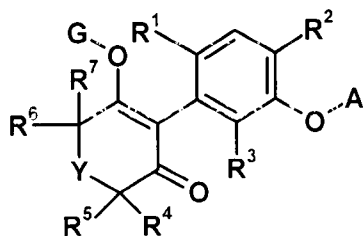


9

RESUMEN

Compuestos de la fórmula

5



en donde los sustituyentes son como se define en la reivindicación 1, son adecuados para uso como herbicidas.

10

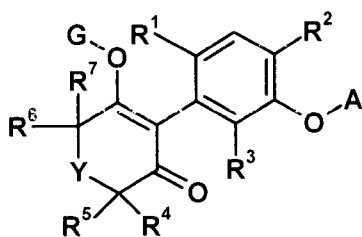
HERBICIDAS NOVEDOSOS

La presente invención se relaciona con dionas cíclicas herbicidamente activas, novedosas, y derivados de las mismas, con procesos para su preparación, con composiciones que comprenden aquellos compuestos, y con su uso en el control de malezas, especialmente en cultivos de plantas útiles, o en la inhibición del crecimiento de plantas no deseadas.

Las dionas cíclicas que tienen acción herbicida se describen, por ejemplo, en la WO08/071405 y WO08/145336.

Ahora se han encontrado dinas cíclicas novedosas, y derivados de las mismas, que tienen propiedades herbicidas y que inhiben el crecimiento.

La presente invención de acuerdo con lo anterior se relaciona con compuestos de la fórmula I



I,

en donde

A es un arilo mono o bicíclico o heteroarilo que contiene un heteroátomo seleccionado de nitrógeno, oxígeno y azufre, y que es no sustituido o sustituido,

R^1 es metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, ciclopropilo, halometilo, haloetilo, vinilo, propenilo, etinilo, propinilo, halógeno, metoxi, etoxi, halometoxi o haloetoxi,

R^2 y R^3 son independientemente uno del otro hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, ciclopropilo, halometilo, haloetilo, vinilo, propenilo, etinilo, propinilo, halógeno, metoxi, etoxi, halometoxi o haloetoxi,

R^4 , R^5 , R^6 y R^7 son independientemente uno del otro hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alquilo C_1-C_6 sustituido por alcoxi C_1-C_4 o halógeno, alquenilo C_2-C_6 , alquenilo C_2-C_6 sustituido por alcoxi C_1-C_4 o halógeno,

alquinilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 sustituido por alcoxi C_1-C_4 o halógeno, cicloalquilo C_3-C_7 , cicloalquilo C_3-C_7 sustituido por alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 , cicloalquenilo C_5-C_7 , cicloalquenilo C_5-C_7 sustituido por alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 , heterociclilo o heterociclilo sustituido por alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 , o

R^4 y R^5 , o R^6 y R^7 , junto con los átomos a los cuales ellos se unen, forman un espiro-carbociclilo o espiro heterociclilo de 5 a 8 miembros, que contiene uno o dos heteroátomos seleccionados de nitrógeno, oxígeno o azufre, o

R^5 y R^6 , junto con los átomos a los cuales ellos se unen, forman un carbociclilo o heterociclilo de 5 a 8 miembros, que contiene uno o dos heteroátomos seleccionados de nitrógeno, oxígeno o azufre,

Y es O, $S(O)_n$, $C=O$, CR^8R^9 o $CR^{10}R^{11}CR^{12}R^{13}$,

n es 0, 1 o 2,

R^8 y R^9 son independientemente uno del otro hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alquilo C_1-C_6 sustituido por alcoxi C_1-C_4 o halógeno, alqueno C_2-C_6 , alqueno C_2-C_6 sustituido por alcoxi C_1-C_4 o halógeno,

5 alquino C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 sustituido por alcoxi C_1-C_4 o halógeno, cicloalquilo C_3-C_7 , cicloalquilo C_3-C_7 sustituido por alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 , cicloalqueno C_5-C_7 , cicloalqueno C_5-C_7 sustituido por alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 , heterociclilo o heterociclilo sustituido por alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 , o

10 R^8 y R^9 , junto con los átomos a los cuales ellos se unen, forman un espiro-carbociclilo o espiro heterociclilo de 5 a 8 miembros, que contiene uno o dos heteroátomos seleccionados de nitrógeno, oxígeno o azufre, y

R^{10} , R^{11} , R^{12} y R^{13} son independientemente uno del otro hidrógeno,

15 alquilo C_1-C_6 o alcoxi C_1-C_6 , y

G es hidrógeno o un metal agrícolamente aceptable, sulfonio, amonio o grupo protector.

En las definiciones de sustituyente de los compuestos de la
20 fórmula I, cada grupo funcional alquilo solo o como parte de un grupo más grande (tal como alcoxi, alquiltio, alcoxycarbonilo, alquylcarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo) es una cadena recta o ramificada y es, por ejemplo, metilo, etilo, *n*-propilo, *n*-butilo, *n*-pentilo, *n*-hexilo, isopropilo, *n*-butilo,
25 *sec*-butilo, *isob*utilo, *terc*-butilo o neopentilo. Los grupos alquilo son de forma adecuada grupos alquilo C_1-C_6 , pero son preferiblemente grupos alquilo C_1-C_4 o alquilo C_1-C_3 , y, más preferiblemente, grupos alquilo C_1-C_2 .

Los grupos funcionales alqueniilo y alquinilo pueden estar en la forma de cadenas rectas o ramificadas, y los grupos funcionales alqueniilo, cuando sea apropiado, pueden ser de la configuración (E)- o (Z)-. Ejemplos son vinilo, alilo y propargilo. Los grupos funcionales alqueniilo y alquinilo pueden contener uno o más enlaces dobles y/o triples en cualquier combinación. Se entiende, que se incluyen alenilo y alquilinilalqueniilo en estos términos.

10 Halógeno es flúor, cloro, bromo o yodo.

Los grupos haloalquilo son grupos alquilo que se sustituyen con uno o más de los mismos o diferentes átomos de halógeno y son, por ejemplo, CF_3 , CF_2Cl , CF_2H , CCl_2H , FCH_2 , ClCH_2 , BrCH_2 , CH_3CHF , $(\text{CH}_3)_2\text{CF}$, CF_3CH_2 o CHF_2CH_2 .

En el contexto de la presente especificación el término "arilo" se refiere a sistemas de anillo que pueden ser mono-, o bicíclicos. Ejemplos de tales anillos incluyen fenilo y naftilo.

20 Un grupo arilo preferido es fenilo.

El término "heteroarilo" preferiblemente se refiere a un sistema de anillo aromático que contiene por lo menos un heteroátomo y que consiste de un único anillo o de dos anillos fusionados.

25 Preferiblemente, los anillos únicos contendrán hasta tres y los sistemas bicíclicos hasta cuatro heteroátomos que se seleccionarán preferiblemente de nitrógeno, oxígeno y azufre. Ejemplos de tales grupos incluyen furilo, tienilo, pirrolilo,

14

pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo,
oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,4-
oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-
tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-
5 tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo,
1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo,
benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo,
indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo,
bencisotiazolilo, benzoxazolilo, bencisoxazolilo,
10 bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo,
isoquinolinilo, cinnolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo,
quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo,
pteridinilo y indolizininilo.

15 El término "heterociclilo" preferiblemente se refiere a sistemas
de anillo no aromáticos preferiblemente monocíclicos o bicíclicos
que contienen hasta 7 átomos que incluye uno o más
(preferiblemente uno o dos) heteroátomos seleccionados de O, S y
N. Ejemplos de tales anillos incluyen tetrahidropiran, 1,3-
20 dioxolano, oxetano, tetrahidrofurano, morfolina, tiomorfolina y
piperazina.

El cicloalquilo incluye preferiblemente ciclopropilo,
ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. El cicloalquilalquilo es
25 preferiblemente ciclopropilmetilo. El cicloalquenilo incluye
preferiblemente ciclopentenilo y ciclohexenilo.

Los anillos carbocíclicos incluyen grupos arilo, cicloalquilo o carbocíclicos, y grupos cicloalquenilo.

Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en arilo, heteroarilo y carbociclos se seleccionan preferiblemente independientemente, de halógeno, nitro, ciano, rodano, isotiocianato, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆alquilo (C₁-C₆), alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇ (en sí mismo sustituido opcionalmente con alquilo C₁-C₆ o halógeno), cicloalquenilo C₅-7 (en sí mismo sustituido opcionalmente con alquilo C₁-C₆ o halógeno), hidroxil, alcoxi C₁-C₁₀, alcoxi C₁-C₁₀alcoxi (C₁-C₁₀), trialquilsilil (C₁-C₄)alcoxi (C₁-C₆), alcóxicarbonilo C₁-C₆ alcoxi (C₁-C₁₀), haloalcoxi C₁-C₁₀, arilalcoxi (C₁-C₄) (en donde el grupo arilo se sustituye opcionalmente con halógeno o alquilo C₁-C₆), cicloalquiloxi C₃-C₇ (en donde el grupo cicloalquilo se sustituye opcionalmente con alquilo C₁-C₆ o halógeno), alqueniloxi C₃-C₁₀, alquiniloxi C₃-C₁₀, mercapto, alquiltio C₁-C₁₀, haloalquiltio C₁-C₁₀, arilalquiltio (C₁-C₄), cicloalquiltio C₃-C₇ (en donde el grupo cicloalquilo se sustituye opcionalmente con alquilo C₁-C₆ o halógeno), trialquilsilil (C₁-C₄) alquiltio (C₁-C₆), ariltio, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, arilsulfonilo, trialquilsililo (C₁-C₄), arildialquilsililo (C₁-C₄), alquildiarilsililo C₁-C₄, triarilsililo, alquilcarbonilo C₁-C₁₀, HO₂C, alcóxicarbonilo C₁-C₁₀, aminocarbonilo, alquiloaminocarbonilo C₁-C₆, di(alquilo C₁-C₆)-aminocarbonilo, N-(alquilo C₁-C₃)-N-(alcoxi C₁-C₃)aminocarbonilo, alquilcarboniloxi C₁-C₆, arilcarboniloxi,

dialquilaminocarboniloxi(C₁-C₆), arilo (en sí mismo sustituido
opcionalmente con alquilo C₁-C₆ o halógeno), heteroarilo (en sí
mismo sustituido opcionalmente con alquilo C₁-C₆ o halógeno),
heterociclilo (en sí mismo sustituido opcionalmente con alquilo
5 C₁-C₆ o halógeno), ariloxi (en donde el grupo arilo se sustituye
opcionalmente con alquilo C₁-C₆ o halógeno), heteroariloxi en
donde el grupo heteroarilo se sustituye opcionalmente con alquilo
C₁-C₆ o halógeno), heterocicliloxi (en donde el grupo
heterociclilo se sustituye opcionalmente con alquilo C₁-C₆ o
10 halógeno), amino, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino (C₁-C₆),
alquilcarbonilamino C₁-C₆, N-alquilcarbonilo (C₁-C₆)-N-alquilamino
(C₁-C₆), arilcarbonilo, (en donde el grupo arilo se sustituye en
sí mismo opcionalmente con halógeno o alquilo C₁-C₆) o dos
posiciones adyacentes en un sistema arilo o heteroarilo se pueden
15 ciclizar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5,
6 o 7 miembros, en sí mismo sustituido opcionalmente con halógeno
o alquilo C₁-C₆. Los sustituyentes adicionales para arilo o
heteroarilo incluyen arilcarbonilamino (en donde el grupo arilo
se sustituye por alquilo C₁-C₆ o halógeno), alcoxi (C₁-
20 C₆)carbonilamino, alcoxi (C₁-C₆)carbonil-N-alquilamino (C₁-C₆),
ariloxicarbonilamino (en donde el grupo arilo se sustituye por
alquilo C₁-C₆ o halógeno), ariloxicarbonil-N-alquilamino (C₁-C₆),
(en donde el grupo arilo se sustituye por alquilo C₁-C₆ o
halógeno), arilsulfonilamino (en donde el grupo arilo se
25 sustituye por alquilo C₁-C₆ o halógeno), arilsulfonil-N-
alquilamino (C₁-C₆) (en donde el grupo arilo se sustituye por
alquilo C₁-C₆ o halógeno), aril-N-alquilamino (C₁-C₆) (en donde el
grupo arilo se sustituye por alquilo C₁-C₆ o halógeno), arilamino

(en donde el grupo arilo se sustituye por alquilo C₁-C₆ o halógeno), heteroarilo amino (en donde el grupo heteroarilo se sustituye por alquilo C₁-C₆ o halógeno), heterocicliloamino (en donde el grupo heterociclilo se sustituye por alquilo C₁-C₆ o halógeno), aminocarbonilamino, alquilaminocarbonilamino C₁-C₆, dialquilaminocarbonilamino (C₁-C₆), arilaminocarbonilamino en donde el grupo arilo se sustituye por alquilo C₁-C₆ o halógeno), aril-N- alquilaminocarbonilamino (C₁-C₆) en donde el grupo arilo se sustituye por alquilo C₁-C₆ o halógeno), alquilaminocarbonilo C₁-C₆-N-alquilamino (C₁-C₆), dialquilaminocarbonilo (C₁-C₆)-N-alquilamino (C₁-C₆), arilaminocarbonil-N-alquilamino (C₁-C₆) en donde el grupo arilo se sustituye por alquilo C₁-C₆ o halógeno) y aril-N-alquilaminocarbonilo (C₁-C₆)-N-alquilamino (C₁-C₆) en donde el grupo arilo se sustituye por alquilo C₁-C₆ o halógeno).

15

La invención también se relaciona con las sales agrícolamente aceptables cuyos compuestos de la Fórmula I son capaces de formarse con metal de transición, metal alcali y bases de metal alcalinotérreo, aminas, bases de amonio cuaternario o bases de sulfonio terciario.

20

Entre los formadores de sal de metal de transición, metal alcali y metal alcalinotérreo, se debe hacer especial mención de los hidróxidos de cobre, hierro litio, sodio, potasio, magnesio y calcio, y preferiblemente los hidróxidos, bicarbonatos y carbonatos de sodio y potasio.

25

Ejemplos de aminas adecuadas para la formación de sal de amonio incluyen amoniaco así como también alquilaminas C₁-C₁₈ primarias, secundarias y terciarias, hidroxialquilaminas C₁-C₄ y alcóxialquil-aminas C₂-C₄, por ejemplo metilamina, etilamina, n-propilamina, isopropilamina, los cuatro isómeros de butilamina, n-amilamina, isoamilamina, hexilamina, heptilamina, octil-amina, nonilamina, decilamina, pentadecilamina, hexadecilamina, heptadecilamina, octadecilamina, metiletilamina, metilisopropilamina, metilhexilamina, metil-nonilamina, metilpentadecilamina, metiloctadecilamina, etilbutilamina, etilheptil-amina, etiloctilamina, hexilheptilamina, hexiloctilamina, dimetilamina, dietilamina, di-n-propilamina, di-isopropilamina, di-n-butilamina, di-n-amilamina, di-isoamilamina, dihexil-amina, diheptilamina, dioctilamina, etanolamina, n-propanolamina, isopropanolamina, N,N-dietanolamina, N-etilpropanolamina, N-butiletanolamina, alilamina, n-but-2-enil-amina, n-pent-2-enilamina, 2,3-dimetilbut-2-enilamina, dibut-2-enilamina, n-hex-2-enil-amina, propilenodiamina, trimetilamina, trietilamina, tri-n-propilamina, tri-isopropilamina, tri-n-butilamina, tri-isobutilamina, tri-sec-butilamina, tri-n-amilamina, metoxietilamina y etoxietilamina; aminas heterocíclicas, por ejemplo piridina, quinolina, isoquinolina, morfolina, piperidina, pirrolidina, indolina, quinuclidina y azepina; arilaminas primarias, por ejemplo anilinas, metoxianilinas, etoxianilinas, o-, m- y p-toluidinas, fenileno-diaminas, bencidinas, naftilaminas y o-, m- y p-cloroanilinas; pero especialmente trietil-amina, isopropilamina y di-isopropilamina.

Las bases de amonio cuaternarias preferidas adecuadas para la formación de sal corresponden, por ejemplo, a la fórmula $[N(R_a R_b R_c R_d)]OH$, en donde R_a , R_b , R_c y R_d son cada uno
5 independientemente de los otros hidrógeno, alquilo C_1-C_4 . Se pueden obtener bases tetraalquilamonio adecuadas adicionales con otros aniones, por ejemplo, mediante reacciones de intercambio de anión.

10 Las bases de sulfonio terciarias preferidas adecuadas para la formación de sal corresponden, por ejemplo, a la fórmula $[SR_e R_f R_g]OH$, en donde R_e , R_f y R_g son cada uno independientemente de los otros alquilo C_1-C_4 . Se prefiere especialmente hidróxido de trimetilsulfonio. Se pueden obtener bases de sulfonio
15 adecuadas a partir de la reacción de los tioéteres, en particular dialquilsulfuros, con alquilhaluros, seguido por conversión en una base adecuada, por ejemplo un hidróxido, mediante reacciones de intercambio de anión.

20 Cabe entender que en aquellos compuestos de la Fórmula I, en donde G es un metal, amonio o sulfonio como se mencionó anteriormente y como tal representa un catión, la carga negativa correspondiente se deslocaliza en gran parte a través de la unidad $O-C=C-C=O$.

25

Los compuestos de la Fórmula I de acuerdo con la invención también incluyen hidratos que se pueden formar durante la formación de sal.

20

Los grupos G protectores se seleccionan para permitir su remoción mediante uno o una combinación de procesos físicos, químicos o bioquímicos para proporcionar compuestos de la fórmula I en donde
5 G es H antes, durante o luego de la aplicación al área tratada o a las plantas. Ejemplos de estos procesos incluyen división enzimática, hidrólisis química y fotólisis. Los compuestos que llevan tales grupos G pueden ofrecer ciertas ventajas, tal como la penetración mejorada de la cutícula de las plantas tratadas,
10 tolerancia incrementada de los cultivos, compatibilidad o estabilidad mejorada en las mezclas formuladas que contienen otros herbicidas, protectores herbicidas, reguladores de crecimiento de plantas, fungicidas o insecticidas, o la lixiviación reducida en los suelos.

15 El grupo protector G se selecciona preferiblemente de los grupos alquilo C₁-C₈, haloalquilo C₂-C₈, fenilalquilo C₁-C₈ (en donde el fenilo se puede sustituir opcionalmente por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃,
20 alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano o por nitro), heteroarilalquilo C₁-C₈ (en donde el heteroarilo se puede sustituir opcionalmente por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano o
25 por nitro), alquenilo C₃-C₈, haloalquenilo C₃-C₈, alquinilo C₃-C₈, C(X^a)-R^a, C(X^b)-X^c-R^b, C(X^d)-N(R^c)-R^d, -SO₂-R^e, -P(X^e)(R^f)-R^g o CH₂-X^f-R^h en donde X^a, X^b, X^c, X^d, X^e y X^f son independientemente uno del otro oxígeno o azufre;

21

R^a es H, alquilo C₁-C₁₈, alquenilo C₂-C₁₈, alquinilo C₂-C₁₈, haloalquilo C₁-C₁₀, cianoalquilo C₁-C₁₀, nitroalquilo C₁-C₁₀, aminoalquilo C₁-C₁₀, alquilamino C₁-C₅alquilo (C₁-C₅),
5 dialquilamino C₂-C₈alquilo (C₁-C₅), cicloalquilo C₃-C₇alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alqueniloxi C₃-C₅alquilo (C₁-C₅), C₃-oxialquilo (C₁-C₅), alquiltio C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alquilsulfinilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alquilsulfonilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alquilidenoaminoxi C₂-C₈alquilo (C₁-C₅), alquilcarbonilo
10 C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alcoxicarbonilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), aminocarbonilalquilo (C₁-C₅), alquilaminocarbonilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), dialquilaminocarbonilo C₂-C₈alquilo (C₁-C₅), alquilcarbonilamino C₁-C₅ alquilo (C₁-C₅), N-alquilcarbonilo (C₁-C₅)-N-alquilamino (C₁-C₅) alquilo (C₁-C₅), trialquilsililo C₃-
15 C₆alquilo (C₁-C₅), fenilalquilo (C₁-C₅) (en donde el fenilo se puede sustituir opcionalmente por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano, o por nitro), heteroarilalquilo (C₁-C₅), (en donde el heteroarilo
20 se puede sustituir opcionalmente por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano, o por nitro), haloalquenilo C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₈, fenilo o fenilo sustituido por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-
25 C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, heteroarilo o heteroarilo sustituido por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro,

R^b es alquilo C₁-C₁₈, alquenilo C₃-C₁₈, alquinilo C₃-C₁₈, haloalquilo C₂-C₁₀, cianoalquilo C₁-C₁₀, nitroalquilo C₁-C₁₀, aminoalquilo C₂-C₁₀, alquilamino C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), dialquilamino C₂-C₈alquilo (C₁-C₅), cicloalquilo C₃-C₇alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alqueniloxi C₃-C₅alquilo (C₁-C₅), alquiniloxi C₃-C₅alquilo (C₁-C₅), alquiltio C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alquilsulfinilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alquilsulfonilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alquilidenoaminoxi C₂-C₈alquilo (C₁-C₅), alquilcarbonilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alcoxycarbonilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), aminocarbonilalquilo (C₁-C₅), alquilaminocarbonilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), dialquilaminocarbonilo C₂-C₈alquilo (C₁-C₅), alquilcarbonilamino C₁-C₅ alquilo (C₁-C₅), N-alquilcarbonilo (C₁-C₅)-N-alquilamino (C₁-C₅)alquilo (C₁-C₅), trialquilsililo C₃-C₆alquilo (C₁-C₅), fenilalquilo (C₁-C₅) (en donde el fenilo se puede sustituir opcionalmente por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano, o por nitro), heteroarilalquilo C₁-C₅o, (en donde el heteroarilo se puede sustituir opcionalmente por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano, o por nitro), haloalquenilo C₃-C₅, cicloalquilo C₃-C₈o, fenilo o fenilo sustituido por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, heteroarilo o heteroarilo sustituido por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro,

R^c y R^d son cada uno independientemente uno del otro hidrógeno, alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₃-C₁₀, alquinilo C₃-C₁₀, haloalquilo C₂-C₁₀, cianoalquilo C₁-C₁₀, nitroalquilo C₁-C₁₀, aminoalquilo C₁-C₁₀, alquilamino C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), dialquilamino C₂-C₈alquilo (C₁-C₅),
5 C₅), cicloalquilo C₃-C₇alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alqueniloxi C₃-C₅alquilo (C₁-C₅), alquiniloxi C₃-C₅alquilo (C₁-C₅), alquiltio C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alquilsulfinilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alquilsulfonilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alquilidenoaminoxi C₂-C₈alquilo (C₁-C₅), alquilcarbonilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅),
10 alcoxicarbonilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), aminocarbonilalquilo (C₁-C₅), alquilaminocarbonilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), dialquilaminocarbonilo C₂-C₈alquilo (C₁-C₅), alquilcarbonilamino C₁-C₅ alquilo (C₁-C₅), N-alquilcarbonilo (C₁-C₅)-N-alquilaminoalquilo (C₂-C₅,
trialquilsililo C₃-C₆alquilo (C₁-C₅), fenilalquilo (C₁-C₅) (en
15 donde el fenilo se puede sustituir opcionalmente por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano, o por nitro), heteroarilalquilo (C₁-C₅), (en donde el heteroarilo se puede sustituir opcionalmente por alquilo C₁-C₃,
20 haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano, o por nitro), haloalquenilo C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₈, fenilo o fenilo sustituido por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, heteroarilo o
25 heteroarilo sustituido por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, heteroarilamino o heteroarilamino sustituido por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano

24

o nitro, diheteroarilamino o diheteroarilamino sustituido por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, fenilamino o fenilamino sustituido por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃,
5 halógeno, ciano o por nitro, difenilamino o difenilamino sustituido por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o por nitro o cicloalquilamino C₃-C₇, di-cicloalquilamino C₃-C₇ o cicloalcoxi C₃-C₇ o R^c y R^d se pueden unir para formar un anillo de 3-7 miembros, que contiene
10 opcionalmente un heteroátomo seleccionado de O u S,

R^e es alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, haloalquilo C₁-C₁₀, cianoalquilo C₁-C₁₀, nitroalquilo C₁-C₁₀, aminoalquilo C₁-C₁₀, alquilamino C₁-C₅alquilo (C₁-C₅),
15 dialquilamino C₂-C₈alquilo (C₁-C₅), cicloalquilo C₃-C₇alquilo (C₁-C₅), alcoxi C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alqueniloxi C₃-C₅alquilo (C₁-C₅), alquiniloxi C₃-C₅alquilo (C₁-C₅), alquiltio C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alquilsulfinilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alquilsulfonilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alquilidenoaminoxi C₂-C₈alquilo (C₁-C₅), alquilcarbonilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅),
20 alcoxycarbonilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), aminocarbonilalquilo (C₁-C₅), alquilaminocarbonilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), dialquilaminocarbonilo C₂-C₈alquilo (C₁-C₅), alquilcarbonilamino C₁-C₅ alquilo (C₁-C₅), N-alquilcarbonilo (C₁-C₅)-N-alquilamino (C₁-C₅) alquilo (C₁-C₅), trialquilsililo C₃-C₆alquilo (C₁-C₅), fenilalquilo (C₁-C₅) (en donde el fenilo se puede sustituir opcionalmente por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano, o

por nitro), heteroarilalquilo (C_1-C_5) (en donde el heteroarilo se puede sustituir opcionalmente por alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , alquiltio C_1-C_3 , alquilsulfinilo C_1-C_3 , alquilsulfonilo C_1-C_3 , halógeno, ciano, o
5 por nitro), haloalquenilo C_2-C_5 , cicloalquilo C_3-C_8 , fenilo o fenilo sustituido por alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , halógeno, ciano o nitro, heteroarilo o heteroarilo sustituido por alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , halógeno, ciano o por nitro,
10 heteroarilamino o heteroarilamino sustituido por alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , halógeno, ciano o por nitro, diheteroarilamino o diheteroarilamino sustituido por alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , halógeno, ciano o nitro, fenilamino o fenilamino sustituido por
15 alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , halógeno, ciano o nitro, difenilamino, o difenilamino sustituido por alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , halógeno, ciano o nitro, o cicloalquilamino C_3-C_7 , dicicloalquilamino C_3-C_7 o cicloalcoxi C_3-C_7 , alcoxi C_1-C_{10} ,
20 haloalcoxi C_1-C_{10} , alquilamino C_1-C_5 o dialquilamino C_2-C_8 ,

R^f y R^g son cada uno independientemente uno del otro alquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , alcoxi C_1-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} , cianoalquilo C_1-C_{10} , nitroalquilo C_1-C_{10} ,
25 aminoalquilo C_1-C_{10} , alquilamino C_1-C_5 alquilo (C_1-C_5), dialquilamino C_2-C_8 alquilo (C_1-C_5), cicloalquilo C_3-C_7 alquilo (C_1-C_5), alcoxi C_1-C_5 alquilo (C_1-C_5), alqueniloxi C_3-C_5 alquilo (C_1-C_5), alquiniloxi C_3-C_5 alquilo (C_1-C_5), alquiltio C_1-C_5 alquilo (C_1-C_5),

alquilsulfinilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alquilsulfonilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alquilidenoaminoxí C₂-C₈alquilo (C₁-C₅), alquilcarbonilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alcoxicarbonilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), aminocarbonilalquilo (C₁-C₅), alquilaminocarbonilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), dialquilaminocarbonilo C₂-C₈alquilo (C₁-C₅), alquilcarbonilamino C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), N-alquilcarbonilo (C₁-C₅)-N-alquilaminoalquilo (C₂-C₅), trialquilsililo C₃-C₆alquilo (C₁-C₅), fenilalquilo (C₁-C₅) (en donde el fenilo se puede sustituir opcionalmente por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano, o por nitro), heteroarilalquilo (C₁-C₅) (en donde el heteroarilo se puede sustituir opcionalmente por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano, o por nitro), haloalquenilo C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₈, fenilo o fenilo sustituido por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, heteroarilo o heteroarilo sustituido por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o por nitro, heteroarilamino o heteroarilamino sustituido por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o por nitro, diheteroarilamino o diheteroarilamino sustituido por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, fenilamino o fenilamino sustituido por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, halógeno, ciano o nitro, difenilamino, o difenilamino sustituido por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-

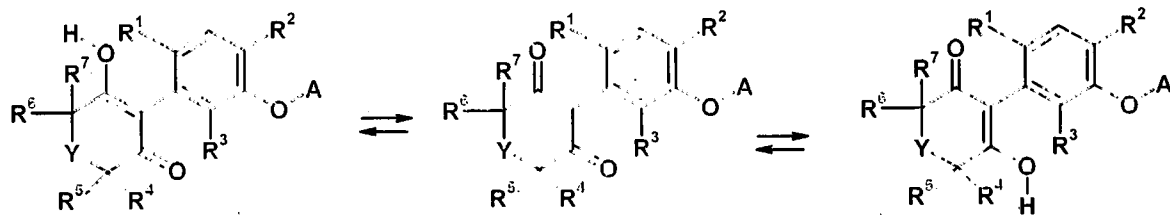
C₃, halógeno, ciano o nitro, o cicloalquilamino C₃-C₇,
dicicloalquilamino C₃-C₇ o cicloalcoxi C₃-C₇, haloalcoxi C₁-C₁₀,
alquilamino C₁-C₅ o dialquilamino C₂-C₈, benciloxi o fenoxi, en
donde los grupos fenilo y bencilo pueden a su vez ser sustituidos
5 por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-
C₃, halógeno, ciano o nitro, y

Rⁿ es alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₃-C₁₀, alquinilo C₃-C₁₀,
haloalquilo C₁-C₁₀, cianoalquilo C₁-C₁₀, nitroalquilo C₁-C₁₀,
10 aminoalquilo C₂-C₁₀, alquilamino C₁-C₅alquilo (C₁-C₅),
dialquilamino C₂-C₈alquilo (C₁-C₅), cicloalquilo C₃-C₇alquilo (C₁-
C₅), alcoxi C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alqueniloxi C₃-C₅alquilo (C₁-C₅),
alquiniloxi C₃-C₅alquilo (C₁-C₅), alquiltio C₁-C₅alquilo (C₁-C₅),
alquilsulfinilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alquilsulfonilo C₁-C₅alquilo
15 (C₁-C₅), alquilidenoaminoxi C₂-C₈alquilo (C₁-C₅), alquilcarbonilo
C₁-C₅alquilo (C₁-C₅), alcoxycarbonilo C₁-C₅alquilo (C₁-C₅),
aminocarbonilalquilo (C₁-C₅), alquilaminocarbonilo C₁-C₅alquilo
(C₁-C₅), dialquilaminocarbonilo C₂-C₈alquilo (C₁-C₅),
alquilcarbonilamino C₁-C₅ alquilo (C₁-C₅), N-alquilcarbonilo (C₁-
20 C₅)-N-alquilamino (C₁-C₅) alquilo (C₁-C₅), trialquilsililo C₃-
C₆alquilo (C₁-C₅), fenilalquilo (C₁-C₅) (en donde el fenilo se
puede sustituir opcionalmente por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-
C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃,
alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano o
25 por nitro), heteroarilalquilo (C₁-C₅) (en donde el heteroarilo se
puede sustituir opcionalmente por alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-
C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃,
alquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, halógeno, ciano o

- por nitro), fenoxialquilo (C_1-C_5) (en donde el fenilo se puede sustituir opcionalmente por alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , alquiltio C_1-C_3 , alquilsulfinilo C_1-C_3 , alquilsulfonilo C_1-C_3 , halógeno, ciano o por nitro),
- 5 heteroariloxialquilo (C_1-C_5) (en donde el heteroarilo se puede sustituir opcionalmente por alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , alquiltio C_1-C_3 , alquilsulfinilo C_1-C_3 , alquilsulfonilo C_1-C_3 , halógeno, ciano o por nitro),
- 10 haloalquenilo C_3-C_5 , cicloalquilo C_3-C_8 , fenilo o fenilo sustituido por alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , halógeno o mediante nitro, o heteroarilo, o heteroarilo sustituido por alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , halógeno, ciano o por nitro.
- 15 En particular, el grupo protector G es un grupo $-C(X^a)-R^a$ o $-C(X^b)-X^c-R^b$, y los significados de X^a , R^a , X^b , X^c y R^b son como se definieron anteriormente.

Se prefiere que G sea hidrógeno, un metal alcali o metal
20 alcalinotérreo, en donde se prefiere especialmente hidrógeno.

Dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes, los compuestos de la Fórmula I pueden existir en diferentes formas isoméricas. Por ejemplo, cuando G es hidrógeno y R^4 y R^5 son diferentes de R^6 y R^7 , los compuestos de la Fórmula I pueden existir en diferentes
25 formas tautoméricas:



Esta invención cubre todos tales isómeros y tautómeros y mezclas de los mismos en todas las proporciones. También, cuando los sustituyentes contienen enlaces dobles, pueden existir los isómeros *cis-* y *trans*. Estos isómeros, también, están dentro del alcance de los compuestos reivindicados de la fórmula I.

Preferiblemente, en los compuestos de la Fórmula I, A es fenilo, naftilo, un heteroarilo de 5 o 6 miembros o un heteroarilo de 8 a 10 miembros bicíclico,

Preferiblemente, en los compuestos de la Fórmula I, A se sustituye por halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, nitro, ciano, cicloalquilo C₃-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₃, alcóxicarbonilo C₁-C₄, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo C₁-C₃, di-alquilaminocarbonilo C₁-C₃, alquilaminocarboniloxi C₁-C₃, di-alquilaminocarboniloxi C₁-C₃, aminotiocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo C₁-C₃, dialquilaminotiocarbonilo C₁-C₃, alquilcarbonilamino C₁-C₄, cicloalquilcarbonilamino C₃-C₆, alcóxicarbonilamino C₁-C₄, alquiltiocarbonilamino C₁-C₄, alcoxi C₁-C₃alquilo C₁-C₃, alquilo C₁-C₆tioalquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₆sulfinilalquilo C₁-C₆,

alquilsulfonil C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 , alquilsulfoniloxi C_1-C_3 ,
haloalquilsulfoniloxi C_1-C_3 o dialquilaminosulfonilo C_1-C_6 , o 2
sustituyentes sobre los átomos de carbono adyacentes de A juntos
forman un alquilenio C_3-C_4 , en donde 1 o 2 grupos metileno se
5 sustituyen opcionalmente por halógeno, o en donde 1 o 2 de estos
grupos metileno se reemplazan por oxígeno.

Más preferiblemente, A es fenilo, naftilo, piridilo, pirazinilo,
pirimidinilo, piridazinilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo,
10 cinnolinilo, quinolinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo o
benzotriazinilo en cada caso sustituido por halógeno, metilo,
etilo, trifluoro-metilo, metoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi,
nitro o ciano.

15 Preferiblemente, R^1 es metilo, etilo, *n*-propilo, ciclopropilo,
halógeno o haloalcoxi C_1-C_2 .

Preferiblemente, R^2 y R^3 son independientemente uno del otro
hidrógeno, metilo o halógeno, especialmente hidrógeno.

20

Preferiblemente, R^4 , R^5 , R^6 y R^7 son independientemente uno del
otro hidrógeno o alquilo C_1-C_6 , o R^4 y R^5 , o R^6 y R^7 , juntos con
los átomos a los cuales ellos se unen forman un espiro-
tetrahidropiranilo o espiro-tetrahidrofuranilo, o R^5 y R^6 juntos
25 con los átomos a los cuales ellos se unen forman un carbocíclico
de 6 a 7 miembros.

Preferiblemente, Y es O o CR^8R^9 , donde R^8 y R^9 son como se definió anteriormente.

Preferiblemente, R^8 y R^9 son independientemente uno del otro
5 hidrógeno o metilo, o R^8 y R^9 juntos con los átomos a los cuales ellos se unen forman un espiro-tetrahidropiranilo o un espiro-tetrahidrofuranoilo.

Preferiblemente, G es hidrógeno, un grupo $-C(X^a)-R^a$ o $-C(X^b)-X^c-$
10 R^b , donde los significados de X^a , R^a , X^b , X^c y R^b son como se definió anteriormente, y particularmente hidrógeno.

En un grupo particularmente preferido de los compuestos de la fórmula I A es fenilo, naftilo, piridilo, pirazinilo,
15 pirimidinilo, piridazinilo, benzotiazólilo, benzoxazolilo, cinnolinilo, quinolinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo o benzotriazinilo, en cada caso sustituido por halógeno, metilo, trifluoro-metilo, nitro o ciano, R^1 es etilo, R^2 y R^3 son
hidrógeno, R^4 a R^7 son hidrógeno o metilo o R^5 y R^6 , junto con los
20 átomos a los cuales ellos se unen, forman un carbociclilo de 6 o 7 miembros,

Y es O o CR^8R^9 , en donde R^8 y R^9 son independientemente uno del otro hidrógeno o metilo, o R^8 y R^9 juntos con los átomos a los
cuales ellos se unen forman un espiro-tetrahidropiranilo o un
25 espiro-tetrahidrofuranoilo, y G es hidrógeno.

En otro grupo particularmente preferido de los compuestos de la fórmula (I), R^1 es metilo, etilo o ciclopropilo, R^2 y R^3 son

hidrógeno, R^4 , R^5 , R^6 y R^7 son independientemente uno del otro hidrógeno o metilo, o R^4 y R^5 , o R^6 y R^7 , juntos con los átomos a los cuales ellos se unen forman un espiro-tetrahidropiraniilo o espiro-tetrahidrofuranoilo, o R^5 y R^6 juntos con los átomos a los
5 cuales ellos se unen forman un carbociclilo de 6 o 7 miembros, Y es O o CR^8R^9 , donde R^8 y R^9 son independientemente uno del otro hidrógeno o metilo, o R^8 y R^9 juntos con los átomos a los cuales ellos se unen forman un espiro-tetrahidropiraniilo o un espiro-tetrahidrofuranoilo, G es hidrógeno y A es fenilo, naftilo,
10 piridilo, pirazinilo, pirimidinilo, piridazinilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, quinolinilo o quinoxalinilo, en cada caso no sustituido o sustituido por hidroxilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, trifluoro-metilo, amino, formilo, nitro o ciano.

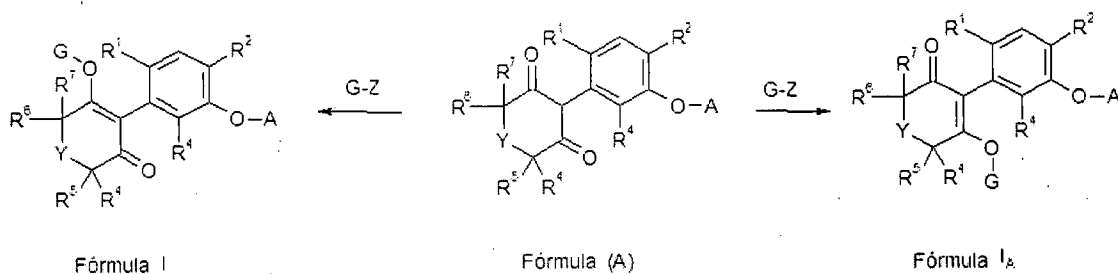
15

Un compuesto de la Fórmula I en donde Q es Q_1 y G es alquilo C_1-C_8 , haloalquilo C_2-C_8 , fenilalquilo C_1-C_8 (en donde el fenilo se puede sustituir opcionalmente por alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alcoxí C_1-C_3 , haloalcoxí C_1-C_3 , alquiltio C_1-C_3 , alquilsufinilo C_1-C_3 , alquilsulfonilo C_1-C_3 , halógeno, ciano o por nitro),
20 heteroarilalquilo C_1-C_8 (en donde el heteroarilo se puede sustituir opcionalmente por alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alcoxí C_1-C_3 , haloalcoxí C_1-C_3 , alquiltio C_1-C_3 , alquilsufinilo C_1-C_3 , alquilsulfonilo C_1-C_3 , halógeno, ciano o por nitro), alquenilo
25 C_3-C_8 , haloalquenilo C_3-C_8 , alquinilo C_3-C_8 , $C(X^a)-R^a$, $C(X^b)-X^c-R^b$, $C(X^d)-N(R^c)-R^d$, $-SO_2-R^e$, $-P(X^e)(R^f)-R^g$ o $CH_2-X^f-R^h$ en donde X^a , X^b , X^c , X^d , X^e , X^f , R^a , R^b , R^c , R^d , R^e , R^f , R^g y R^h que son como se definió anteriormente se pueden preparar al tratar un compuesto

de la Fórmula (A), que es un compuesto de la Fórmula I en donde G es H, con un reactivo G-Z, en donde G-Z es un agente alquilatante tal como un haluro de alquilo (la definición de haluros de alquilo incluyen haluros de alquilo C₁-C₈ simple tal como yoduro de metilo y yoduro de etilo, haluros de alquilo sustituidos tal como éteres de alquilo clorometilo, Cl-CH₂-X^f-R^h, en donde X^f es oxígeno, y sulfuros alquilo clorometilo Cl-CH₂-X^f-R^h, en donde X^f es azufre), un sulfonato de alquilo C₁-C₈, o un sulfato de di(alquilo C₁-C₈), o con un haluro de alqueno C₃-C₈, o con un haluro de alquino C₃-C₈, o con un agente acilante tal como un ácido carboxílico, HO-C(X^a)R^a, en donde X^a es oxígeno, un cloruro ácido, Cl-C(X^a)R^a, en donde X^a es oxígeno, o anhídrido ácido, [R^aC(X^a)]₂, en donde X^a es oxígeno, o un isocianato, R^cN=C=O, o un cloruro de carbamoilo, Cl-C(X^d)-N(R^c)-R^d (en donde X^d es oxígeno y con la condición que ni R^c ni R^d sean hidrógeno), o un cloruro de tiocarbamoilo Cl-(X^d)-N(R^c)-R^d (en donde X^d es azufre y con la condición que ni R^c ni R^d sean hidrógeno) o un cloroformato, Cl-C(X^b)-X^c-R^b, (en donde X^b y X^c son oxígeno), o un clorotioformato Cl-C(X^b)-X^c-R^b (en donde X^b es oxígeno y X^c es azufre), o un cloroditioformato Cl-C(X^b)-X^c-R^b, (en donde X^b y X^c son azufre), o un isotiocianato, R^cN=C=S, o mediante tratamiento secuencial con disulfuro de carbono y un agente alquilatante, o con un agente fosforilante tal como un cloruro fosforilo, Cl-P(X^e)(R^f)-R^g o con un agente sulfonatante tal como un cloruro de sulfonilo Cl-SO₂-R^e, preferiblemente en la presencia de por lo menos un equivalente de base.

En donde los sustituyentes R^4 y R^5 no son iguales a los sustituyentes R^6 y R^7 , estas reacciones pueden producir, en adición de un compuesto de la Fórmula I, un segundo compuesto de la Fórmula I_A.

5



Esta invención cubre un compuesto de la Fórmula I y un compuesto de la Fórmula I_A, junto con mezclas de estos compuestos en cualquier relación.

10

Se conoce la O-alkilación de 1,3-dionas cíclicas; se describen métodos adecuados, por ejemplo, mediante T. Wheeler, US4436666. Se han reportado procedimientos alternativos por M. Pizzorno y S. Albonico, Chem. Ind. (Londres), (1972), 425-426; H. Born et al., J. Chem. Soc., (1953), 1779-1782; M. G. Constantino et al., Synth. Commun., (1992), 22 (19), 2859-2864; Y. Tian et al., Synth. Commun., (1997), 27 (9), 1577-1582; S. Chandra Roy et al., Chem. Letters, (2006), 35 (1), 16-17; P. K. Zubaidha et al., Tetrahedron Lett., (2004), 45, 7187-7188.

15

20

La O-acilación de 1,3-dionas cíclicas se puede efectuar mediante procedimientos similares a aquellos descritos, por ejemplo, por R. Haines, US4175135, y por T. Wheeler, US4422870, US4659372 y

US4436666. Típicamente las dionas de la Fórmula (A) se pueden tratar con un agente acilante preferiblemente en la presencia de por lo menos un equivalente de una base adecuada, y opcionalmente en la presencia de un disolvente adecuado. La base puede ser

5 inorgánica, tal como un carbonato o hidróxido de metal alcali, o un hidruro de metal, o una base orgánica tal como una amina terciaria o alcóxido de metal. Ejemplos de bases inorgánicas adecuadas incluyen carbonato de sodio, hidróxido de sodio o potasio, hidruro de sodio, y las bases orgánicas adecuadas

10 incluyen trialkilaminas, tal como trimetilamina y trietilamina, piridinas u otras bases amina tal como 1,4-diazobicyclo[2.2.2]-octano y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno. Las bases preferidas incluyen trietilamina y piridina. Los disolventes adecuados para esta reacción se seleccionan por ser compatibles con los

15 reactivos e incluyen éteres tal como tetrahydrofurano y 1,2-dimetoxietano y disolventes halogenados tal como diclorometano y cloroformo. Ciertas bases, tal como piridina y trietilamina, se pueden emplear exitosamente como base y disolvente. Para casos en donde el agente acilante es un ácido carboxílico, la acilación se

20 efectúa preferiblemente en la presencia de un agente de acoplamiento conocido tal como yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio, *N,N'*-dicyclohexilcarbodiimida, 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida y *N,N'*-carbodiimidazol, y opcionalmente en la presencia de una base tal como trietilamina o

25 piridina en un disolvente adecuado tal como tetrahydrofurano, diclorometano o acetonitrilo. Los procedimientos adecuados se describen, por ejemplo, por W. Zhang y G. Pugh, Tetrahedron Lett., (1999), 40 (43), 7595-7598; T. Isobe y T. Ishikawa, J.

Org. Chem., (1999), 64 (19), 6984-6988 y K. Nicolaou, T. Montagnon, G. Vassilikogiannakis, C. Matison, J. Am. Chem. Soc., (2005), 127(24), 8872-8888.

5 La fosforilación de las 1,3-dionas cíclicas se puede efectuar utilizando un haluro de fosforilo o haluro detiofosforilo y una base mediante procedimientos análogos con aquellos descritos por L. Hodakowski, US4409153.

10 La sulfonilación de un compuesto de la Fórmula (A) se puede lograr utilizando un haluro de sulfonil alquilo o arilo, preferiblemente en la presencia de por lo menos un equivalente de base, por ejemplo mediante el procedimiento de C. Kowalski y K. Fields, J. Org. Chem., (1981), 46, 197-201.

15

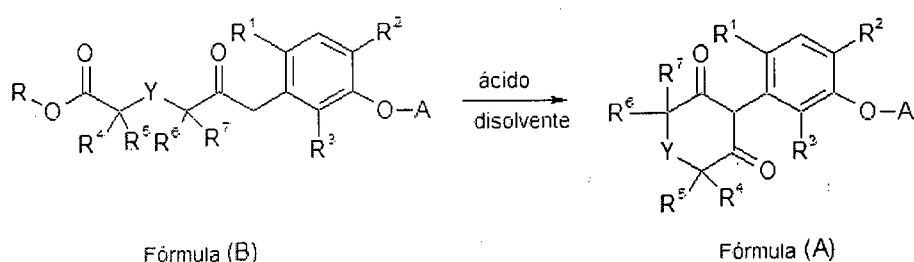
Se pueden preparar los compuestos de la fórmula (A), en donde Y es S(O)_n y n es 1 o 2 a partir de los compuestos de la fórmula (A) en donde Y es S mediante oxidación, de acuerdo con un procedimiento análogo a aquel de E. Fehnel y A. Paul, J. Am.

20 Chem. Soc., (1955), 77, 4241-4244.

Se puede preparar un compuesto de la fórmula (A), en donde Y es O, S, C=O o CR¹²R¹³ a través de la ciclización de un compuesto de la fórmula (B), preferiblemente en la presencia de un ácido o
25 base, y opcionalmente en la presencia de un disolvente adecuado, mediante métodos análogos a aquellos descritos por T. Wheeler, US4209532. Los compuestos de la fórmula (B) se han diseñado particularmente como intermedios en la síntesis de los compuestos

37

de la fórmula I. Los compuestos de la Fórmula (B) en donde R es hidrógeno o alquilo C₁-C₄, (especialmente metilo, etilo y terc-butilo) se pueden ciclar bajo condiciones ácidas, preferiblemente en la presencia de un ácido fuerte tal como ácido sulfúrico, ácido polifosfórico o reactivo Eaton, opcionalmente en la presencia de un disolvente adecuado tal como ácido acético, tolueno o diclorometano.



Un compuesto de la Fórmula (B) en donde R es alquilo (preferiblemente metilo o etilo) se puede ciclar bajo condiciones ácidas o básicas, preferiblemente bajo condiciones básicas en la presencia de por lo menos un equivalente de una base fuerte tal como terc-butóxido de potasio, diisopropilamida de litio, bis(trimetilsilil)amida de sodio o hidruro de sodio y en un disolvente tal como tetrahidrofurano, tolueno, dimetilsulfóxido o N,N-dimetilformamida.

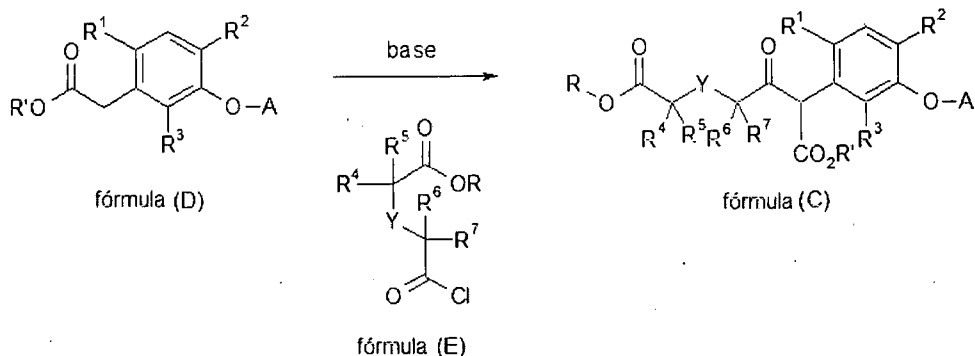
Un compuesto de la Fórmula (B), en donde R es H se puede esterificar a un compuesto de la Fórmula (B), en donde R es alquilo, bajo condiciones conocidas (por ejemplo mediante tratamiento con un alcohol, R-OH, en la presencia de un catalizador ácido).

38

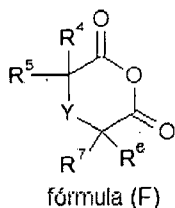
15



20



Alternativamente, se puede preparar un compuesto de la fórmula (C), en donde R es H, al tratar un compuesto de la fórmula (D) con una base adecuada (tal como terc-butóxido de sodio, bis(trimetilsilil)amida de sodio y diisopropilamida de litio) en un disolvente adecuado (tal como tetrahidrofurano o tolueno) a una temperatura adecuada (entre $-80^{\circ}C$ y $30^{\circ}C$) y al hacer reaccionar el anión resultante con un anhídrido adecuado de la fórmula (F):

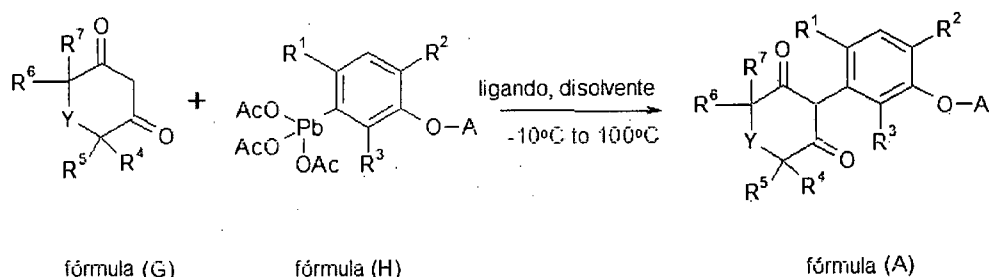


Se conocen los compuestos de la fórmula (E) y la fórmula (F), o se pueden hacer mediante métodos similares a partir de los materiales de partida disponibles comercialmente (véase, por ejemplo C. Rouvier, Tetrahedron Lett., (1984), 25 (39), 4371-4374; D. Walba y M. Wand, Tetrahedron Lett., (1982), 23 (48), 4995-4998; T. Terasawa y T. Okada, J. Org. Chem., (1977), 42 (7), 1163-1169 y G. Bennett, W. Houlihan, R. Mason, y R. Engstrom, J. Med. Chem., (1976), 19 (5), 709-714; J. Cason, Org. Synth. Coll. Vol. IV, (1963), 630-633).

Se conocen los compuestos de la fórmula (D) (véase, por ejemplo, H. Ishibashi et al., Chem. Pharm. Bull., (1991), 39 (11), 2878-2882; R. Kirsten et al., EP338306 A2; W. Marshall, US3649679) o
5 se pueden hacer mediante métodos similares a partir de los compuestos conocidos.

En un método adicional, se puede preparar un compuesto de la Fórmula (A) al hacer reaccionar un compuesto de la Fórmula (F)
10 con un tricarboxilato arilado, en la presencia de un ligando adecuado y en un disolvente adecuado. Se describen las reacciones similares en la literatura (por ejemplo ver, M. Muehlebach et al., WO08/071405; J. Pinhey, B. Rowe, Aust. J. Chem., (1979), 32, 1561-6; J. Morgan, J. Pinhey, J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 15 (1990), 3, 715-20). Preferiblemente el tricarboxilato arilado es un triacetato arilado de la Fórmula (H). Preferiblemente el ligando es un heterociclo que contiene nitrógeno tal como N,N-dimetilamino-piridina, 1,10-fenantrolina piridina, bipyridina, o imidazol, y uno a diez equivalentes de ligando con respecto a un
20 compuesto de la Fórmula (J) se utiliza preferiblemente. Más preferiblemente el ligando es N,N-dimetilaminopiridina. El disolvente es preferiblemente cloroformo, diclorometano o tolueno, más preferiblemente cloroformo, o una mezcla de cloroformo y tolueno. Preferiblemente la reacción se conduce a
25 una temperatura de -10°C a 100°C, más preferiblemente a 40-90°C).

41



Los compuestos de la fórmula (G), en donde Y es O, son compuestos conocidos o se pueden preparar mediante rutas análogas a aquellas descritas en la bibliografía (véase, por ejemplo M. Muehlebach et

5 al., WO08/071405; M. Morgan y E. Heyningen, J. Am. Chem Soc., (1957), 79, 422-424; I. Korobitsyna y K. Pivnitskii, Russian Journal of General Chemistry, (1960), 30, 4016-4023; T. Terasawa, y T. Okada, J. Org. Chem., (1977), 42 (7), 1163-1169; R. Anderson et al. US5089046; R. Altenbach, K. Agrios, I. Drizin y W.

10 Carroll, Synth. Commun., (2004), 34 (4) 557-565; R. Beaudegnies et al., WO2005/123667; W. Li, G. Wayne, J. Lallaman, S. Chang, y S. Wittenberger, J. Org. Chem. (2006), 71, 1725-1727; R. Altenbach, M. Brune, S. Buckner, M. Coghlan, A. Daza, A. Fabiyi, M. Gopalakrishnan, R. Henry, A. Khilevich, M. Kort, I. Milicic,

15 V. Scott, J. Smith, K. Whiteaker, y W. Carroll, J. Med. Chem, (2006), 49(23), 6869-6887; Carroll et al., WO 2001/083484 A1; J. K. Crandall, W. W. Conover, J. Org. Chem. (1978), 43(18), 3533-5; I. K. Korobitsyna, O. P. Studzinskii, Chemistry of Heterocyclic Compounds (1966), (6), 848-854). Los compuestos de la fórmula

20 (G), en donde Y es S, con compuestos conocidos o se pueden preparar mediante rutas análogas a aquellas descritas en la bibliografía (véase, por ejemplo, E. Fehnel y A. Paul, J. Am. Chem Soc., (1955), 77, 4241-4244; E. Er y P. Margaretha, Helvetica Chimica Acta (1992), 75(7), 2265-69; H. Gayer et al.,

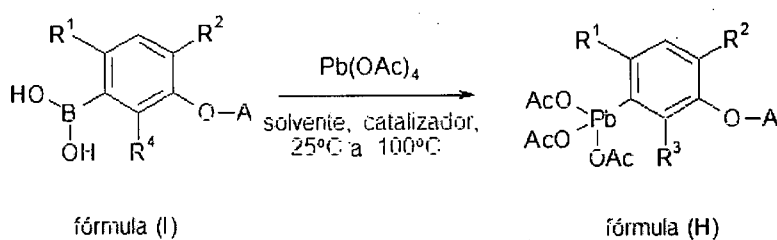
42

DE 3318648 A1). Los compuestos de la fórmula (G), en donde Y es C=O, son compuestos conocidos o se pueden preparar mediante rutas análogas a aquellas descritas en la bibliografía (véase, por ejemplo, R. Götz y N. Götz, WO2001/060776 R. Götz et al. WO 5 2000/075095; M. Benbakkar et al., Synth. Commun. (1989) 19(18) 3241-3247; A. Jain y T. Seshadri, Proc. Indian Acad. Sci. Sect. A, (1955), 42, 279); N. Ahmad et al., J. Org. Chem., (2007), 72(13), 4803-4815); F. Effenberger et al., Chem. Ber., (1986), 119, 3394-3404 y las referencias allí). Los compuestos de la 10 fórmula (G), en donde Y es CR¹²R¹³ son compuestos conocidos o se pueden preparar mediante rutas análogas a aquellas descritas en la bibliografía (véase por ejemplo, M. Muehlebach et al., WO08/110307; M. Muehlebach et al., WO08/110308; S. Spessard y B. Stoltz, Organic Letters, (2002), Vol. 4, No. 11, 1943-1946; F. 15 Effenberger et al., Chem. Ber., (1984), 117, 3280-3296; W. Childers et al., Tetrahedron Lett., (2006), 2217-2218; W. Childers et al., US2006/0004108; H. Schneider y C. Luethy, EP1352890; D. Jackson, A. Edmunds, M. Bowden y E. Brockbank, WO2005/105745 y WO2005/105717; R. Beaudegnies, C. Luethy, A. 20 Edmunds, J. Schaetzer y S. Wendeborn, WO2005/123667; J-C. Beloeil, J-il. Lallemand, T. Prange, Tetrahedron, (1986), Vol. 42. No. 13, 3491-3502; G. Stork y R. Danheiser, J. Org. Chem., (1973), 38 (9), 1775-1776; H. Favre et al., Can. J. Chem. (1956), 34 1329-39; R. Shriner y H. Todd, Org. Synth. Coll. Vol. II, 25 (1943), 200-202).

Se puede preparar un compuesto de la fórmula (H) a partir de un compuesto de la fórmula (I) mediante tratamiento con tetraacetato

u3

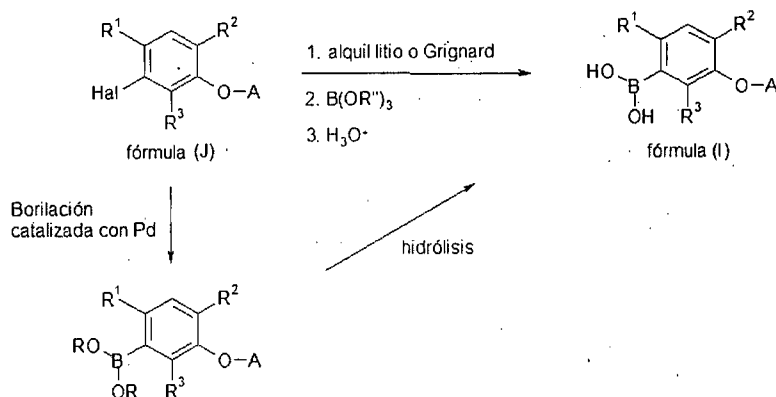
de plomo en un disolvente adecuado (por ejemplo cloroformo) a 25° C a 100° C (preferiblemente 25-50° C), y opcionalmente en la presencia de un catalizador tal como diacetato de mercurio, de acuerdo con los procedimientos descritos en la bibliografía (por ejemplo véase, K. Shimi, G. Boyer, J-P. Finet y J-P. Galy, Letters in Organic Chemistry, (2005), 2, 407-409; J. Morgan y J. Pinhey, J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1; (1990), 3, 715-720).



Se puede preparar un ácido aril borónico de la Fórmula (I) a partir de un haluro arilo de la Fórmula (J), en donde Hal es bromo o yodo mediante métodos conocidos (ver, por ejemplo, W. Thompson y J. Gaudino, J. Org. Chem, (1984), 49, 5237-5243 y R. Hawkins et al., J. Am. Chem. Soc., (1960), 82, 3053-3059). Así se puede tratar un haluro arilo de la Fórmula (J) con un haluro de litio alquilo o magnesio alquilo a baja temperatura, y el reactivo aril magnesio o arilo litio obtenido se le permite reaccionar con un trialquil borato, B(OR'')₃, preferiblemente trimetilborato, para dar un arilo dialquilboronato que se puede hidrolizar al ácido borónico deseado de la Fórmula (I) bajo condiciones ácidas. Alternativamente se puede lograr la misma transformación general del compuesto (J) al compuesto (I) a través de una reacción de borilación catalizada con paladio bajo condiciones conocidas utilizando reactivos conocidos (ver por ejemplo T. Ishiyama, M. Murata, N. Miyaura, J. Org. Chem. (1995),

uu

60, 7508-7501; y K. L. Billingsley, T. E. Barder, S. L. Buchwald, Angew. Chem. Int. Ed. (2007), 46, 5359-5363), seguido por hidrólisis del intermedio de éster de boronato.



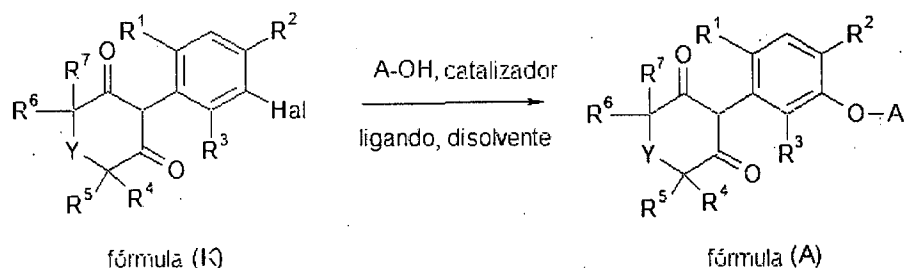
5

Los haluros de arilo de la fórmula (J) son compuestos conocidos o se pueden hacer mediante métodos conocidos a partir de compuestos conocidos (Véase, por ejemplo, R. Clark, J. Agric. Food Chem., 10 (1996), 44 (11), 3643-3652; T. Okamoto y J. Bunnett, J. Am. Chem. Soc., (1956), 78, 5357-5362; H. Scarborough y J. Sweeten, J. Chem. Soc., (1934), 52-56).

En un método adicional, se puede preparar un compuesto de la 15 fórmula (A) al reticular un haluro de arilo de la fórmula (K), en donde Hal es bromo yodo, con un fenol, A-OH, en la presencia de un catalizador adecuado, opcionalmente un ligando o aditivo adecuado, una base adecuada y un disolvente adecuado, bajo condiciones similares a aquellas descritas, por ejemplo, por S. 20 Hu et al., J. Org. Chem., (2008), 73, 7814-7817; P. Chan et al., Tetrahedron Lett., (2008), 49, 2018-2022; R. Hosseinzadeh et al., Synthetic Commun., (2008) 38, 3023-3031; S. Buchwald et al., J. Am. Chem. Soc., (2006), 128, 10694-10695 ; H. Rao et al.,

45

Chem. Eur. J., (2006), 12, 3636-3646; M. Taillefer *et al.*, Adv. Synth. Catal. (2006), 348, 499-505; M. Beller *et al.*, Tetrahedron Lett., (2005), 46 (18), 3237-3240; M. Taillefer *et al.*, Org. Lett. (2004), 6 (6), 913; D. Ma y Q. Cai, Org. Lett. (2003), 5 (21), 3799-3802; J. Song *et al.*, Org. Lett. (2002), 4 (9), 1623-1626; R. Venkataraman *et al.*, Org. Lett. (2001), 3 (26), 4315-4317; S. Buchwald *et al.*, J. Am. Chem. Soc. (1999), 121, 4369-4378; S. Buchwald *et al.*, J. Am. Chem. Soc., (1997), 119, 10539-10540; G. Mann y J. Hartwig, Tetrahedron Lett., (1997), 38 (46), 8005-8008.



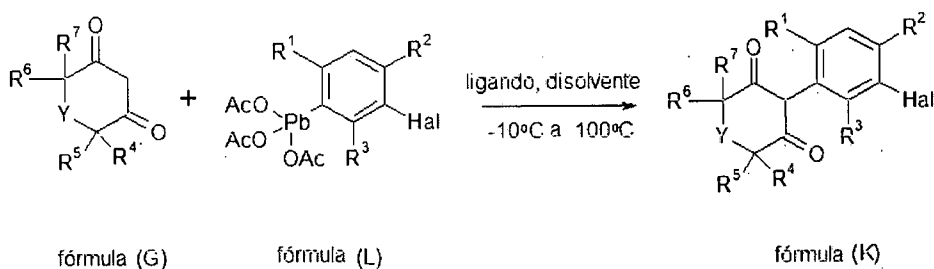
Los catalizadores adecuados incluyen catalizadores de paladio y cobre tal como acetato de paladio (II), bis(dibencilidenoacetona)paladio(II), polvo de cobre, acetato de cobre (II), cloruro de cobre (I), bromuro de cobre (I), bromuro de cobre (II), yoduro de cobre (I), óxido de cobre (I), sulfato de cobre (II), trifluorometanosulfonato de cobre (I) y trifluorometanosulfonato de cobre (II). Opcionalmente se utilizan los catalizadores en conjunto con los ligandos o aditivos apropiados, tal como N-metilglicina N,N-dimetilglicina, 1-butilimidazol, acetato de etilo, etilenglicol diacetato, 8-hidroxiquinolina, L-prolina, ácido 1-naftoico, trifenilfosfina, 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno, salicilaldoxima, 2-(N,N-dimetilamino)-2'-di-*terc*-butilfosfinobifenilo, neocuproina, monoéster de fenilo de ácido pirrolidina-2-fosfónico, 2,2,6,6-

u6

tetrametilheptane-3,5-diona, bromuro tetrabutilamonio, 2,2-bipiridina o 1,10-fenantrolina. Las bases adecuadas son carbonato de cesio, fluoruro de cesio, fluoruro de potasio, fosfato de potasio e hidróxido de sodio. Los disolventes adecuados son acetronitrilo, N,N,-dimetilformamida, 1,4-dioxane o tolueno, o los sistemas de disolvente mezclados tal como tolueno/tetrahidrofurano y 1,4-dioxano/ agua.

Se prefiere el uso de catalizadores de yoduro de cobre (I) y trifluorometanosulfonato de cobre (II).

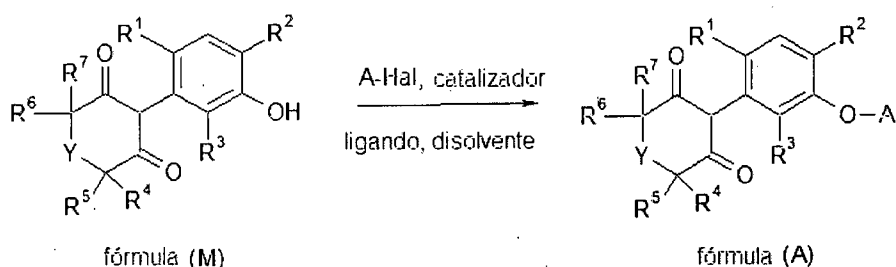
Se puede preparar un compuesto de la fórmula (K) de acuerdo con los procedimientos descritos por M. Muehlebach et al., WO08/071405. Por ejemplo, se puede preparar un compuesto de la fórmula (K) a partir de un compuesto de la fórmula (G) mediante reacción con un compuesto de la fórmula (L) bajo condiciones similares a aquellas utilizadas para la preparación de un compuesto de la fórmula (A) a partir un compuesto de la fórmula (G).



En un método adicional, se puede preparar un compuesto de la fórmula (A) al hacer reaccionar un compuesto de la fórmula (M) con un haluro de arilo de la fórmula A-Hal, en donde Hal representa flúor, cloro, bromo o yodo. Cuando A-Hal es un bromuro

u7

de arilo o yoduro de arilo, la reacción se puede efectuar utilizando catalizadores de cobre o paladio adecuados bajo las condiciones descritas para la preparación de un compuesto de la fórmula (A) a partir de un compuesto de la fórmula (K).



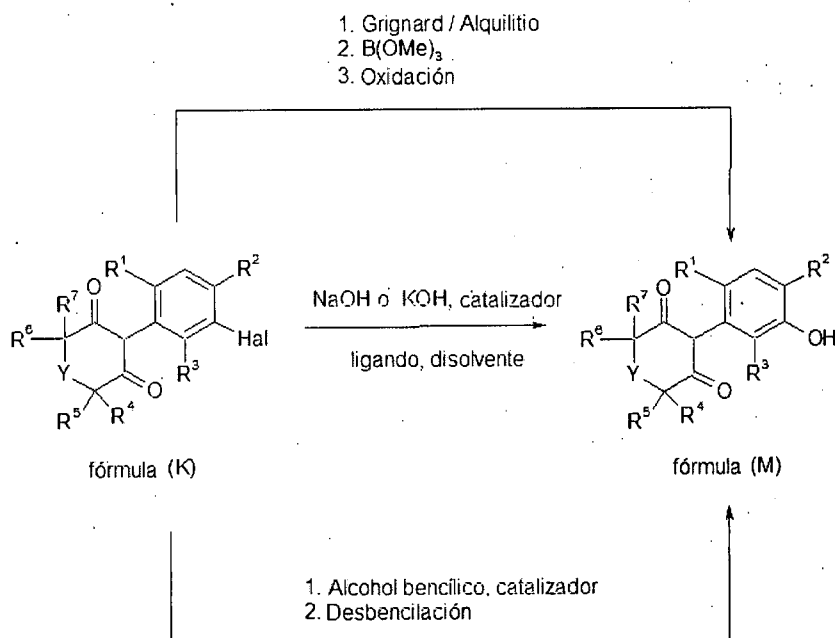
Alternativamente, cuando A-Hal es un haluro de arilo deficiente de electrón, adecuado (por ejemplo un fluoruro de arilo o cloruro de arilo lleva adicionalmente uno o más sustituyentes que retiran electrones tal como trifluoro-metilo, nitro o ciano), o un haluro de heteroarilo adecuado (por ejemplo una halopiridina, o halopirimidina, u otro heterohaluro de arilo deficiente de electrón) la reacción se puede efectuar en la presencia de una base adecuada tal como carbonato de potasio o carbonato de cesio, sin la necesidad de un catalizador y un ligando.

Se puede preparar un compuesto de la fórmula (M) a partir de un compuesto de la fórmula (K). En un método, un compuesto de la Fórmula (K), se desprotona con una base (tal como un reactivo Grignard o reactivo de alquil-litio), y luego se trata con un reactivo alquil-litio para efectuar el intercambio de metal-halógeno. Las especies organometálicas resultantes luego se pueden convertir en un compuesto de la Fórmula (M) mediante tratamiento con un trialquilborato tal como trimetil borato seguido por oxidación (por ejemplo mediante peróxido de

48

hidrógeno, *N*-metil morfolino *N*-óxido u oxono) como se describe, por ejemplo mediante G. Prakash et al., J. Org. Chem., (2001), 66 (2), 633-634; J-P Gottely y S Halazy, Synlett. (1995), 931-932; K. Webb y D. Levy, Tetrahedron Lett., (1995), 36 (29), 5117-5118.

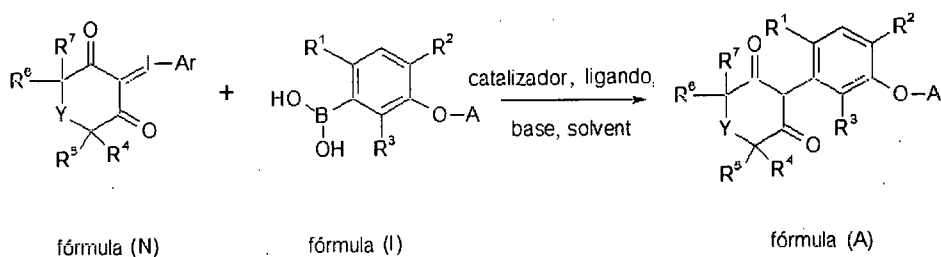
- 5 En un método alternativo, se puede preparar un compuesto de la Fórmula (M), a partir de un compuesto de la Fórmula (K), mediante tratamiento con una solución acuosa de un hidróxido de metal alcali en la presencia de un catalizador adecuado y un ligando adecuado, de acuerdo con los procedimientos conocidos. Por
- 10 ejemplo, se puede preparar un compuesto de la Fórmula (M), al tratar un compuesto de la Fórmula (K), con hidróxido de potasio en la presencia de un catalizador de palado (por ejemplo bis(dibencilideno-acetona)paladio (II), y en la presencia de un ligando fosfina adecuado tal como 2-(di-terc-butilfosfino)-
- 15 2',4',6'-triisopropilbifenilo y 2-(di-terc-butilfosfino)-3,4,5,6-tetrametil-2',4',6'-triisopropilbifenilo, bajo las condiciones descritas, por ejemplo, por S. Buchwald et al., J. Am. Chem. Soc., (2006), 128, 10694-10695. Alternativamente, se puede preparar un compuesto de la Fórmula (M), al tratar un compuesto
- 20 de la Fórmula (K), mediante tratamiento con una solución acuosa de hidróxido de sodio en la presencia de un catalizador de cobre adecuado (por ejemplo yoduro de cobre (I)) y un ligando adecuado (tal como L-prolina), bajo las condiciones descritas, por ejemplo, por C. Kormos y N. Leadbeater, Tetrahedron (2006), 62
- 25 (19), 4728-4732.



En un tercer método para un compuesto de la fórmula (M) un compuesto de la fórmula (K) se puede tratar con un alcohol bencílico en la presencia de un catalizador de cobre adecuado, seguido por desbencilación bajo condiciones conocidas (por ejemplo mediante hidrogenólisis catalítica).

Los compuestos de la fórmula (M) son novedosos y se han designado especialmente como intermedios para la síntesis de los compuestos de la fórmula I.

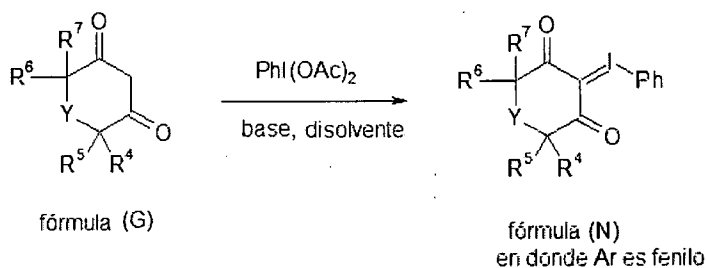
En un método alternativo, se puede preparar un compuesto de la fórmula (A) mediante la reacción de un compuesto de la fórmula (N), en donde Ar es un grupo funcional arilo (preferiblemente fenilo) con un ácido arilborónico de la fórmula (I) en la presencia de un catalizador de paladio adecuado, una base adecuada, opcionalmente en la presencia de un ligando aditivo adecuado, y en un disolvente adecuado.



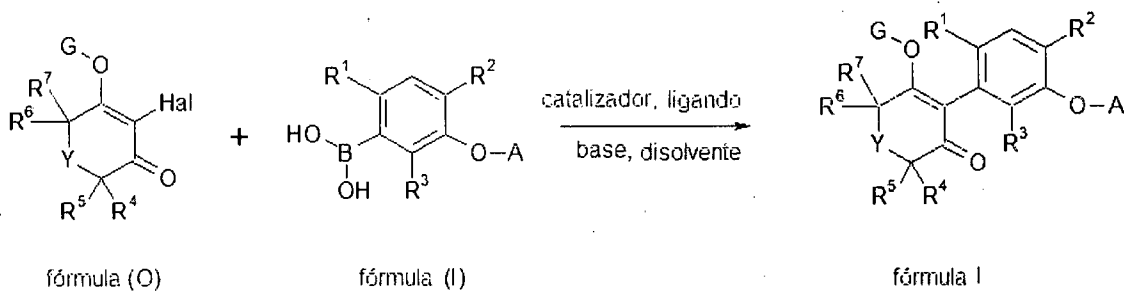
Los catalizadores de paladio adecuado incluyen, por ejemplo dihaluros de paladio (II), acetato de paladio (II) y sulfato de paladio (II), y se prefiere acetato de paladio (II). Los ligandos adecuados incluyen trifenil-fosfina, triciclopentilfosfina, triciclohexilfosfina, 2-diciclo-hexilfosfino-2',6'-dimetoxibifenilo, 2-diciclohexilfosfino-2',4',6'-triisopropil-bifenilo, 1,1'-bis(difenil-fosfino)ferroceno y 1,2-bis(difenilfosfino)etano. También puede llevar a cabo la reacción en la presencia de otros aditivos, tales como sales de tetraalquilamonio, por ejemplo, bromuro de tetrabutilamonio. Las bases adecuadas incluyen hidróxidos de metal álcali, especialmente hidróxido de litio. Un disolvente adecuado es 1,2-dimetoxietano acuoso.

Se puede preparar un compuesto de la fórmula (N), en donde Ar es fenilo, a partir de un compuesto de la fórmula (G) mediante tratamiento con un reactivo de yodo hipervalente tal como un (diacetoxi)yodobenceno o yodosilbenceno y una base tal como carbonato de sodio acuoso, hidróxido de litio o hidróxido de sodio en un disolvente tal como agua o un alcohol acuoso tal como etanol acuoso de acuerdo con los procedimientos de Schank y C. Lick, *Synthesis* (1983), 392; R. Moriarty et al, *J. Am. Chem. Soc.*

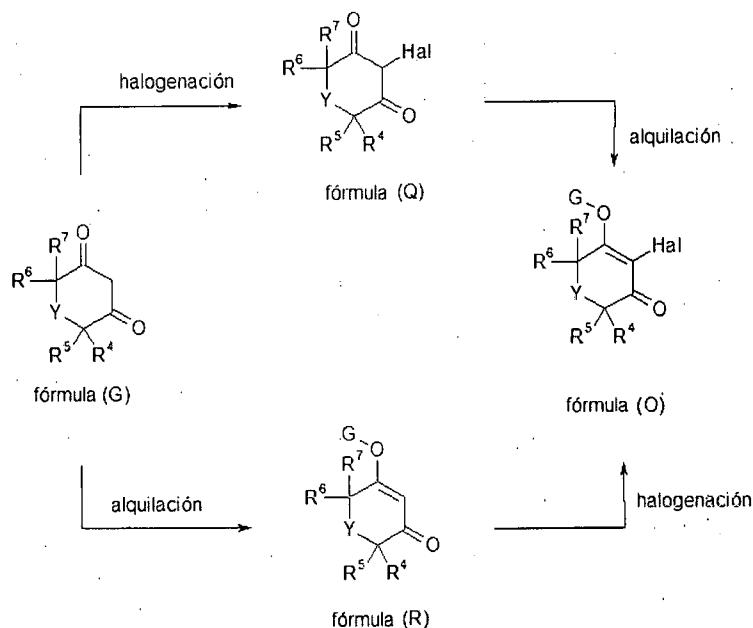
(1985), 107, 1375, o of Z. Yang et al., Org. Lett., (2002), 4 (19), 3333:



5 En un método adicional, se puede preparar un compuesto de la
Fórmula I al hacer reaccionar un compuesto de la Fórmula (O) (en
donde G es preferiblemente alquilo C₁₋₄, y Hal es un halógeno,
preferiblemente bromo o yodo), con un ácido arilborónico de la
Fórmula (I) en la presencia de un catalizador de paladio adecuado
10 (por ejemplo 0.001-50% acetato paladio (II) con respecto al
compuesto (O)) y una base (por ejemplo 1 a 10 equivalentes de
fosfato de potasio con respecto al compuesto (O)) y
preferiblemente en la presencia de un ligando adecuado (por
ejemplo 0.001-50% (2-diciclohexil-fosfino)-2',6'-dimetoxibifenil
15 con respecto al compuesto (U)), y en un disolvente adecuado (por
ejemplo tolueno), preferiblemente entre 25°C y 200°C. Se conocen
en la bibliografía acoplamientos similares (ver por ejemplo, Y.
Song, B. Kim y J.-N. Heo, Tetrahedron Letters (2005), 46 (36),
5987-5990).

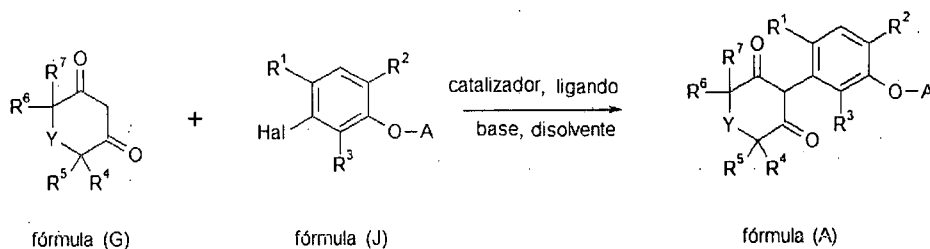


Un compuesto de la Fórmula (O) se puede preparar al halogenar un compuesto de la Fórmula (G), seguido por reacción del haluro resultante de la Fórmula (Q) con un haluro alquilo C₁-C₄ o tri - alquilortoformato C₁-C₄ bajo condiciones conocidas, por ejemplo
 5 mediante los procedimientos de R. Shepherd y A. White (J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1 (1987), 2153-2155) y Y.-L. Lin et al. (Bioorg. Med. Chem. (2002), 10, 685-690). Alternativamente, un compuesto de la Fórmula (O) se puede preparar al hacer reaccionar un compuesto de la Fórmula (G), con un haluro alquilo C₁-C₄ o un
 10 tri- alquilortoformato C₁-C₄, y la enona resultante halogenante de la Fórmula (R) bajo condiciones conocidas (ver por ejemplo Y. Song, B. Kim y J.-N. Heo, Tetrahedron Letters (2005), 46(36), 5987-5990).



15 En un método adicional, se puede preparar un compuesto de la fórmula (A) al hacer reaccionar un compuesto de la fórmula (G) con un compuesto de la fórmula (J) en la presencia de un catalizador de paladio adecuado (por ejemplo 0.001-50% de acetato de paladio (II) con respecto al compuesto (G)) y una base (por
 20 ejemplo 1 a 10 equivalentes de fosfato de potasio con respecto al

compuesto (G)) y preferiblemente en la presencia de un ligando adecuado (por ejemplo 0.001-50% de (2-diciclohexilfosfino)-2',4',6'-triisopropilbifenilo con respecto al compuesto (G)), y en un disolvente adecuado (por ejemplo dioxano), preferiblemente entre 25°C y 200°C y opcionalmente bajo calor por microondas.



Se conocen acoplamientos similares en la bibliografía (ver por ejemplo, S. Buchwald et al., J. Am. Chem. Soc. (2000), 122, 1360-1370; B. Hong et al. WO 2005/000233). Alternativamente, se puede preparar un compuesto de la fórmula (A) al hacer reaccionar un compuesto de la fórmula (J) con un compuesto de la fórmula (M) en la presencia de un catalizador de cobre adecuado (por ejemplo 0.001-50% de yoduro de cobre (I) con respecto al compuesto (J)) y una base (por ejemplo 1 a 10 equivalentes de carbonato de cesio con respecto al compuesto (J)) y preferiblemente en la presencia de un ligando adecuado (por ejemplo 0.001-50% de L-prolina con respecto al compuesto (J)), y en un disolvente adecuado (por ejemplo dimetilsulfóxido), preferiblemente entre 25°C y 200°C. Se conocen acoplamientos similares en la bibliografía (ver por ejemplo, Y. Jiang et al., Synlett, (2005), 18, 2731-2734, y X. Xie et al., Organic Letters (2005), 7(21), 4693-4695).

Se pueden utilizar los compuestos de la Fórmula I de acuerdo con la invención como agentes de protección de cultivo en forma no

modificada, como se obtiene en la síntesis, pero ellos se
formulan de manera general en composiciones de protección para
cultivos en una variedad de formas utilizando adyuvantes de
formulación, tales como portadores, disolventes y sustancias
5 activas de superficie. Las formulaciones pueden estar en varias
formas físicas, por ejemplo en la forma de polvos, geles, polvos
humectables, gránulos impregnados y recubiertos para distribución
manual o mecánica en los sitios objetivo, gránulos que se pueden
dispersar en agua, gránulos solubles en agua, gránulos
10 emulsificables, comprimidos que se pueden dispersar en agua,
tabletas comprimidas efervescentes, cintas solubles en agua,
concentrados emulsificables, concentrados micro-emulsificables,
emulsiones aceite en agua (EW) o agua en aceite (WO), otros
sistemas multifase tal como productos aceite/agua/aceite y
15 agua/aceite/agua, dispersiones acuosas que fluyen en aceite,
dispersiones aceitosas, suspoemulsiones, suspensiones en cápsula,
líquidos solubles, concentrados solubles en agua (disolvente
orgánico miscible en agua o con agua como portador), películas
poliméricas impregnadas o en otras formas conocidas, por ejemplo,
20 de Manual on Development and Use of FAO Specifications for Plant
Protection Products, 5ta Edición, 1999. Se puede incorporar el
ingrediente activo se puede incorporar en microfibras o
microbarras formadas de los polímeros o monómeros polimerizables
y que tienen diámetro de aproximadamente 0.1 a aproximadamente 50
25 micras y relación de aspecto de entre aproximadamente 10 y
aproximadamente 1000.

SS

También se pueden utilizar dichas formulaciones directamente o se diluyen antes de uso. Ellas luego se pueden aplicar a través de un equipo de rociado de aplicación aérea o por tierra adecuado u otro equipo de aplicación por tierra tal como sistemas de irrigación central giratorios o medios de irrigación de goteo/riego.

Se pueden preparar formulaciones diluidas, por ejemplo, con agua, fertilizantes líquidos, micro-nutrientes, organismos biológicos, aceite o disolventes.

Se pueden preparar las formulaciones, por ejemplo, al mezclar el ingrediente activo con adyuvantes de formulación con el fin de obtener composiciones en la forma de sólidos finamente divididos, gránulos, soluciones, dispersiones o emulsiones. Los ingredientes activos también se pueden contener en microcápsulas finas que consisten de un núcleo y una cubierta polimérica. Las microcápsulas tienen usualmente un diámetro de 0.1 a 500 micras. Ellas contienen los ingredientes activos en una cantidad aproximadamente de 25 a 95 % en peso del peso de la cápsula. Los ingredientes activos pueden estar presentes en la forma de material técnico líquido, en la forma de una solución adecuada, en la forma de partículas finas en dispersión sólida o líquida o como un sólido monolítico. Las membranas encapsulantes comprenden, por ejemplo, gomas naturales y sintéticas, celulosa, copolímeros de estireno-butadieno u otra membrana adecuada similar que forma el material, poliacrilonitrilo, poliacrilato, poliéster, poliamidas, poliureas, poliuretano, resinas

aminoplásticas o almidón químicamente modificado u otros polímeros que se conocen por la persona experta en la técnica en esta relación.

- 5 Alternativamente es posible para las así llamadas "microcápsulas" finas que se van a formar cuando el ingrediente activo está presente en la forma de partículas finamente divididas en una matriz sólida de una sustancia base, pero en este caso la microcápsula no se encapsula con una difusión que limita la
10 membrana como se bosqueja en el párrafo precedente.

Los ingredientes activos se pueden adsorber en un portador poroso. Esto puede permitir que los ingredientes activos sean liberados en sus alrededores en cantidades controladas (por
15 ejemplo liberación lenta).

Otras formas de formulaciones de liberación controlada son gránulos o polvos en los que se dispersa el ingrediente activo o se disuelve en una matriz sólida que consiste de un polímero, una
20 cera o una sustancia sólida adecuada de menor peso molecular. Los polímeros adecuados son acetatos de polivinilo, poliestirenos, poliolefinas, alcoholes polivinilo polivinil pirrolidonas, polivinil pirrolidonas alquilatadas, copolímeros de polivinil pirrolidonas y anhídrido maleico y ésteres y ésteres medios de
25 los mismos, ésteres de celulosa químicamente modificados como carboximetilcelulosa, metilcelulosa, hidroxietilcelulosa, ejemplos de ceras adecuadas son cera de polietileno, cera de polietileno oxidizada, ceras de éster como ceras montan, ceras de

5X

origen natural como cera carnauba, cera candelilla, cera de abejas etc.

Otros materiales de matriz adecuados para las formulaciones de liberación lenta son almidón, estearina, lignina.

Los adyuvantes de formulación adecuados para la preparación de las composiciones de acuerdo con la invención se conocen *per se*.

10 Como portadores líquidos se pueden utilizar: agua, disolventes aromáticos tal como tolueno, m-xileno, o-xileno, p-xileno y mezclas de los mismos, cumeno, mezclas de hidrocarburos aromáticos con rangos de ebullición entre 140 y 320 °C conocidos bajo varios nombres comerciales como Solvesso®, Shellsol A®,
15 Caromax®, Hidrosol®, portadores parafínicos y isoparafínicos tal como aceites de parafina, aceites minerales, disolventes de hidrocarburo desaromatizados con rangos de ebullición entre 50 y 320 °C conocidos por ejemplo bajo la marca Exxsol®, disolventes de hidrocarburo no desaromatizados con rangos de ebullición entre
20 100 y 320 °C conocidos bajo la marca Varsol®, disolventes isoparafínicos con rangos de ebullición entre 100 y 320 °C conocidos bajo las marcas como Isopar® o Shellsol T®, hidrocarburos tal como ciclo-hexano, tetrahidronaftaleno (tetralin), decahidronaftaleno, alfa-pinena, d-limoneno,
25 hexadecano, isooctano, disolventes de éster tal como acetato de etilo, acetato de n/i-butilo, acetato de amilo, acetato de i-bornilo, acetato de 2-etilhexilo, ésteres alquilo C₆ - C₁₈ de ácido acético conocidos bajo la marca Exxate®, etil éster de

ácido láctico, propiléster de ácido láctico, butiléster de ácido
láctico, benzoato de bencilo, lactato de bencilo, dibenzoato
dipropilenoglicol, ésteres dialquilo de ácido succínico, maleico
y fumárico y disolventes polares como N-metil pirrolidona, N-etil
5 pirrolidona, alquil pirrolidonas C₃-C₁₈, gama-butirolactona,
dimetilsulfóxido, N,N-dimetil-formamida, N,N-dimetil-acetamida,
N,N-dimetil-lactamida, dimetilamidas de ácido graso C₄-C₁₈,
dimetilamida de ácido benzoico, acetonitrilo, acetona, metiletil
cetona, metil-isobutil cetona, isoamil cetona, 2-heptanona,
10 ciclohexanona, isoforona, metil isobutenil cetona (óxido de
mesitilo), acetofenona, carbonato de etileno, carbonato de
propileno, carbonato de butileno, disolventes y diluyentes
alcohólicos tal como metanol, etanol, propanol, n/iso-butanol,
n/iso-pentanol, 2-etilo hexanol, n-octanol, alcohol
15 tetrahidrofurfurilo, 2-metil-2,4-pentanodiol, 4-hidroxi-4-metil-
2-pentanona, ciclohexanol, alcohol bencílico, etilenglicol, butil
éter etilenglicol, metil éter etilenglicol, dietilenglicol, butil
éter dietilenglicol, etil éter dietilenglicol, metil éter
dietilenglicol, propilenglicol, dipropilenglicol, metil éter
20 dipropilenglicol y otros disolventes de éterglicol similares con
base en etilenglicol, propilenglicol y materias primas de
butilenglicol, trietilenglicol, polietilenglicol (PEG 400),
polipropilenglicoles con masas moleculares de 400 - 4000,
glicerol, acetato de glicerol, diacetato de glicerol, triacetato
25 de glicerol, 1,4-dioxano, abietato dietilenglicol, clorobenceno,
clorotolueno, ésteres de ácidos grasos tal como octanoato de
metilo, miristato de isopropilo, laurato de metilo, oleato de
metilo, mezcla de metil ésteres de ácido graso C₈-C₁₀, metil y

etil ésteres de aceite de semilla de colza, metil y etil ésteres de aceite de semilla de soya, aceites vegetales, ácidos grasos tal como ácido oleico, ácido linoleico, ácido linolenico, ésteres de ácido fosfórico y fosfónico tal como trietil fosfato, fosfatos 5 -tris-alquil C₃-C₁₈, fosfatos de alquilarilo, fosfonatos de bis-octil-octilo.

El agua es generalmente el portador de elección para la dilución de los concentrados.

10

Los portadores sólidos adecuados son, por ejemplo, talco, dióxido de titanio, arcilla pirofilita, sílice (sílice ahumada o precipitada y opcionalmente funcionalizada o tratada, por ejemplo silanizado), arcilla atapulgita, tierra de diatomeas, piedra 15 caliza, carbonato de calcio, bentonita, montomorilonita de calcio, cascarilla de semilla de algodón, alimentos con trigo, harina de soya, piedra pómez, harina de madera, cáscara de nueces triturada, lignina y materiales similares, como se describe, por ejemplo, en el EPA CFR 180.1001. (c) & (d). También se pueden 20 utilizar fertilizantes granulados o en polvo como portadores sólidos.

Se puede utilizar ventajosamente un gran número de sustancias activas de superficie en formulaciones sólidas o en formulaciones 25 líquidas, especialmente en aquellas formulaciones que se pueden diluir con un portador antes de uso. Las sustancias activas de superficie pueden ser aniónicas, catiónicas, anfotéricas, no iónicas o poliméricas y ellas se pueden utilizar como agentes

emulsificantes, humectantes, dispersantes o de suspensión o para otros propósitos. Las sustancias activas de superficie típicas incluyen, por ejemplo, sales de alquil sulfatos, tal como lauril sulfato dietanolamonio; lauril sulfato de sodio, sales de alquilarilsulfonatos, tal como dodecil-bencenosulfonato de sodio o calcio; productos de adición de óxido de alquilfenol-alquileo, tal como etoxilatos nonilfenol; productos de adición de alcohol-óxido de alquileo, tal como etoxilato de alcohol tridecilo; jabones, tal como estearato de sodio; sales de alquilnaftalenosulfonatos, tal como dibutilnaftalenosulfonato de sodio; ésteres dialquilo de sales sulfosuccinato, tal como sulfosuccinato di(2-etilhexil) de sodio; ésteres sorbitol, tal como oleato sorbitol; aminas cuaternarias, tal como cloruro de lauril trimetilamonio, ésteres polietilenglicol de ácidos grasos, tal como estearato de polietilenglicol; copolímeros de bloque de óxido de etileno y óxido de propileno; y sales de ésteres mono- y di-alquil fosfato; y también las sustancias adicionales descritas por ejemplo en "McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publishing Corp., Ridgewood, New Jersey, 1981.

20

Los adyuvantes adicionales que se pueden utilizar usualmente en las formulaciones pesticidas incluyen inhibidores de cristalización, sustancias que modifican la viscosidad, agentes de suspensión, tintes, anti-oxidantes, agentes espumantes, absorbedores de luz, auxiliares de mezcla, anti-espumantes, agentes complejantes, sustancias que modifican el pH o neutralizantes y reguladores, inhibidores de corrosión, fragancias, agentes humectantes, mejoradores de absorción,

micronutrientes, plastificantes, deslizantes, lubricantes, dispersantes, agentes de pegajosidad, anti-congelantes, microbiocidas, agentes de compatibilidad y solubilizantes y también fertilizantes sólidos y líquidos.

5

Las formulaciones también pueden comprender sustancias activas adicionales, por ejemplo herbicidas adicionales, protectores herbicidas, reguladores de crecimiento de la planta, fungicidas o insecticidas.

10

Las composiciones de acuerdo con la invención pueden incluir adicionalmente un aditivo (denominado comúnmente como un adyuvante), que comprende un aceite mineral, un aceite de origen vegetal o animal, ésteres alquilo de tales aceites o mezclas de

15 tales aceites y derivados de aceite. La cantidad de aditivo de aceite utilizado en la composición de acuerdo con la invención es generalmente de 0.01 a 10 %, con base en la mezcla de rociado.

Por ejemplo, el aditivo de aceite se puede agregar al tanque de rociado en la concentración deseada después que se ha preparado

20 la mezcla de rociado. Los aditivos de aceite preferidos

comprenden aceites minerales o un aceite de origen vegetal, por ejemplo aceite de semilla de colza, aceite de oliva o aceite de girasol, aceite vegetal emulsificable, tal como AMIGO® (Lovely Products Inc.), ésteres alquilo de aceites de origen vegetal, por

25 ejemplo los derivados metilo, o un aceite de origen animal, tal como aceite de pescado o cebo de carne. Un aditivo preferido contiene, por ejemplo, como componentes activos esencialmente 80 % en peso de ésteres de alquilo de aceites de pescado y 15 % en

peso de aceite de semilla de colza metilado, y también 5 % en peso de los emulsificantes acostumbrados y modificadores de pH. Especialmente los aditivos de aceite preferidos comprenden ésteres alquilo de ácidos grasos C_8-C_{22} , especialmente los derivados metilo de ácidos grasos $C_{12}-C_{18}$, por ejemplo son importantes los ésteres metilo de ácido láurico, ácido palmítico y ácido oleico. Aquellos ésteres se conocen como metil laurato (CAS-111-82-0), metil palmitato (CAS-112-39-0) y metil oleato (CAS-112-62-9). Un derivado de metil éster de ácido graso preferido es AGNIQUE ME 18 RD-F® (Cognis). Aquellos y otros derivados de aceite también se conocen de Compendium of Herbicide Adjuvants, 5ta Edición, Southern Illinois University, 2000.

La aplicación y acción de los aditivos de aceite se puede mejorar adicionalmente al combinarlos con las sustancias activas de superficie, tal como tensoactivos no iónicos, aniónicos, catiónicos o anfotéricos. Ejemplos de tensoactivos aniónicos, no iónicos, catiónicos o anfotéricos adecuados se enumeran en las páginas 7 y 8 de la WO97/34485. Las sustancias activas de superficie preferidas son tensoactivos aniónicos del tipo dodecil-bencilsulfonato, especialmente las sales de calcio de los mismos, y también los tensoactivos no iónicos del tipo de etoxilato de alcohol graso. Se da especial preferencia a alcoholes grasos etoxilados $C_{12}-C_{22}$ que tienen un grado de etoxilación de 5 a 40. Ejemplos de los tensoactivos comercialmente disponibles son los tipos Genapol (Clariant). También se prefieren tensoactivos de silicona, especialmente heptametiltrisiloxanos modificados con polialquil-óxido, que

están comercialmente disponibles por ejemplo como SILWET L-77®, y también tensoactivos perfluorinados. La concentración de las sustancias activas de superficie en relación con el aditivo total es generalmente de 1 a 50 % en peso. Ejemplos de aditivos de
5 aceite que consisten de mezclas de aceites o aceites minerales o derivados de los mismos con los tensoactivos son TURBOCHARGE®, ADIGOR® (ambos (Syngenta Crop Protection AG), ACTIPRON® (BP Oil UK Limited), AGRI-DEX® (Helena Chemical Company).

10 También se pueden utilizar sustancias activas de superficie en las formulaciones solas, es decir sin aditivos de aceite.

Adicionalmente, la adición de un disolvente orgánico a la mezcla de aditivo/tensoactivo de aceite puede contribuir a un
15 mejoramiento adicional de la acción. Los disolventes adecuados son, por ejemplo, disolventes SOLVESSO® y AROMATIC® (Exxon Corporation). La concentración de tales disolventes puede ser de 10 a 80 % en peso del peso total. Tales aditivos de aceite, que pueden estar en mezcla con los disolventes, se describen, por
20 ejemplo, en la US 4 834 908. Un aditivo de aceite comercialmente disponible descrito aquí se conoce mediante el nombre MERGE® (BASF). Los aditivos de aceite adicionales que se prefieren de acuerdo con la invención son SCORE® y ADIGOR® (ambos Syngenta Crop Protection AG).

25

En adición a los aditivos de aceite enumerados anteriormente, con el fin de mejorar la actividad de las composiciones de acuerdo

con la invención es posible para las formulaciones de alquilpirrolidonas, (por ejemplo AGRIMAX® de ISP) ser agregadas a la mezcla de rociado. También se pueden utilizar formulaciones de redes sintéticas, tal como, por ejemplo, poliacrilamida, 5 compuestos polivinilo o poli-1-p-menteno (por ejemplo BOND®, COURIER® o EMERALD®).

Se pueden emplear tales aceites de adyuvante como se describe en los párrafos precedentes como el líquido portador en el que se 10 disuelve un compuesto activo, se emulsifica o se dispersa según sea apropiado para la forma física del compuesto activo.

Las formulaciones pesticidas contienen generalmente de 0.1 a 99 % en peso, especialmente de 0.1 a 95 % en peso, de un compuesto de 15 la Fórmula I y de 1 a 99.9 % en peso de un adyuvante de formulación, que incluye preferiblemente de 0 a 25 % en peso de una sustancia activa de superficie. Mientras que los productos comerciales preferiblemente se formularán como concentrados, el usuario final empleará normalmente formulaciones diluidas.

20

El índice de aplicación de los compuestos de la Fórmula I puede variar dentro de límites amplios y depende de la naturaleza del suelo, el método de aplicación (pre- o post-emergencia; tratamiento de semillas; aplicación al surco de la semilla; sin 25 aplicación a la labranza etc.), la planta de cultivo, la maleza o el pasto que se va a controlar, las condiciones climáticas prevalentes, y otros factores gobernados por el método de

aplicación, el tiempo de aplicación y el cultivo objetivo. Los compuestos de la Fórmula I de acuerdo con la invención se aplican de manera general en un índice de 1- 2000 g/ha, preferiblemente 1- 1000 g / ha y más preferiblemente a 1- 500 g / ha.

5

Las formulaciones preferidas tienen especialmente las siguientes composiciones representativas:

(% = porcentaje en peso):

10 Concentrados emulsificables:

ingrediente activo: 1 a 95 %, preferiblemente 60 a 90 %

agentes activos de superficie: 1 a 30 %, preferiblemente 5 a 20 %

disolventes como portador líquido: 1 a 80 %, preferiblemente 1 a 35 %

15

Polvos:

ingrediente activo: 0.1 a 10 %, preferiblemente 0.1 a 5 %

portadores sólidos: 99.9 a 90 %, preferiblemente 99.9 a 99 %

20 Concentrados de suspensión:

ingrediente activo: 5 a 75 %, preferiblemente 10 a 50 %

agua: 94 a 24 %, preferiblemente 88 a 30 %

agentes activos de superficie: 1 a 40 %, preferiblemente 2 a 30 %

25 Polvos humectables:

ingrediente activo: 0.5 a 90 %, preferiblemente 1 a 80 %

agentes activos de superficie: 0.5 a 20 %, preferiblemente 1 a 15 %

66

portadores sólidos: 5 a 95 %, preferiblemente 15 a 90 %

Gránulos:

ingrediente activo: 0.1 a 30 %, preferiblemente 0.1 a 15 %

5 portadores sólidos: 99.5 a 70 %, preferiblemente 97 a 85 %

Gránulos que se pueden dispersar en agua:

ingrediente activo: 1 a 90 %, preferiblemente 10 a 80 %

agentes activos de superficie: 0.5 a 80 %, preferiblemente 5 a 30

10 %

portadores sólidos: 90 a 10 %, preferiblemente 70 a 30 %

Los siguientes Ejemplos ilustran adicionalmente, pero no limitan, la invención.

15

<u>Fl. Concentrados emulsificables</u>	a)	b)	c)	d)
ingrediente activo	5 %	10 %	25 %	50 %
dodecilbenceno de calcio-sulfonato	6 %	8 %	6 %	8 %
éter poliglicol de aceite de ricino	4 %	-	4 %	4 %
(36 mol de óxido de etileno)				
Poliglicol éter de octilfenol	-	4 %	-	2 %
(7-8 mol de óxido de etileno)				
NMP	-	10 %		20 %
Hidrocarburo arom.	85 %	68 %	65 %	16 %
mezcla C ₉ -C ₁₂				

Se pueden preparar emulsiones de cualquier concentración deseada a partir de tales concentrados mediante dilución con agua.

67

<u>F2. Soluciones</u>	a)	b)	c)	d)
ingrediente activo	5 %	10 %	50 %	90 %
1-metoxi-3-(3-metoxi-propoxi)-propano	40 %	50 %	-	
polietilenglicol MW 400	20 %	10 %	-	-
NMP	50 %	10 %		
Hidrocarburo arom.	35 %	30 %	-	-
mezcla C ₉ -C ₁₂				

Las soluciones son adecuadas para aplicación no diluida o después de dilución con agua.

5

<u>F3. Polvos humectables</u>	a)	b)	c)	d)
ingrediente activo	5 %	25 %	50 %	80 %
lignosulfonato de sodio	4 %	-	3 %	-
lauril sulfato de sodio	2 %	3 %	-	4 %
diisobutilnaftaleno-sulfonato de sodio	-	6 %	5 %	6 %
poliglicoléter				
octilfenol	-	1 %	2 %	-
(7-8 mol de óxido de etileno)				
Ácido silícico				
altamente disperso	1 %	3 %	5 %	10 %
caolín	88 %	62 %	35 %	-

El ingrediente activo se mezcla vigorosamente con los adyuvantes y la mezcla se muele vigorosamente en un molino adecuado, produciendo polvos humectables que se pueden diluir con agua para

10 dar suspensiones de cualquier concentración deseada.

68

<u>F4. Gránulos recubiertos</u>	a)	b)	c)
ingrediente activo	0.1 %	5 %	15 %
sílice altamente dispersa	0.9 %	2 %	2 %
portador inorg.	99.0 %	93 %	83 %
(diámetro 0.1 - 1 mm)			
Por ejemplo CaCO_3 o SiO_2			

El ingrediente activo se disuelve en cloruro de metileno, la solución se rocía en el portador y el disolvente se evapora posteriormente *in vacuo*.

<u>F5. Gránulos recubiertos</u>	a)	b)	c)
ingrediente activo	0.1 %	5 %	15 %
polietilenglicol MW 200	1.0 %	2 %	3 %
sílice altamente dispersa	0.9 %	1 %	2 %
portador inorg.	98.0 %	92 %	80 %
(diámetro 0.1 - 1 mm)			
por ejemplo CaCO_3 o SiO_2			

El ingrediente activo finamente molido se aplica uniformemente, en un mezclador, al portador humectado con polietilenglicol. Se obtienen gránulos recubiertos sin polvo de esta forma.

<u>F6. Gránulos estrudidos</u>	a)	b)	c)	d)
ingrediente activo	0.1 %	3 %	5 %	15 %
lignosulfonato de sodio	1.5 %	2 %	3 %	4 %
carboximetilcelulosa	1.4 %	2 %	2 %	2 %
caolín	97.0 %	93 %	90 %	79 %

El ingrediente activo se mezcla y se muele con los adyuvantes y la mezcla se humedece con agua. La mezcla resultante se extruye y luego se seca en una corriente aire.

<u>F7. Gránulos dispersibles</u>	a)	b)	c)	d)
<u>en agua</u>				
ingrediente activo	5 %	10 %	40 %	90 %
lignosulfonato de sodio	20 %	20 %	15 %	7 %
dibutil naftaleno sulfonato	5 %	5 %	4 %	2 %
goma arábica	2 %	1 %	1 %	1 %
tierra diatomácea	20 %	30 %	5 %	
Sulfato de sodio			4 %	5 %
caolín	48 %	30 %	30 %	

5

El ingrediente activo se mezcla y se muele con los adyuvantes y la mezcla se humedece con agua. La mezcla resultante se extruye y luego se seca en una corriente de aire.

<u>F8. Polvos</u>	a)	b)	c)
ingrediente activo	0.1 %	1 %	5 %
talco	39.9 %	49 %	35 %
caolín	60.0 %	50 %	60 %

10

Los polvos listos para uso se obtienen al mezclar el ingrediente activo con los portadores y moler la mezcla en un molino adecuado.

<u>F9. Concentrados de suspensión</u>	a)	b)	c)	d)
ingrediente activo	3 %	10 %	25 %	50 %
propilenglicol	5 %	5 %	5 %	5 %
nonilfenol poliglicoléter	-	2 %	-	
(15 mol de óxido de etileno)				

20

Lignosulfonato de sodio	3 %	3 %	7 %	6 %
heteropolisacárido (Xantano)	0.2 %	0.2 %	0.2 %	0.2 %
1,2-Bencisotiazolin-3-on	0.1 %	0.1 %	0.1 %	0.1 %
Emulsión de aceite de silicona	0.7 %	0.7 %	0.7 %	0.7 %
agua	87 %	79 %	62 %	38 %

El ingrediente activo finamente molido se mezcla íntimamente con los adyuvantes, produciendo un concentrado de suspensión del que se pueden preparar las suspensiones de cualquiera concentración deseada mediante dilución con agua.

Los cultivos de plantas útiles en los que las composiciones de acuerdo con la invención que se pueden utilizar incluyen especialmente cereales, en particular trigo y cebada, arroz, maíz, colza, remolacha, caña de azúcar, soya, algodón, girasol, maní y cultivos de plantación.

El término "cultivos" se entiende que también incluye cultivos que se han presentado tolerantes a los herbicidas o clases de herbicidas (por ejemplo inhibidores ALS, GS, EPSPS, PPO y HPPD) como un resultado de métodos convencionales de siembra o ingeniería genética. Un ejemplo de un cultivo que se ha presentado tolerante por ejemplo a las imidazolinonas, tal como imazamox, mediante métodos convencionales de siembra es colza de verano Clearfield® (Canola). Ejemplos de cultivos que se han presentado tolerantes a los herbicidas mediante métodos de ingeniería genética incluyen por ejemplo glifosato- y variedades de maíz resistentes a glufosinato comercialmente disponibles bajo los nombres comerciales RoundupReady® y LibertyLink®. Las melazas

71

a ser controladas son malezas monocotiledóneas y dicotiledóneas, tal como, por ejemplo, *Stellaria*, *Nasturtium*, *Agrostis*, *Digitaria*, *Avena*, *Setaria*, *Sinapis*, *Lolium*, *Solanum*, *Echinocloa*, *Scirpus*, *Monochoria*, *Sagittaria*, *Bromus*, *Alopecurus*, *Sorghum*,
5 *Rottboellia*, *Cyperus*, *Abutilon*, *Sida*, *Xanthio*, *Amaranthus*, *Chuenopodium*, *Ipomoea*, *Chrysanthenum*, *Galio*, *Viola* y *Veronica*. EL control de las malezas monocotiledóneas, en particular *Agrostis*, *Avena*, *Setaria*, *Lolium*, *Echinocloa*, *Bromus*, *Alopecurus* y *Sorghum* es muy extenso.

10

También se entiende que los cultivos son aquellos que se han presentado resistentes a insectos perjudiciales mediante métodos de ingeniería genética, por ejemplo maíz Bt (resistentes al gusano de arroz Europeo), algodón Bt (resistentes al picudo
15 algodonero) y también papas Bt (resistentes a escarabajo Colorado). Ejemplos de maíz Bt son los híbridos de maíz Bt-176 de NK® (Semillas Syngenta). La toxina Bt es una proteína que se forma de manera natural por la bacteria del suelo *Bacillus thuringiensis*. Ejemplos de toxinas y plantas transgénicas capaces
20 de sintetizar tales toxinas se describen en la EP-A-451 878, EP-A-374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, WO 03/052073 y EP-A-427 529. Ejemplos de plantas transgénicas que contienen uno o más genes que codifican una resistencia insecticida y que expresan una o más toxinas son KnockOut® (maíz), Yield Gard® (maíz), NuCOTIN33B®
25 (algodón), Bollgard® (algodón), NewLeaf® (papas), NatureGard® y Protexcta®. Las plantas de cultivo y su material de semilla pueden ser resistentes a los herbicidas y al mismo tiempo también alimentan al insecto (eventos transgénicos "apilados"). La

72

semilla puede, por ejemplo, tener la capacidad de expresar una proteína Cry3 insecticidamente activa y al mismo tiempo ser tolerante al glifosato. El término "cultivos" se entiende que también incluye los cultivos obtenidos como un resultado de
5 métodos convencionales de siembra o ingeniería genética que contiene los llamados rasgos de salida (por ejemplo sabor mejorado, estabilidad de almacenamiento, contenido nutricional).

Las áreas bajo el cultivo se entiende que incluyen ly en donde
10 las plantas de cultivo se hacen crecer así como también ly destinado para el cultivo de aquellas plantas de cultivo.

Los compuestos de la Fórmula I de acuerdo con la invención también se pueden utilizar en combinación con herbicidas
15 adicionales. Preferiblemente, en estas mezclas, el compuesto de la fórmula I es uno de aquellos compuestos enumerados en las Tablas 1 a 57 adelante. Las siguientes mezclas del compuesto de a Fórmula I son especialmente importantes:

compuesto de la fórmula I + acetoclor, compuesto de la fórmula I
20 + acifluorfen, compuesto de la fórmula I + acifluorfen-sodio, compuesto de la fórmula I + aclonifen, compuesto de la fórmula I + acroleina, compuesto de la fórmula I + alaclor, compuesto de la fórmula I + aloxidim, compuesto de la fórmula I + alcohol alílico, compuesto de la fórmula I + ametrina, compuesto de la
25 fórmula I + amicarbazona, compuesto de la fórmula I + amidosulfurón, compuesto de la fórmula I + aminopirialid, compuesto de la fórmula I + amitrol, compuesto de la fórmula I + sulfamato de amonio, compuesto de la fórmula I + anilofos,

23

compuesto de la fórmula I + asulam, compuesto de la fórmula I +
atratón, compuesto de la fórmula I + atrazina, compuesto de la
fórmula I + azimsulfurón, compuesto de la fórmula I + BCPC,
compuesto de la fórmula I + beflubutamid, compuesto de la fórmula
5 I + benazolina, compuesto de la fórmula I + benfluralina,
compuesto de la fórmula I + benfuresato, compuesto de la fórmula
I + bensulfurón, compuesto de la fórmula I + bensulfurón-metilo,
compuesto de la fórmula I + bensulida, compuesto de la fórmula I
+ bentazona, compuesto de la fórmula I + benzfendizona, compuesto
10 de la fórmula I + benzobiciclón, compuesto de la fórmula I +
benzofenap, compuesto de la fórmula I + bifenox, compuesto de la
fórmula I + bilanafos, compuesto de la fórmula I + bispiribac,
compuesto de la fórmula I + bispiribac-sodio, compuesto de la
fórmula I + bórax, compuesto de la fórmula I + bromacilo,
15 compuesto de la fórmula I + bromobutida, compuesto de la fórmula
I + bromoxinilo, compuesto de la fórmula I + butaclor, compuesto
de la fórmula I + butafenacilo, compuesto de la fórmula I +
butamifos, compuesto de la fórmula I + butralina, compuesto de la
fórmula I + butroxidim, compuesto de la fórmula I + butilato,
20 compuesto de la fórmula I + ácido cacodílico, compuesto de la
fórmula I + clorato de calcio, compuesto de la fórmula I +
cafenstrol, compuesto de la fórmula I + carbetamida, compuesto de
la fórmula I + carfentrazona, compuesto de la fórmula I +
carfentrazona-etilo, compuesto de la fórmula I + CDEA, compuesto
25 de la fórmula I + CEPC, compuesto de la fórmula I + clorflurenol,
compuesto de la fórmula I + clorflurenol-metilo, compuesto de la
fórmula I + cloridazón, compuesto de la fórmula I + clorimurón,
compuesto de la fórmula I + clorimurón-etilo, compuesto de la

74

fórmula I + ácido cloroacético, compuesto de la fórmula I +
clorotolurón, compuesto de la fórmula I + clorprofam, compuesto
de la fórmula I + clorsulfurón, compuesto de la fórmula I +
clortal, compuesto de la fórmula I + clortal-dimetilo, compuesto
5 de la fórmula I + cinidón-etilo, compuesto de la fórmula I +
cinmetilina, compuesto de la fórmula I + cinosulfurón, compuesto
de la fórmula I + cisanilida, compuesto de la fórmula I +
cletodim, compuesto de la fórmula I + clodinafop, compuesto de la
fórmula I + clodinafop-propargilo, compuesto de la fórmula I +
10 clomazona, compuesto de la fórmula I + clomeprop, compuesto de la
fórmula I + clopiralid, compuesto de la fórmula I + cloransulam,
compuesto de la fórmula I + cloransulam-metilo, compuesto de la
fórmula I + CMA, compuesto de la fórmula I + 4-CPB, compuesto de
la fórmula I + CPMF, compuesto de la fórmula I + 4-CPP, compuesto
15 de la fórmula I + CPPC, compuesto de la fórmula I + cresol,
compuesto de la fórmula I + cumilurón, compuesto de la fórmula I
+ cianamida, compuesto de la fórmula I + cianazina, compuesto de
la fórmula I + cicloato, compuesto de la fórmula I +
ciclosulfamurón, compuesto de la fórmula I + cicloxidim,
20 compuesto de la fórmula I + cihalofof, compuesto de la fórmula I
+ cihalofof-butilo, compuesto de la fórmula I + 2,4-D, compuesto
de la fórmula I + 3,4-DA, compuesto de la fórmula I + daimurón,
compuesto de la fórmula I + dalapón, compuesto de la fórmula I +
dazomet, compuesto de la fórmula I + 2,4-DB, compuesto de la
25 fórmula I + 3,4-DB, compuesto de la fórmula I + 2,4-DEB,
compuesto de la fórmula I + desmedifam, compuesto de la fórmula I
+ dicamba, compuesto de la fórmula I + diclobenilo, compuesto de
la fórmula I + orto-diclorobenceno, compuesto de la fórmula I +

75

para-diclorobenceno, compuesto de la fórmula I + dicloroprop,
compuesto de la fórmula I + dicloroprop-P, compuesto de la fórmula
I + diclofop, compuesto de la fórmula I + diclofop-metilo,
compuesto de la fórmula I + diclosulam, compuesto de la fórmula I
5 + difenzoquat, compuesto de la fórmula I + metilsulfato de
difenzoquat, compuesto de la fórmula I + diflufenican, compuesto
de la fórmula I + diflufenzopir, compuesto de la fórmula I +
dimefurón, compuesto de la fórmula I + dimepiperato, compuesto de
la fórmula I + dimetaclor, compuesto de la fórmula I +
10 dimetametrina, compuesto de la fórmula I + dimetenamid, compuesto
de la fórmula I + dimetenamid-P, compuesto de la fórmula I +
dimetipina, compuesto de la fórmula I + ácido dimetilarlésínico,
compuesto de la fórmula I + dinitramina, compuesto de la fórmula
I + dinoterb, compuesto de la fórmula I + difenamid, compuesto de
15 la fórmula I + diquat, compuesto de la fórmula I + dibromuro de
diquat, compuesto de la fórmula I + ditiopir, compuesto de la
fórmula I + diurón, compuesto de la fórmula I + DNOC, compuesto
de la fórmula I + 3,4-DP, compuesto de la fórmula I + DSMA,
compuesto de la fórmula I + EBEP, compuesto de la fórmula I +
20 endotal, compuesto de la fórmula I + EPTC, compuesto de la
fórmula I + esprocarb, compuesto de la fórmula I + etalfluralina,
compuesto de la fórmula I + etametsulfurón, compuesto de la
fórmula I + etametsulfurón-metilo, compuesto de la fórmula I +
etofumesato, compuesto de la fórmula I + etoxifen, compuesto de
25 la fórmula I + etoxisulfurón, compuesto de la fórmula I +
etobenzanid, compuesto de la fórmula I + fenoxaprop-P, compuesto
de la fórmula I + fenoxaprop-P-etilo, compuesto de la fórmula I +
fenoxasulfona (CAS RN 639826-16-7), compuesto de la fórmula I +

76

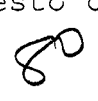
fentrazamida, compuesto de la fórmula I + sulfato ferroso,
compuesto de la fórmula I + flamprop-M, compuesto de la fórmula I
+ flazasulfurón, compuesto de la fórmula I + florasulam,
compuesto de la fórmula I + fluazifop, compuesto de la fórmula I
5 + fluazifop-butilo, compuesto de la fórmula I + fluazifop-P,
compuesto de la fórmula I + fluazifop-P-butilo, compuesto de la
fórmula I + flucarbazona, compuesto de la fórmula I +
flucarbazona-sodio, compuesto de la fórmula I + flucetosulfurón,
compuesto de la fórmula I + flucloralina, compuesto de la fórmula
10 I + flufenacet, compuesto de la fórmula I + flufenpir, compuesto
de la fórmula I + flufenpir-etilo, compuesto de la fórmula I +
flumetsulam, compuesto de la fórmula I + flumiclorac, compuesto
de la fórmula I + flumiclorac-pentilo, compuesto de la fórmula I
+ flumioxazina, compuesto de la fórmula I + fluometurón,
15 compuesto de la fórmula I + fluoroglicofen, compuesto de la
fórmula I + fluoroglicofen-etilo, compuesto de la fórmula I +
flupropanato, compuesto de la fórmula I + flupirsulfurón,
compuesto de la fórmula I + flupirsulfurón-metil-sodio, compuesto
de la fórmula I + flurenol, compuesto de la fórmula I +
20 fluridona, compuesto de la fórmula I + flurocloridona, compuesto
de la fórmula I + fluroxipir, compuesto de la fórmula I +
flurtamona, compuesto de la fórmula I + flutiacet, compuesto de
la fórmula I + flutiacet-metilo, compuesto de la fórmula I +
fomesafen, compuesto de la fórmula I + foramsulfurón, compuesto
25 de la fórmula I + fosamina, compuesto de la fórmula I +
glufosinato, compuesto de la fórmula I + glufosinato-amonio,
compuesto de la fórmula I + glifosato, compuesto de la fórmula I
+ halosulfurón, compuesto de la fórmula I + halosulfurón-metilo,

27

compuesto de la fórmula I + haloxifop, compuesto de la fórmula I + haloxifop-P, compuesto de la fórmula I + HC-252, compuesto de la fórmula I + hexazinona, compuesto de la fórmula I + imazametabenz, compuesto de la fórmula I + imazametabenz-metilo, compuesto de la fórmula I + imazamox, compuesto de la fórmula I + imazapic, compuesto de la fórmula I + imazapir, compuesto de la fórmula I + imazaquina, compuesto de la fórmula I + imazetapir, compuesto de la fórmula I + imazosulfurón, compuesto de la fórmula I + indanofan, compuesto de la fórmula I + yodometano, compuesto de la fórmula I + yodosulfurón, compuesto de la fórmula I + yodosulfurón-metil-sodio, compuesto de la fórmula I + ioxinilo, compuesto de la fórmula I + ipfencarbazona (CAS RN 212201-70-2), compuesto de la fórmula I + isoproturón, compuesto de la fórmula I + isourón, compuesto de la fórmula I + isoxaben, compuesto de la fórmula I + isoxaclortol, compuesto de la fórmula I + isoxaflutol, compuesto de la fórmula I + karbutilato, compuesto de la fórmula I + lactofen, compuesto de la fórmula I + lenacilo, compuesto de la fórmula I + linurón, compuesto de la fórmula I + MAA, compuesto de la fórmula I + MAMA, compuesto de la fórmula I + MCPA, compuesto de la fórmula I + MCPA-tioetilo, compuesto de la fórmula I + MCPB, compuesto de la fórmula I + mecoprop, compuesto de la fórmula I + mecoprop-P, compuesto de la fórmula I + mefenacet, compuesto de la fórmula I + mefluidida, compuesto de la fórmula I + mesosulfurón, compuesto de la fórmula I + mesosulfurón-metilo, compuesto de la fórmula I + mesotriona, compuesto de la fórmula I + metam, compuesto de la fórmula I + metamifop, compuesto de la fórmula I + metamitrón, compuesto de la fórmula I + metazaclor, compuesto de la fórmula I +

metazosulfurón (NC-620, CAS RN 868680-84-6), compuesto de la
fórmula I + metabenzthiazurón, compuesto de la fórmula I +
ácidometilarsónico, compuesto de la fórmula I + metildimrón,
compuesto de la fórmula I + isotiocianato de metilo, compuesto de
5 la fórmula I + metobenzurón, compuesto de la fórmula I +
metolaclor, compuesto de la fórmula I + S-metolaclor, compuesto
de la fórmula I + metosulam, compuesto de la fórmula I +
metoxurón, compuesto de la fórmula I + metribuzina, compuesto de
la fórmula I + metsulfurón, compuesto de la fórmula I +
10 metsulfurón-metilo, compuesto de la fórmula I + MK-616, compuesto
de la fórmula I + molinato, compuesto de la fórmula I +
monolinurón, compuesto de la fórmula I + MSMA, compuesto de la
fórmula I + naproanilida, compuesto de la fórmula I +
napropamida, compuesto de la fórmula I + naptalam, compuesto de
15 la fórmula I + neburón, compuesto de la fórmula I + nicosulfurón,
compuesto de la fórmula I + ácido nonanoico, compuesto de la
fórmula I + norflurazón, compuesto de la fórmula I + ácido oleico
(ácidos grasos), compuesto de la fórmula I + orbencarb, compuesto
de la fórmula I + ortosulfamurón, compuesto de la fórmula I +
20 orizalina, compuesto de la fórmula I + oxadiargilo, compuesto de
la fórmula I + oxadiazón, compuesto de la fórmula I +
oxasulfurón, compuesto de la fórmula I + oxaziclomefona,
compuesto de la fórmula I + oxifluorfen, compuesto de la fórmula
I + paraquat, compuesto de la fórmula I + dicloruro de paraquat,
25 compuesto de la fórmula I + pebulato, compuesto de la fórmula I +
pendimetalina, compuesto de la fórmula I + penoxsulam, compuesto
de la fórmula I + pentaclorofenol, compuesto de la fórmula I +
pentanoclor, compuesto de la fórmula I + pentoxazona, compuesto

de la fórmula I + petoxamid, compuesto de la fórmula I + aceites
de petróleo, compuesto de la fórmula I + fenmedifam, compuesto de
la fórmula I + fenmedifam-etilo, compuesto de la fórmula I +
picloram, compuesto de la fórmula I + picolinafen, compuesto de
5 la fórmula I + pinoxaden, compuesto de la fórmula I + piperofos,
compuesto de la fórmula I + potassium arsenite, compuesto de la
fórmula I + potassium azida, compuesto de la fórmula I +
pretilaclor, compuesto de la fórmula I + primisulfurón, compuesto
de la fórmula I + primisulfurón-metilo, compuesto de la fórmula I
10 + prodiamina, compuesto de la fórmula I + profluazol, compuesto
de la fórmula I + profoxidim, compuesto de la fórmula I +
prometón, compuesto de la fórmula I + prometrina, compuesto de la
fórmula I + propaclor, compuesto de la fórmula I + propanilo,
compuesto de la fórmula I + propaquizafof, compuesto de la
15 fórmula I + propazina, compuesto de la fórmula I + profam,
compuesto de la fórmula I + propisoclor, compuesto de la fórmula
I + propoxicarbazona, compuesto de la fórmula I +
propoxicarbazona-sodio, compuesto de la fórmula I +
propirisulfurón (TH-547, CAS RN 570415-88-2), compuesto de la
20 fórmula I + propizamida, compuesto de la fórmula I +
prosulfocarb, compuesto de la fórmula I + prosulfurón, compuesto
de la fórmula I + piraclonilo, compuesto de la fórmula I +
piraflufen, compuesto de la fórmula I + piraflufen-etilo,
compuesto de la fórmula I + pirazolinato, compuesto de la fórmula
25 I + pirazosulfurón, compuesto de la fórmula I + pirazosulfurón-
etilo, compuesto de la fórmula I + pirazoxifen, compuesto de la
fórmula I + piribenzoxim, compuesto de la fórmula I +
piributicarb, compuesto de la fórmula I + piridafol, compuesto de



la fórmula I + piridato, compuesto de la fórmula I + piriftalid,
compuesto de la fórmula I + piriminobac, compuesto de la fórmula
I + piriminobac-metilo, compuesto de la fórmula I + pirimisulfan,
compuesto de la fórmula I + piritiobac, compuesto de la fórmula I
5 + piritiobac-sodio, compuesto de la fórmula I + quinclorac,
compuesto de la fórmula I + quinmerac, compuesto de la fórmula I
+ quinoclamina, compuesto de la fórmula I + quizalofop, compuesto
de la fórmula I + quizalofop-P, compuesto de la fórmula I +
rimsulfurón, compuesto de la fórmula I + setoxidim, compuesto de
10 la fórmula I + sidurón, compuesto de la fórmula I + simazina,
compuesto de la fórmula I + simetrina, compuesto de la fórmula I
+ SMA, compuesto de la fórmula I + arsenita de sodio, compuesto
de la fórmula I + azida de sodio, compuesto de la fórmula I +
clorato de sodio, compuesto de la fórmula I + sulcotriona,
15 compuesto de la fórmula I + sulfentrazona, compuesto de la
fórmula I + sulfometurón, compuesto de la fórmula I +
sulfometurón-metilo, compuesto de la fórmula I + sulfosato,
compuesto de la fórmula I + sulfosulfurón, compuesto de la
fórmula I + ácido sulfúrico, compuesto de la fórmula I + aceites
20 de alquitrán, compuesto de la fórmula I + 2,3,6-TBA, compuesto de
la fórmula I + TCA, compuesto de la fórmula I + TCA-sodio,
compuesto de la fórmula I + tebutiurón, compuesto de la fórmula I
+ tepraloxidim, compuesto de la fórmula I + terbacilo, compuesto
de la fórmula I + terbumetón, compuesto de la fórmula I +
25 terbutilazina, compuesto de la fórmula I + terbutrina, compuesto
de la fórmula I + tenilclor, compuesto de la fórmula I +
tiazopir, compuesto de la fórmula I + tifensulfurón, compuesto de
la fórmula I + tifensulfurón-metilo, compuesto de la fórmula I +

tiobencarb, compuesto de la fórmula I + tiocarbazilo, compuesto de la fórmula I + topramezona, compuesto de la fórmula I + tralcoxidim, compuesto de la fórmula I + tri-alato, compuesto de la fórmula I + triasulfurón, compuesto de la fórmula I + triaziflam, compuesto de la fórmula I + tribenurón, compuesto de la fórmula I + tribenurón-metilo, compuesto de la fórmula I + tricamba, compuesto de la fórmula I + triclopir, compuesto de la fórmula I + trietazina, compuesto de la fórmula I + trifloxisulfurón, compuesto de la fórmula I + trifloxisulfurón-sodio, compuesto de la fórmula I + trifluralina, compuesto de la fórmula I + triflusulfurón, compuesto de la fórmula I + triflusulfurón-metilo, compuesto de la fórmula I + trihidroxitriazina, compuesto de la fórmula I + tritosulfurón, compuesto de la fórmula I + éster de etilo de ácido [3-[2-cloro-4-fluoro-5-(1-metil-6-trifluorometil-2,4-dioxo-1,2,3,4-tetrahidropirimidin-3-il)fenoxi]-2-piridiloxi]acéico (CAS RN 353292-31-6), compuesto de la fórmula I + ácido 4-[(4,5-dihidro-3-metoxi-4-metil-5-oxo)-1H-1,2,4-triazol-1-ilcarbonilsulfamoil]-5-metiltiofeno-3-carboxílico (BAY636), compuesto de la fórmula I + BAY747 (CAS RN 335104-84-2), compuesto de la fórmula I + topramezona (CAS RN 210631-68-8), compuesto de la fórmula I + 4-hidroxi-3-[[2-[(2-metoxietoxi)-metil]-6-(trifluoro-metil)-3-piridinil]carbonil]-biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona (CAS RN 352010-68-5), y compuesto de la fórmula I + 4-hidroxi-3-[[2-(3-metoxipropil)-6-(difluoro-metil)-3-piridinil]carbonil]-biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona.

Los socios de mezcla para el compuesto de la fórmula I también pueden estar en la forma de ésteres o sales, como se menciona por ejemplo en The Pesticide Manual, 12th Edition (BCPC) 2000.

- 5 Para aplicaciones en cereales, se prefieren las siguientes mezclas: compuesto de la fórmula I + aclonifen, compuesto de la fórmula I + amidosulfurón, compuesto de la fórmula I + aminopirialid, compuesto de la fórmula I + beflubutamid, compuesto de la fórmula I + benfluralina, compuesto de la fórmula I + bifenox, compuesto de la fórmula I + bromoxinilo, compuesto de la fórmula I + butafenacilo, compuesto de la fórmula I + carbetamida, compuesto de la fórmula I + carfentrazona, compuesto de la fórmula I + carfentrazona-etilo, compuesto de la fórmula I + clorotolurón, compuesto de la fórmula I + clorprofam, compuesto de la fórmula I + clorsulfurón, compuesto de la fórmula I + cinidón-etilo, compuesto de la fórmula I + clodinafop, compuesto de la fórmula I + clodinafop-propargilo, compuesto de la fórmula I + clopiralid, compuesto de la fórmula I + 2,4-D, compuesto de la fórmula I + dicamba, compuesto de la fórmula I + diclobenilo, compuesto de la fórmula I + diclorprop, compuesto de la fórmula I + diclofop, compuesto de la fórmula I + diclofop-metilo, compuesto de la fórmula I + difenzoquat, compuesto de la fórmula I + metilsulfato de difenzoquat, compuesto de la fórmula I + diflufenican, compuesto de la fórmula I + diquat, compuesto de la fórmula I + dibromuro de diquat, compuesto de la fórmula I + fenoxaprop-P, compuesto de la fórmula I + fenoxaprop-P-etilo, compuesto de la fórmula I + flamprop-M, compuesto de la fórmula I + florasulam, compuesto de la fórmula I + fluazifop-P-butilo,

compuesto de la fórmula I + flucarbazona, compuesto de la fórmula I + flucarbazona-sodio, compuesto de la fórmula I + flufenacet, compuesto de la fórmula I + flupirsulfurón, compuesto de la fórmula I + flupirsulfurón-metil-sodio, compuesto de la fórmula I + flurocloridona, compuesto de la fórmula I + fluroxipir, compuesto de la fórmula I + flurtamona, compuesto de la fórmula I + imazametabenz-metilo, compuesto de la fórmula I + imazamox, compuesto de la fórmula I + yodosulfurón, compuesto de la fórmula I + yodosulfurón-metil-sodio, compuesto de la fórmula I + ioxinilo, compuesto de la fórmula I + isoproturón, compuesto de la fórmula I + linurón, compuesto de la fórmula I + MCPA, compuesto de la fórmula I + mecoprop, compuesto de la fórmula I + mecoprop-P, compuesto de la fórmula I + mesosulfurón, compuesto de la fórmula I + mesosulfurón-metilo, compuesto de la fórmula I + mesotriona, compuesto de la fórmula I + metribuzina, compuesto de la fórmula I + metsulfurón, compuesto de la fórmula I + metsulfurón-metilo, compuesto de la fórmula I + pendimetalina, compuesto de la fórmula I + picolinafen, compuesto de la fórmula I + pinoxaden, compuesto de la fórmula I + prodiamina, compuesto de la fórmula I + propanilo, compuesto de la fórmula I + propoxicarbazona, compuesto de la fórmula I + propoxicarbazona-sodio, compuesto de la fórmula I + prosulfocarb, compuesto de la fórmula I + pirasulfotol, compuesto de la fórmula I + piridato, compuesto de la fórmula I + piroxasulfona (KIH-485), compuesto de la fórmula I + piroxsulam compuesto de la fórmula I + sulfosulfurón, compuesto de la fórmula I + tembotriona, compuesto de la fórmula I + terbutrina, compuesto de la fórmula I + tifensulfurón, compuesto de la fórmula I + tienicarbazona,

81

compuesto de la fórmula I + tifensulfurón-metilo, compuesto de la
fórmula I + topramezona, compuesto de la fórmula I + tralcoxidim,
compuesto de la fórmula I + tri-alato, compuesto de la fórmula I
+ triasulfurón, compuesto de la fórmula I + tribenurón, compuesto
5 de la fórmula I + tribenurón-metilo, compuesto de la fórmula I +
trifluralina, compuesto de la fórmula I + trinexapac-etilo y
compuesto de la fórmula I + tritosulfurón, donde las mezclas que
comprenden un compuesto de la fórmula (I) + amidosulfurón,
compuesto de la fórmula (I) + aminopirialid, compuesto de la
10 fórmula (I) + beflubutamid, compuesto de la fórmula (I) +
bromoxinilo, compuesto de la fórmula (I) + carfentrazona,
compuesto de la fórmula (I) + carfentrazona-etilo, compuesto de
la fórmula (I) + clorotolurón, compuesto de la fórmula (I) +
clorsulfurón, compuesto de la fórmula (I) + clodinafop, compuesto
15 de la fórmula (I) + clodinafop-propargilo, compuesto de la
fórmula (I) + clopiralid, 2,4-D, compuesto de la fórmula (I) +
dicamba, compuesto de la fórmula (I) + difenzoquat, compuesto de
la fórmula (I) + metilsulfato de difenzoquat, compuesto de la
fórmula (I) + diflufenican, compuesto de la fórmula (I) +
20 fenoxaprop-P, compuesto de la fórmula (I) + fenoxaprop-P-etilo,
compuesto de la fórmula (I) + florasulam, compuesto de la fórmula
(I) + flucarbazona, compuesto de la fórmula (I) + flucarbazona-
sodio, compuesto de la fórmula (I) + flufenacet, compuesto de la
fórmula (I) + flupirsulfurón, compuesto de la fórmula (I) +
25 flupirsulfurón-metil-sodio, compuesto de la fórmula (I) +
fluroxipir, compuesto de la fórmula (I) + flurtamona, compuesto
de la fórmula (I) + yodosulfurón, compuesto de la fórmula (I) +
yodosulfurón-metil-sodio, compuesto de la fórmula (I) + MCPA,

85

compuesto de la fórmula (I) + mesosulfurón, compuesto de la
fórmula (I) + mesosulfurón-metilo, compuesto de la fórmula (I) +
metsulfurón, compuesto de la fórmula (I) + metsulfurón-metilo,
compuesto de la fórmula (I) + pendimetalina, compuesto de la
5 fórmula (I) + picolinafen, compuesto de la fórmula (I) +
pinoxaden, compuesto de la fórmula (I) + prosulfocarb, compuesto
de la fórmula (I) + pirasulfotol, compuesto de la fórmula (I) +
piroxasulfona (KIH-485), compuesto de la fórmula (I) +
piroxsulam, compuesto de la fórmula (I) + sulfosulfurón,
10 compuesto de la fórmula (I) + tifensulfurón, compuesto de la
fórmula (I) + tifensulfurón-metilo, compuesto de la fórmula (I) +
tralcoxidim, compuesto de la fórmula (I) + triasulfurón,
compuesto de la fórmula (I) + tribenurón, compuesto de la fórmula
(I) + tribenurón-metilo, compuesto de la fórmula (I) +
15 trifluralina, compuesto de la fórmula (I) + trinexapac-etilo y
compuesto de la fórmula (I) + tritosulfurón particularmente se
prefieren.

Para aplicaciones en arroz, se prefieren las siguientes mezclas:
20 compuesto de la fórmula (I) + azimsulfurón, compuesto de la
fórmula (I) + bensulfurón, compuesto de la fórmula (I) +
bensulfurón-metilo, compuesto de la fórmula (I) + benzobiciclón,
compuesto de la fórmula (I) + benzofenap, compuesto de la fórmula
(I) + bispiribac, compuesto de la fórmula (I) + bispiribac-sodio,
25 compuesto de la fórmula (I) + butaclor, compuesto de la fórmula
(I) + cafenstrol, compuesto de la fórmula (I) + cinosulfurón,
compuesto de la fórmula (I) + clomazona, compuesto de la fórmula
(I) + clomeprop, compuesto de la fórmula (I) + ciclosulfamurón,

compuesto de la fórmula (I) + cihalofop, compuesto de la fórmula (I) + cihalofop-butilo, compuesto de la fórmula (I) + 2,4-D, compuesto de la fórmula (I) + daimurón, compuesto de la fórmula (I) + dicamba, compuesto de la fórmula (I) + diquat, compuesto de la fórmula (I) + dibromuro de diquat, compuesto de la fórmula (I) + esprocarb, compuesto de la fórmula (I) + etoxisulfurón, compuesto de la fórmula (I) + fenoxaprop-P, compuesto de la fórmula (I) + fenoxaprop-P-etilo, compuesto de la fórmula I + fenoxasulfona (CAS RN 639826-16-7), compuesto de la fórmula (I) + fentrazamida, compuesto de la fórmula (I) + florasulam, compuesto de la fórmula (I) + glufosinato-amonio, compuesto de la fórmula (I) + glifosato, compuesto de la fórmula (I) + halosulfurón, compuesto de la fórmula (I) + halosulfurón-metilo, compuesto de la fórmula (I) + imazosulfurón, compuesto de la fórmula I + ipfencarbazona (CAS RN 212201-70-2), compuesto de la fórmula (I) + MCPA, compuesto de la fórmula (I) + mefenacet, compuesto de la fórmula (I) + mesotriona, compuesto de la fórmula (I) + metamifop, compuesto de la fórmula I + metazosulfurón (NC-620, CAS RN 868680-84-6), compuesto de la fórmula (I) + metsulfurón, compuesto de la fórmula (I) + metsulfurón-metilo, compuesto de la fórmula (I) + n-metil glifosato, compuesto de la fórmula (I) + ortosulfamurón, compuesto de la fórmula (I) + orizalina, compuesto de la fórmula (I) + oxadiargilo, compuesto de la fórmula (I) + oxadiazón, compuesto de la fórmula (I) + dicloruro de paraquat, compuesto de la fórmula (I) + pendimetalina, compuesto de la fórmula (I) + penoxsulam, compuesto de la fórmula (I) + pretilaclor, compuesto de la fórmula (I) + profoxidim, compuesto de la fórmula (I) + propanilo, compuesto de la fórmula

I + propirisulfurón (TH-547, CAS RN 570415-88-2), compuesto de la fórmula (I) + pirazolinato, compuesto de la fórmula (I) + pirazosulfurón, compuesto de la fórmula (I) + pirazosulfurón-etilo, compuesto de la fórmula (I) + pirazoxifen, compuesto de la
5 fórmula (I) + piribenzoxim, compuesto de la fórmula (I) + piriftalid, compuesto de la fórmula (I) + piriminobac, compuesto de la fórmula (I) + piriminobac-metilo, compuesto de la fórmula (I) + pirimisulfan, compuesto de la fórmula (I) + quinclorac, compuesto de la fórmula (I) + tefuriltriona, compuesto de la
10 fórmula (I) + triasulfurón y compuesto de la fórmula (I) + trinexapac-etilo, donde las mezclas que comprenden un compuesto de la fórmula (I) + azimsulfurón, compuesto de la fórmula (I) + bensulfurón, compuesto de la fórmula (I) + bensulfurón-metilo, compuesto de la fórmula (I) + benzobiciclón, compuesto de la
15 fórmula (I) + benzofenap, compuesto de la fórmula (I) + bispiribac, compuesto de la fórmula (I) + bispiribac-sodio, compuesto de la fórmula (I) + clomazona, compuesto de la fórmula (I) + clomeprop, compuesto de la fórmula (I) + cihalofop, compuesto de la fórmula (I) + cihalofop-butilo, compuesto de la
20 fórmula (I) + 2,4-D, compuesto de la fórmula (I) + daimurón, compuesto de la fórmula (I) + dicamba, compuesto de la fórmula (I) + esprocarb, compuesto de la fórmula (I) + etoxisulfurón, compuesto de la fórmula (I) + fenoxaprop-P, compuesto de la fórmula (I) + fenoxaprop-P-etilo, compuesto de la fórmula I +
25 fenoxasulfona (CAS RN 639826-16-7), compuesto de la fórmula (I) + fentrazamida, compuesto de la fórmula (I) + florasulam, compuesto de la fórmula (I) + halosulfurón, compuesto de la fórmula (I) + halosulfurón-metilo, compuesto de la fórmula (I) + imazosulfurón,

compuesto de la fórmula I + ipfencarbazona (CAS RN 212201-70-2),
compuesto de la fórmula (I) + MCPA, compuesto de la fórmula (I) +
mefenacet, compuesto de la fórmula (I) + mesotriona, compuesto de
la fórmula I + metazosulfurón (NC-620, CAS RN 868680-84-6),
5 compuesto de la fórmula (I) + metsulfurón, compuesto de la
fórmula (I) + metsulfurón-metilo, compuesto de la fórmula (I) +
ortosulfamurón, compuesto de la fórmula (I) + oxadiargilo,
compuesto de la fórmula (I) + oxadiazón, compuesto de la fórmula
(I) + pendimetalina, compuesto de la fórmula (I) + penoxsulam,
10 compuesto de la fórmula (I) + pretilaclor, compuesto de la
fórmula I + propirisulfurón (TH-547, CAS RN 570415-88-2),
compuesto de la fórmula (I) + pirazolinato, compuesto de la
fórmula (I) + pirazosulfurón, compuesto de la fórmula (I) +
pirazosulfurón-etilo, compuesto de la fórmula (I) + pirazoxifen,
15 compuesto de la fórmula (I) + piribenzoxim, compuesto de la
fórmula (I) + piriftalid, compuesto de la fórmula (I) +
piriminobac, compuesto de la fórmula (I) + piriminobac-metilo,
compuesto de la fórmula (I) + pirimisulfan, compuesto de la
fórmula (I) + quinclorac, compuesto de la fórmula (I) +
20 tefuriltriona, compuesto de la fórmula (I) + triasulfurón y
compuesto de la fórmula (I) + trinexapac-etilo particularmente se
prefieren.

También se pueden utilizar los compuestos de la fórmula I de
25 acuerdo con la invención en combinación con protectores.
Preferiblemente, en estas mezclas, el compuesto de la fórmula I
es uno de aquellos compuestos enumerados en la Tablas 1 a 57

adelante. Las siguientes mezclas con protectores, especialmente, se toman en consideración:

compuesto de la fórmula I + cloquintocet-mexilo, compuesto de la fórmula I + ácido de cloquintocet y sales de lo mismos, compuesto
5 de la fórmula I + fenclorazol-etilo, compuesto de la fórmula I + ácido de fenclorazol y sales de lo mismos, compuesto de la fórmula I + mefenpir-dietilo, compuesto de la fórmula I + diácido de mefenpir, compuesto de la fórmula I + isoxadifen-etilo, compuesto de la fórmula I + ácido de isoxadifen, compuesto de la
10 fórmula I + furilazol, compuesto de la fórmula I + isómero R de furilazol, compuesto de la fórmula (I) + N-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida, compuesto de la fórmula I + benoxacor, compuesto de la fórmula I + diclormid, compuesto de la fórmula I + AD-67, compuesto de la fórmula I +
15 oxabetrinilo, compuesto de la fórmula I + ciometrinilo, compuesto de la fórmula I + isómero z de ciometrinilo, compuesto de la fórmula I + fenclorim, compuesto de la fórmula I + ciprosulfamida, compuesto de la fórmula I + anhídrido naftálico, compuesto de la fórmula I + flurazol, compuesto de la fórmula I +
20 CI 304,415, compuesto de la fórmula I + diciclonón, compuesto de la fórmula I + fluxofenim, compuesto de la fórmula I + DKA-24, compuesto de la fórmula I + R-29148 y compuesto de la fórmula I + PPG-1292. También se puede observar un efecto protector para las mezclas del compuesto de la fórmula I + dimrón, compuesto de la
25 fórmula I + MCPA, compuesto de la fórmula I + mecoprop y compuesto de la fórmula I + mecoprop-P.

Los protectores y herbicidas mencionados anteriormente se describen, por ejemplo, en the Pesticide Manual, Twelfth Edition, British Crop Protection Council, 2000. R-29148 se describe, por ejemplo por P.B. Goldsbrough et al., Plant Physiology, (2002),
5 Vol. 130 pp. 1497-1505 y las referencias allí, PPG-1292 se conoce de la WO09211761 y N-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida se conoce de la EP365484.

Se prefieren especialmente Benoxacor, cloquintocet-mexilo,
10 ciprosulfamida, mefenpir-diétilo y N-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida, donde el cloquintocet-mexilo es particularmente valioso.

El índice de aplicación del protector relacionado con el
15 herbicida es mayormente dependiente del modo de aplicación. En el caso de tratamiento de campo, se aplican generalmente de 0.001 a 5.0 kg de protector/ha, preferiblemente de 0.001 a 0.5 kg de protector/ha, y generalmente de 0.001 a 2 kg de herbicida/ha, pero preferiblemente de 0.005 a 1 kg/ha.

20 Las composiciones herbicidas de acuerdo con la invención son adecuadas para todos los métodos de aplicación habituales en la agricultura, tal como, por ejemplo, aplicación pre-emergencia, aplicación post-emergencia y recubrimiento de semillas.
25 Dependiendo del uso pretendido, se pueden utilizar protectores para pretratar el material de semilla de la planta de cultivo (recubrimiento de semillas o plántulas) o introducir en el suelo antes o después de siembra, seguido por la aplicación (no

91

protectora) del compuesto de la fórmula (I), opcionalmente en combinación con un co-herbicida. Este, sin embargo, también se puede aplicar solo o junto con el herbicida antes o después de emergencia de las plantas. El tratamiento de las plantas o el material de semilla con el protector pueden por lo tanto tener lugar en principio independientemente del tiempo de aplicación del herbicida. Se prefiere de manera general el tratamiento de la planta mediante aplicación simultánea del herbicida y protector (por ejemplo en la forma de una mezcla en tanque). El índice de aplicación del protector con relación al herbicida es más dependiente del modo de aplicación. En el caso de tratamiento de campo, se aplican generalmente de 0.001 a 5.0 kg de protector/ha, preferiblemente de 0.001 a 0.5 kg de protector/ha. En el caso de recubrimiento de semillas, se aplica generalmente de 0.001 a 10 g de protector/kg de semilla, preferiblemente de 0.05 a 2 g de protector/kg de semilla. Cuando se aplica el protector en forma líquida, con semilla remojada, brevemente antes de siembra, es ventajoso utilizar soluciones protectoras que contienen el ingrediente activo en una concentración de 1 a 10000 ppm, preferiblemente de 100 a 1000 ppm.

Se prefiere aplicar el otro herbicida junto con uno de los protectores mencionados anteriormente.

Los siguientes Ejemplos ilustran la invención adicionalmente pero no limitan la invención.

Ejemplos de Preparación:

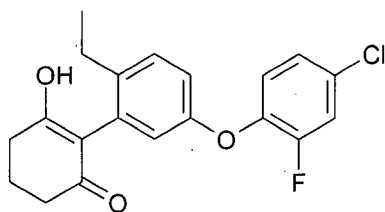
92

Aquellos expertos en la técnica apreciarán que ciertos compuestos descritos adelante son β -cetoenoles, y como tal pueden existir como un tautómero único o como una mezcla de tautómeros ceto-enol y dicetona, como se describe, por ejemplo por J. March, Advanced Organic Chemistry, tercera edición, John Wiley and Sons. Los compuestos mostrados adelante, y en la Tabla T1 se bosquejan como un tautómero enol único arbitrario, pero se debe inferir que esta descripción cubre la forma dicetona y cualesquier enoles posibles que puedan surgir a través del tautomerismo. En donde se observa más de un tautómero en RMN de protón, los datos mostrados son la mezcla de tautómeros. Adicionalmente, algunos de los compuestos mostrados adelante se bosquejan como enantiómeros únicos para los propósitos de simplicidad, pero a menos que se especifique como enantiómeros únicos, estas estructuras se deben construir como que representan una mezcla de enantiómeros en cualquier relación. Adicionalmente, algunos de los compuestos pueden existir como diastereoisómeros, y se debe inferir que estos pueden estar presentes como un diastereoisómero único o como una mezcla de diastereoisómeros en cualquier relación. Dentro de la sección experimental detallada el tautómero dicetona se selecciona para efectos de nombrar, aún si el tautómero predominante es la forma enol.

25 Ejemplo 1

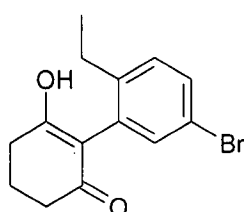
Preparación de 2-[5-(4-cloro-2-fluorofenoxi)-2-etilfenil]ciclohexano-1,3-diona

93



Etapa 1: Preparación de 2-(5-bromo-2-etilfenil)ciclohexano-1,3-diona

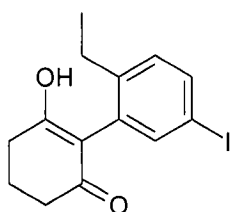
5



A una solución de triacetato de 5-bromo-2-etilfenilplomo (20.00 g, 35.2 mmol) (descrito en la WO08/071405) en cloroformo (100 ml) se agrega ciclohexano-1,3-diona (3.94 g, 35.2 mmol) y 4-
10 dimetilaminopiridina (22.36 g, 176 mmol). Después de agitar la reacción a temperatura ambiente durante 5 minutos se agrega tolueno (50 ml) y la solución se calienta a 80° C durante 4 horas. Después de enfriar a temperatura ambiente se deja reposar la mezcla durante la noche, seguido por tratamiento con ácido
15 clorhídrico acuoso 2M. Después de filtración del precipitado se separa la solución bifásica, y la fase acuosa se extrae de nuevo con diclorometano (x 2). Las fracciones orgánicas se combinan, luego se evaporan bajo presión reducida para producir un producto crudo que se purifica mediante cromatografía de columna flash
20 (10% de acetato de etilo/hexano a 70% de eluyente acetato de etilo/hexano) para proporcionar 2-(5-bromo-2-etilfenil)ciclohexano-1,3-diona como un sólido blanco.

94

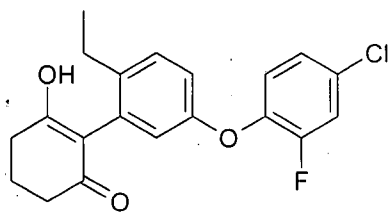
Etapa 2: Preparación de 2-(2-etil-5-yodofenil)ciclohexano-1,3-diona



5

A una mezcla de 2-(5-bromo-2-etilfenil)ciclohexano-1,3-diona (0.917 g, 3.11 mmol), yoduro de sodio (0.934 g, 6.23 mmol) y hexametildisilazano (0.454 g, 3.11 mmol) se agrega yoduro de cobre (I) (0.030 g, 0.15 mmol) y *trans*-*N,N*-dimetil-1,2-ciclohexano diamina (0.044 g, 0.31 mmol). Se agrega dioxano desgasificado (5 ml) y la mezcla se purga con nitrógeno luego se calienta a 180° C durante 1 hora bajo irradiación de microondas. Después de enfriar a temperatura ambiente la mezcla de reacción se trata con ácido clorhídrico acuoso 2M y se extrae con diclorometano. Las fases se separan y la fase acuosa se extrae adicionalmente con diclorometano. Las fracciones orgánicas se combinan, luego se evaporan bajo presión reducida para producir un producto crudo que se purifica mediante cromatografía de columna flash (10% de acetato de etilo/hexano a 70% de eluyente acetato de etilo/hexano) para proporcionar 2-(2-etil-5-yodofenil)ciclohexano-1,3-diona como una espuma blanca.

Etapa 3: Preparación de 2-[5-(4-cloro-2-fluorofenoxi)-2-etilfenil]ciclohexano-1,3-diona

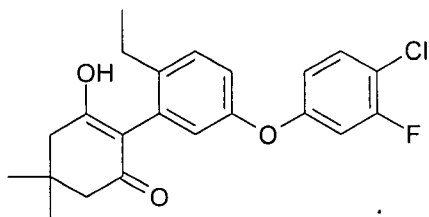


A una mezcla de 2-(2-etil-5-yodofenil)ciclohexano-1,3-diona (0.250 g, 0.73 mmol), 4-cloro-2-fluorofenol (0.535 g, 3.65 mmol) y carbonato de cesio (0.477 g, 1.46 mmol) se agrega tamices
5 moleculares en polvo de 3Å (0.300 g) y trifluorometanosulfonato de cobre (II) (0.012 g, 0.037mmol). Después de desgasificar con nitrógeno anhidro se agrega tolueno (4 ml), y la suspensión se calienta a 160° C durante 1 hora bajo irradiación de microondas. La mezcla de reacción se acidifica con ácido clorhídrico acuoso
10 2M y se extrae con diclorometano (x 2). La fase orgánica se separa, luego se evapora bajo presión reducida para producir un producto crudo que se purifica mediante HPLC de fase inversa preparativo para proporcionar 2-[5-(4-cloro-2-fluoro-fenoxi)-2-etilfenil]ciclohexano-1,3-diona.

15

Ejemplo 2

Preparación de 2-[5-(4-cloro-3-fluorofenoxi)-2-etilfenil]-5,5-
dimetilciclohexano-1,3-diona



20

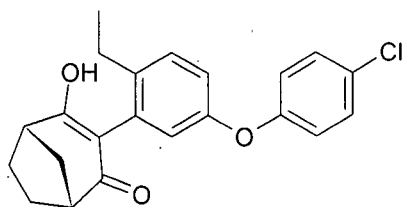
A una mezcla de 2-(5-bromo-2-etilfenil)-5,5-dimetilciclohexano-1,3-diona (0.236 g, 0.73 mmol), carbonato de cesio (0.477 g, 1.46

ab

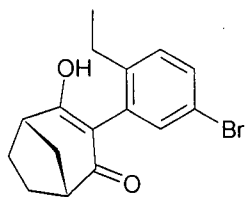
mmol), 4-cloro-3-fluorofenol (0.535 g, 3.65 mmol), trifluorometanosulfonato de cobre (II) (0.012 g, 0.04 mmol) y tamices moleculares en polvo de 3Å (0.300 g) se agrega tolueno anhidro (4 ml). Después de purgar con nitrógeno la mezcla de
5 reacción se calienta a 170° C durante 1 hora bajo irradiación de microondas, luego se deja enfriar a temperatura ambiente. Después de apagar con ácido clorhídrico acuoso 2M el producto crudo se extrae en diclorometano (x 2) y las fases se separan. Los disolventes orgánicos se eliminan *in vacuo* y el producto crudo se
10 purifica mediante HPLC de fase inversa preparativo para proporcionar 2-[5-(4-cloro-3-fluorofenoxi)-2-etilfenil]-5,5-dimetilciclohexano-1,3-diona como un sólido blanco.

Ejemplo 3

15 Preparación de meso-(1R,5S)-3-[5-(4-clorofenoxi)-2-etilfenil]biciclo[3.2.1]octano-2,4-diona



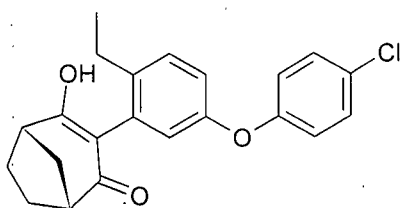
Etapa 1: Preparación de 3-(5-bromo-2-etilfenil)biciclo[3.2.1]octano-2,4-diona
20



97

A una solución de triacetato de 5-bromo-2-etilfenilplomo (16.34 g, 28.80 mmol) en cloroformo (160 ml) se agrega biciclo[3.2.1]octano-2,4-diona (3.61 g, 26.10 mmol) y 4-dimetilaminopiridina (16.63 g, 131 mmol), y la mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante 5 minutos. Luego se agrega tolueno (40 ml), y la mezcla se agita a 80° C durante 1 hora (baño de aceite pre-calentado). La mezcla de reacción se deja enfriar a temperatura ambiente, se apaga con ácido clorhídrico 1M, y la fase orgánica se separa. La fase acuosa se lava adicionalmente con diclorometano (x 2), y de nuevo se separan las fases. Todos los orgánicos se combinan, luego se evaporan bajo presión reducida para dar un aceite crudo, que se purifica mediante cromatografía de columna flash sobre gel de sílice (relación 30% a 50% de eluyente acetato de etilo/iso-hexano, luego relación de 10% de metanol/diclorometano). La goma resultante luego se recrystaliza a partir de diclorometano/hexano para proporcionar 3-(5-bromo-2-etilfenil)biciclo[3.2.1]octano-2,4-diona como un sólido de color crema.

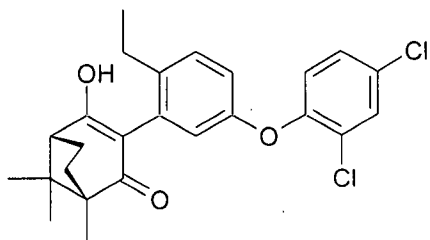
20 Etapa 2: Preparación de meso-(1R,5S)-3-[5-(4-clorofenoxi)-2-etilfenil]biciclo[3.2.1]octano-2,4-diona



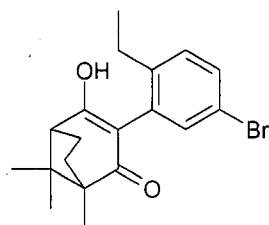
A una mezcla de 3-(5-bromo-2-etilfenil)biciclo[3.2.1]octano-2,4-diona (0.200 g, 0.62 mmol), carbonato de cesio (0.406 g, 1.25 mmol) y 4-clorofenol (0.400 g, 3.12 mmol) se agrega trifluorometanosulfonato de cobre (II) (0.011g, 0.03 mmol) y
5 tamices moleculares en polvo de 3Å (0.300 g). Luego se agrega tolueno anhidro desgasificado (2ml) seguido de una purga con nitrógeno luego se calienta a 170° C durante 1 hora bajo irradiación de microondas. Después de enfriar a temperatura ambiente la mezcla se acidifica con ácido clorhídrico acuoso 2M y
10 se extrae con diclorometano (1:2). La fase orgánica se separa, luego se concentra bajo vacío. El producto crudo luego se purifica mediante HPLC de fase inversa preparativo y adicionalmente cromatografía de columna flash (10% de acetato de etilo/hexano a 70% de eluyente acetato de etilo/hexano) para
15 proporcionar *meso*-(1R,5S)-3-[5-(4-clorofenoxi)-2-etilfenil]biciclo[3.2.1]octano-2,4-diona como un sólido blanco.

Ejemplo 4

Preparación de *rac*-(1S,5R)-3-[5-(2,4-diclorofenoxi)-2-etilfenil]-
20 1,8,8-trimetilbiciclo[3.2.1]octano-2,4-diona

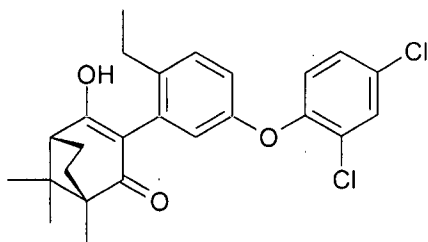


Etapa 1: Preparación de *rac*-3-(5-bromo-2-etilfenil)-1,8,8-trimetilbiciclo[3.2.1]octano-2,4-diona



Una solución de 1,8,8-trimetilbicyclo[3.2.1]octano-2,4-diona (0.22 g, 1.22 mmol) (preparación descrita por H. Favre et al.,
5 Can. J. Chem. (1956), 34 1329-39.) en cloroformo seco (10 ml) se agita a temperatura ambiente luego se enjuaga bien con nitrógeno. A esta mezcla luego se agrega 4-dimetilaminopiridina (0.744 g, 6.15 mmol) y tolueno anhidro (3 ml), seguido por calentamiento a 80°C. Se agrega triacetato de 5-bromo-2-etilfenilplomo (0.673 g,
10 1.18 mmol) en forma de porción durante 10 minutos, y la mezcla se calienta adicionalmente a esta temperatura durante unas 4 horas adicionales luego se deja reposar durante la noche. Se agrega ácido clorhídrico 2M (10 ml), y la mezcla bifásica resultante se filtra para eliminar cualesquier sales inorgánicas (lavado con
15 diclorometano adicional, 10 ml). La fase orgánica se separa, y la fase acuosa se extrae de nuevo con diclorometano (10 ml x2). Todas las fracciones orgánicas se combinan, se secan sobre sulfato de magnesio, se filtran y el filtrado se concentra bajo presión reducida para dar una goma naranja. Este producto crudo
20 se purifica mediante cromatografía de columna flash sobre gel de sílice (relación de 100% a 40% de eluyente hexano/acetato de etilo) para proporcionar rac-3-(5-bromo-2-etilfenil)-1,8,8-trimetilbicyclo[3.2.1]octano-2,4-diona como una goma incolora.

Etapa 2: Preparación de *rac*-(1*S*,5*R*)-3-[5-(2,4-diclorofenoxi)-2-etilfenil]-1,8,8-trimetilbiciclo[3.2.1]octano-2,4-diona



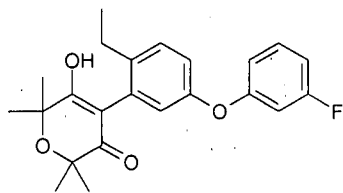
5 A una mezcla de *rac*-3-(5-bromo-2-etilfenil)-1,8,8-trimetilbiciclo[3.2.1]octano-2,4-diona (0.175 g, 0.48 mmol), carbonato de cesio (0.314 g, 0.96 mmol) y 2,4-diclorofenol (0.393g, 2.41 mmol) se agrega trifluorometanosulfonato de cobre (II) (0.009g, 0.024 mmol) y tamices moleculares en polvo de 3Å
10 (0.200 g). Luego se agrega tolueno anhidro desgasificado (2ml), seguido de una purga con nitrógeno y se calienta a 170° C durante 1 hora bajo irradiación de microondas. Después de enfriar a temperatura ambiente la mezcla de reacción se apaga con ácido clorhídrico acuoso 2M y se extrae con diclorometano (x 2). La
15 fase orgánica se separa y se concentra bajo presión reducida. El producto crudo luego se purifica mediante HPLC de fase inversa preparativo para proporcionar *rac*-(1*S*,5*R*)-3-[5-(2,4-diclorofenoxi)-2-etilfenil]-1,8,8-trimetilbiciclo[3.2.1]octano-2,4-diona.

20

Ejemplo 5

Preparación de 4-[2-etil-5-(3-fluorofenoxi)fenil]-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona.

101

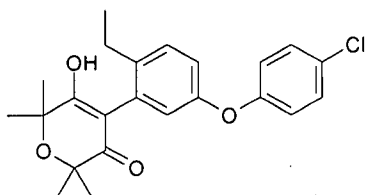


Una mezcla de 4-(5-bromo-2-etilfenil)-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona (200 mg, 0.57 mmol), 3-fluorofenol (320 mg, 2.83 mmol), carbonato de cesio (400 mg, 1.13 mmol), trifluorometanosulfonato de cobre (II) (10 mg, 0.03 mmol), y tamices moleculares en polvo de 3Å (400 mg) en tolueno (3.5 ml) se calienta a 160°C bajo irradiación de microondas durante 60 minutos. La mezcla se enfría a temperatura ambiente, se vierte en ácido clorhídrico acuoso 2M, diluido con diclorometano y se filtra a través de un cartucho de fase de separación. La fase orgánica se recolecta. El disolvente se evapora bajo presión reducida y el residuo se purifica mediante cromatografía de columna sobre gel de sílice para dar 4-[2-etil-5-(3-fluorofenoxy)fenil]-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona.

15

Ejemplo 6

Preparación de 4-[5-(4-clorofenoxy)-2-etilfenil]-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona.



20

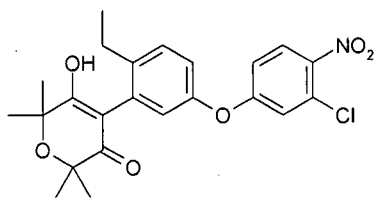
Una mezcla de 4-(5-bromo-2-etilfenil)-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona (200 mg, 0.57 mmol), 4-clorofenol (110 mg, 0.86 mmol), yoduro de cobre (I) (109 mg, 0.57 mmol), 1,10-fenantrolina (103

102

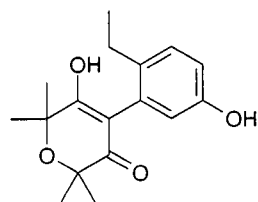
mg, 0.57 mmol) y fosfato de potasio (483 mg, 2.28 mmol), en dimetilsulfóxido (3.5 ml) se calienta a 200°C bajo irradiación de microondas durante 30 minutos. La mezcla se enfría a temperatura ambiente, se vierte en ácido clorhídrico acuoso 2M y se extrae
5 con diclorometano. El extracto orgánico se lava con agua, se seca sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtra y el filtrado se evapora bajo presión reducida. El disolvente se evapora bajo presión reducida y el residuo se purifica mediante cromatografía de columna sobre gel de sílice para dar 4-[5-(4-clorofenoxi)-2-
10 etilfenil]-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona.

Ejemplo 7

Preparación de 4-[5-(3-cloro-4-nitrofenoxi)-2-etilfenil]-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona.



Etapa 1: Preparación de 4-(2-etil-5-hidroxifenil)-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona.



Una solución de cloruro de isopropilmagnesio in tetrahidrofurano seco (10.6 ml de una solución 2M, 21.2 mmol) se agrega en forma

de gota a una solución de 4-(5-bromo-2-etilfenil)-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona (5.0 g, 14.2 mmol) en tetrahidrofurano (60 ml) a 0°C, y una vez se completa la adición la mezcla se agita durante diez minutos, luego se deja calentar y se agita 5 durante 70 minutos a temperatura ambiente. La mezcla luego se enfría a -78°C y se agrega en forma de gota una solución de n-butilitio en hexanos (53 ml de una solución 1.6 M, 85.0 mmol) durante 20 minutos. La mezcla se agita a -78°C durante 10 minutos, y luego se deja calentar la solución y se agita durante 10 1 hora y 50 minutos a temperatura ambiente.

La mezcla obtenida se agrega a través de una cánula a una solución de trimetilborato (31.6 ml, 283 mmol) en tetrahidrofurano seco (30 ml) a -78°C, y la mezcla se agita 15 durante 20 minutos, luego se deja calentar a temperatura ambiente. Una cantidad adicional de tetrahidrofurano seco (20 ml) se agrega para ayudar en la agitación, y la mezcla se agita a temperatura ambiente durante 1 hora y 30 minutos adicionales.

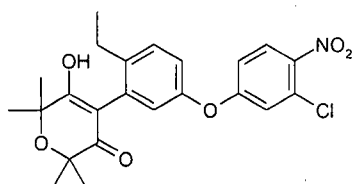
La mezcla se enfría a 0° C y se agrega cuidadosamente 30% de una 20 solución de peróxido de hidrógeno (16 ml, 142 mmol). La mezcla se agita durante 10 minutos a 0°C, luego se deja calentar a temperatura ambiente y se agita durante 18 horas.

La mezcla se divide en partes entre diclorometano y ácido 25 clorhídrico acuoso diluido. El acuoso se extrae con diclorometano y los extractos orgánicos se combinan, se lavan con solución salina, se secan sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtran y el filtrado se concentra bajo presión reducida. El residuo se

104

purifica mediante cromatografía de columna sobre gel de sílice para dar 4-(2-etil-5-hidroxifenil)-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona.

- 5 Etapa 2: Preparación de 4-[5-(3-cloro-4-nitrofenoxi)-2-etilfenil]-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona.

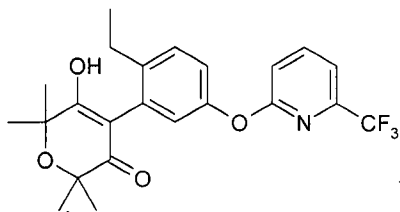


- 10 Una mezcla de 4-(2-etil-5-hidroxifenil)-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona (100 mg, 0.34 mmol), 2-cloro-4-fluoro-1-nitrobenceno (72 mg, 0.41 mmol), y carbonato de potasio (110 mg, 0.69 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (2 ml) se calienta a 140° C bajo irradiación de microondas durante 40 minutos. La mezcla se enfría a
15 temperatura ambiente, se vierte en ácido clorhídrico acuoso 2M y se extrae con acetato de etilo. El extracto orgánico se lava con solución salina, se seca sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtra y el filtrado se evapora bajo presión reducida. El residuo se purifica mediante cromatografía de columna sobre gel de sílice
20 para dar 4-[5-(3-cloro-4-nitro-fenoxi)-2-etilfenil]-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona.

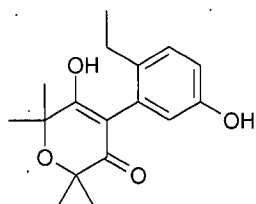
Ejemplo 8

- Preparación de 4-[2-etil-5-(6-trifluorometilpiridin-2-
25 iloxi)fenil]-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona.

105



Etapa 1: Preparación alternativa de 4-(2-etil-5-hidroxifenil)-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona.



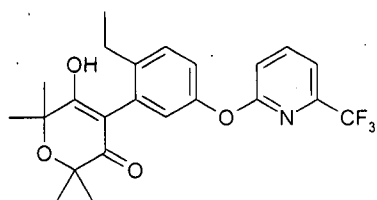
5

Una mezcla de 4-(5-bromo-2-etilfenil)-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona (1.0 g, 2.8 mmol), yoduro de cobre (I) (108 mg, 0.57 mmol) y L-prolina (33 mg, 0.28 mmol) en una solución acuosa de hidróxido de sodio (8.8 ml de una solución 1 N) se calienta a 200° C durante 2 horas bajo irradiación de microondas. La mezcla se enfría a temperatura ambiente, se vierte en ácido clorhídrico acuoso 2M y se extrae con acetato de etilo. El extracto orgánico se lava con solución salina, se seca sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtra y el filtrado se evapora bajo presión reducida. El disolvente se evapora bajo presión reducida y el residuo se purifica mediante cromatografía de columna sobre gel de sílice para dar 4-(2-etil-5-hidroxifenil)-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona.

20

Etapa 2: Preparación de 4-[2-etil-5-(6-trifluorometilpiridin-2-iloxi)fenil]-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona.

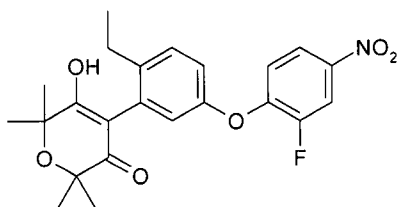
106



Una mezcla de 4-(2-etil-5-hidroxifenil)-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona (100 mg, 0.34 mmol), 2-fluoro-6-trifluorometilpiridina (68 mg, 0.41 mmol), y carbonato de potasio (110 mg, 0.69 mmol) en **5** *N,N*-dimetilformamida (3 ml) se calienta a 140°C bajo irradiación de microondas durante 40 minutos. La mezcla se enfría a temperatura ambiente, se vierte en ácido clorhídrico acuoso 2M, diluido con diclorometano y se filtra a través de un cartucho de fase de separación. La fase orgánica se recolecta. El disolvente **10** se evapora bajo presión reducida y el residuo se purifica mediante cromatografía de columna sobre gel de sílice para dar 4-[2-etil-5-(6-trifluorometilpiridin-2-iloxi)fenil]-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona.

15 Ejemplo 9

Preparación de 4-[2-etil-5-(2-fluoro-4-nitrofenoxi)fenil]-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona.



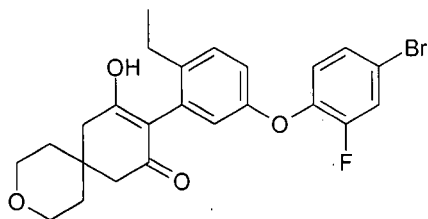
Una mezcla de 4-(2-etil-5-hidroxifenil)-2,2,6,6-tetrametilpiran-**20** 3,5-diona (135 mg, 0.47 mmol), 3,4-difluoro-1-nitrobenceno (90 mg, 0.56 mmol), y carbonato de potasio (130 mg, 0.94 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (3 ml) se calienta a 80 °C durante 3 horas. La mezcla se enfría a temperatura ambiente, se vierte en ácido

107

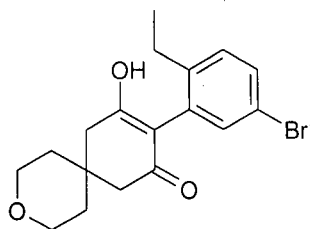
clorhídrico acuoso 2M y se extrae con acetato de etilo. El extracto orgánico se seca sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtra y el filtrado se evapora bajo presión reducida. El residuo se purifica mediante cromatografía de columna sobre gel de sílice para dar 4-[2-etil- 5-(2-fluoro-4-nitrofenoxi)fenil]-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona.

Ejemplo 10

Preparación de 9-[5-(4-bromo-2-fluorofenoxi)-2-etilfenil]-3-oxaspiro[5.5]undecano-8,10-diona.



Etapa 1: Preparación de 9-(5-bromo-2-etilfenil)-3-oxaspiro[5.5]undecano-8,10-diona.

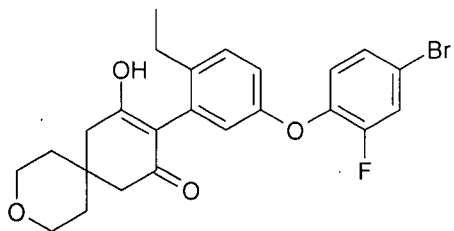


Se agrega 3-oxaspiro[5.5]undecano-8,10-diona (50.0 g, 0.275 mol) a una solución de carbonato de sodio (58.3 g, 0.55 mol) en una mezcla de etanol (175 ml) y agua (700 ml), y la mezcla se agita a temperatura ambiente hasta que se completa la disolución, y luego la mezcla se enfría a 5°C. Se agrega diacetato de yodobenceno (88.45 g, 0.275 mol) en forma de porción durante 15 minutos, y

una vez se completa la adición la mezcla se agita durante 15 minutos a 5°C, luego se retira el baño de enfriamiento y la mezcla se agita y se deja calentar a temperatura ambiente durante 4 horas. El iluro de yodonio precipitado se recolecta mediante
5 filtración.

Una porción del iluro de yodonio (2.0 g, 5.21 mmol) se agrega a una mezcla de ácido 2-etil-5-bromofenilborónico (1.43 g, 6.25 mmol), acetato de paladio (II) (59 mg, 0.26 mmol) y monohidrato
10 de hidróxido de litio (0.656 g, 15.6 mmol) en 1,2-dimetoxietano (40 ml) y agua (10 ml), y la mezcla se calienta a 50° C durante 6 horas, y luego se deja reposar a temperatura ambiente durante la noche. La mezcla se filtra a través de tierra diatomácea, se lava la torta de filtro con agua (50 ml) y acetato de etilo (50 ml).
15 La fase orgánica se desecha. La fase acuosa se acidifica a pH2 mediante adición de ácido clorhídrico concentrado, y luego se extrae con acetato de etilo. El extracto orgánico se seca sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtra y el filtrado se evapora bajo presión reducida. El residuo se purifica mediante
20 cromatografía de columna sobre gel de sílice para dar 9-(5-bromo-2-etilfenil)-3-oxaspiro[5.5]undecano-8,10-diona.

Etapa 2: Preparación de 9-[5-(4-bromo-2-fluorofenoxi)-2-etilfenil]-3-oxaspiro[5.5]undecano-8,10-diona.

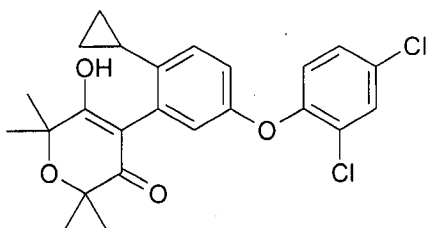


Una mezcla de 9-(5-bromo-2-etilfenil)-3-oxaspiro[5.5]undecano-
8,10-diona (360 mg, 0.99 mmol), 4-bromo-2-fluorofenol (227 mg,
1.19 mmol), carbonato de cesio (645 mg, 1.98 mmol),
5 trifluorometanosulfonato de cobre (II) (18 mg, 0.05 mmol) y
acetato de etilo (50 ml) en tolueno (10 ml) se calienta bajo
reflujo durante 19 horas. La mezcla se enfría a temperatura
ambiente, se agregan *N,N*-dimetilformamida (2 ml) y ácido
clorhídrico acuoso 2M (10 ml), y la mezcla se agita vigorosamente
10 durante 45 minutos. La mezcla se extrae con acetato de etilo, y
el extracto orgánico se seca sobre sulfato de magnesio anhidro,
se filtra y el filtrado se evapora bajo presión reducida. El
residuo se purifica mediante HPLC de fase inversa preparativo
para dar 9-[5-(4-bromo-2-fluorofenoxi)-2-etilfenil]-3-
15 oxaspiro[5.5]undecano-8,10-diona.

Ejemplo 11

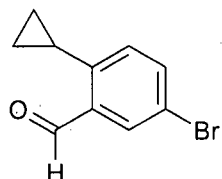
Preparación de 4-[2-ciclopropil-5-(2,4-diclorofenoxi)-fenil]-
2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona

20



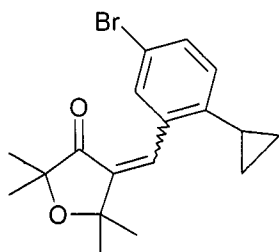
110

Etapa 1: Preparación de 5-bromo-2-ciclopropilbenzaldehído



5 A una solución mezclada de tolueno (2250 ml) y agua destilada (250 ml) a 0°C se agrega fosfato de potasio tribásico finamente molido (699.23 g, 3.29 mol) en forma de porción durante 10 minutos. Esta mezcla luego se deja calentar a temperatura ambiente, seguida por la adición de 2,5-dibromobenzaldehído
10 (235.0 g, 890 mmol) y ácido ciclopropilborónico (68.92 g, 801 mmol). Después de agitar a temperatura ambiente durante 50 minutos bajo una manta de nitrógeno se agrega tetrakis(trifenilfosfina)paladio (102.89 g, 39 mmol) durante 10 minutos, se lava el residuo sólido con tolueno (50 ml). La mezcla
15 de reacción luego se agita a 80° C durante 22 horas, seguido por enfriamiento a temperatura ambiente y adición de agua destilada (500 ml). La mezcla se filtra a través de una almohadilla de sílice (lavado con acetato de etilo adicional) y la fase acuosa se extrae con acetato de etilo (2 x 300 ml). Los extractos
20 orgánicos combinados se lavan con solución salina (500 ml), se secan con sulfato de magnesio anhidro y se concentran bajo presión reducida. El residuo se purifica mediante cromatografía sobre gel de sílice (iso-hexano/acetato de etilo como eluyente) seguido por destilación bajo presión reducida para proporcionar
25 5-bromo-2-ciclopropilbenzaldehído como un aceite amarillo.

Etapa 2: Preparación de 4-[1-(5-bromo-2-ciclopropilfenil)metilideno]-2,2,5,5-tetrametildihidrofurano-3-ona



5

A una suspensión enfriada con hielo de metóxido de sodio (40.1 g, 740 mmol) en 1,2-dimetoxietano anhidro se agrega 2,2,5,5-tetrametildihidrofurano-3-ona (94.9g, 670 mmol), se lava con dimetoxietano adicional (120 ml). La mezcla de reacción se agita a 0° C 30 minutos, seguida por adición de 5-bromo-2-ciclopropilbenzaldehído (137.2 g, 610 mM) como una solución en dimetoxietano (280 mL). Después de agitar durante unas 3 horas adicionales a esta temperatura la reacción se apaga con agua (800 ml) y se deja calentar a temperatura ambiente. Se agrega éter de dietilo (800 ml) y las dos fases se separan. La fase acuosa se extrae de nuevo con éter de dietilo (x2), y todos los orgánicos se lavan con solución salina (800 mL) luego se secan sobre sulfato de magnesio. Después de concentración *in vacuo* el residuo se purifica mediante cromatografía flash sobre gel de sílice (iso-hexano/acetato de etilo como eluyente) para proporcionar 4-[1-(5-bromo-2-ciclopropilfenil)metilideno]-2,2,5,5-tetrametildihidrofurano-3-ona.

10

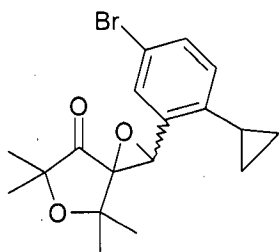
15

20

Etapa 3: Preparación de 2-(5-bromo-2-ciclopropilfenil)-4,4,6,6-tetrametil-1,5-dioxaspiro[2.4]heptan-7-ona

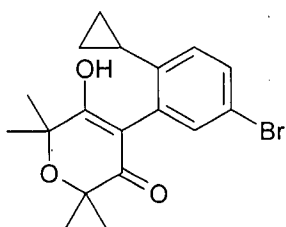
25

112



Se agrega a una solución de 4-[1-(5-bromo-2-ciclopropilfenil)metilideno]-2,2,5,5-tetrametildihidrofurano-3-ona (139 g, 541 mmol) en metanol (2650 ml) a 53°C y hidróxido de litio acuoso 2M (27.1 ml, 54.2 mmol) luego 50% de peróxido de hidrógeno acuoso (46.1 ml, 812 mmol). Después de agitar durante 30 minutos a esta temperatura la solución se enfría a 45° C y se apaga con tiosulfato de sodio acuoso saturado. Se agrega agua destilada (1000 ml) y los disolventes orgánicos se eliminan *in vacuo*. La fase acuosa luego se extrae en acetato de etilo (x 2) y los extractos orgánicos combinados se lavan con hidrógeno carbonato de sodio acuoso saturado (x 2), solución salina (500 mL), luego se seca sobre sulfato de magnesio anhidro. Los disolventes volátiles se eliminan bajo vacío para proporcionar 2-(5-bromo-2-ciclopropilfenil)-4,4,6,6-tetrametil-1,5-dioxaspiro[2.4]heptan-7-ona.

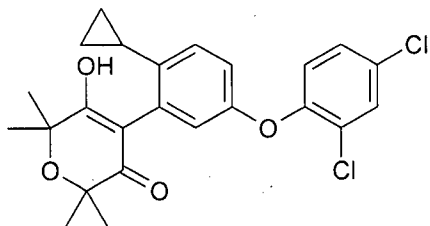
Etapa 4: Preparación de 4-(5-bromo-2-ciclopropilfenil)-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona



113

A una suspensión de cloruro de hierro (III) (53.0 g, 327 mmol) en diclorometano anhidro (1000 ml) a 5°C se agrega una segunda solución de 2-(5-bromo-2-ciclopropilfenil)-4,4,6,6-tetrametil-1,5-dioxaspiro[2.4]heptan-7-ona (119.1 g, 326 mmol) en 5 diclorometano anhidro (400 ml), a tal un índice como para mantener una temperatura interna por debajo de 10° C. Después de agitar durante 15 minutos la reacción se apaga con agua destilada (900 ml) y la mezcla se deja calentar a temperatura ambiente. Las dos fases se separan y la fase acuosa se extrae con diclorometano 10 (x 2). Se combinan los orgánicos y el producto crudo se extrae en carbonato de potasio acuoso 1M, seguido por acidificación a pH 0 con ácido clorhídrico concentrado y re-extracción con diclorometano. Todos los orgánicos se combinan luego se lavan con solución salina y se secan sobre sulfato de magnesio anhidro. La 15 concentración *in vacuo* luego proporciona 4-(5-bromo-2-ciclopropilfenil)-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona como un sólido blanco.

Etapa 5: Preparación de 4-[2-ciclopropil-5-(2,4-diclorofenoxi)-fenil]-2,2,6,6-tetrametil-piran-3,5-diona 20



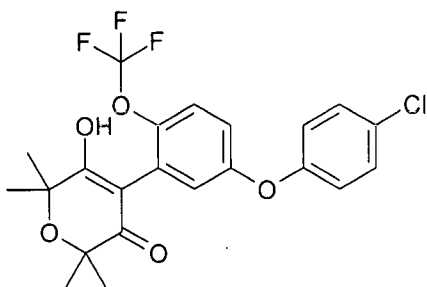
A una mezcla de 4-(5-bromo-2-ciclopropilfenil)-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona (0.208 g, 0.57 mmol), 2,4-diclorofenol 25 (473 mg, 2.85 mmol), carbonato de cesio (0.400 g, 1.13 mmol),

114

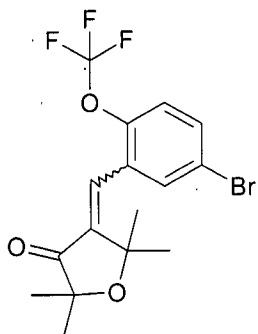
trifluorometanosulfonato de cobre (II) (10 mg, 0.03 mmol) y tamices moleculares de 5Å activos (en polvo) (0.330 g) se agrega tolueno anhidro (3.5 ml). La mezcla se purga con nitrógeno luego se calienta a 160° C durante 1 hora bajo irradiación de microondas. Después de enfriar a temperatura ambiente la mezcla de reacción se diluye con diclorometano y ácido clorhídrico 2M, luego se filtra y la fase orgánica se separa. Después de concentración *in vacuo* el residuo se purifica mediante HPLC de fase inversa preparativo para proporcionar 4-[2-ciclopropil-5-(2,4-diclorofenoxi)-fenil]-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona.

Ejemplo 12

Preparación de 4-[5-(4-clorofenoxi)-2-trifluorometoxifenil]-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona



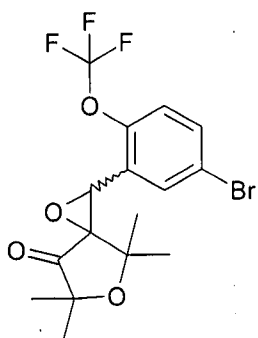
Etapa 1: Preparación de 4-[1-(5-bromo-2-trifluorometoxifenil)-metilideno]-2,2,5,5-tetrametildihidrofurano-3-ona



115

A una solución enfriada con hielo de 2,2,5,5-tetrametildihidrofurano-3-ona (2.84 g, 20.00mmol) en 1,2-dimetoxietano anhidro (6 ml) se agrega metóxido de sodio (1.19 g, 22.04 mmol) en una porción. Después de agitar a esta temperatura durante 5 minutos una solución de 5-bromo-2-trifluorometoxibenzaldehído (4.84 g, 18.00mmol) en 1,2-dimetoxietano (6ml) se agrega en forma de gota durante 10 mins, seguido por agitación a 0° C durante 1 hora adicional. Después de calentar a temperatura ambiente la mezcla de reacción se diluye con éter y se lava con ácido clorhídrico 2M (x 2). Las fracciones orgánicas se combinan, se secan sobre sulfato de magnesio, se filtran y el filtrado se evapora *in vacuo* para proporcionar 4-[1-(5-bromo-2-trifluorometoxifenil)-metilideno]-2,2,5,5-tetrametildihidrofurano-3-ona (7.06 g) como un líquido naranja.

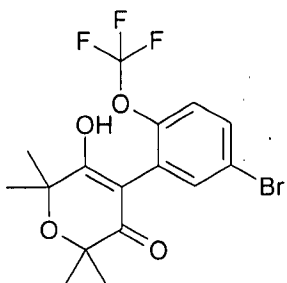
Etapa 2: Preparación de 2-(5-bromo-2-trifluorometoxifenil)-4,4,6,6-tetrametil-1,5-dioxaspiro[2.4]heptan-7-ona



A una solución de 4-[1-(5-bromo-2-trifluorometoxifenil)-metilideno]-2,2,5,5-tetrametil-dihidrofurano-3-ona (7.06 g, 18.00mmol) en metanol (300 ml) a 35°C se agrega 50% de peróxido

de hidrógeno acuoso (1.80 ml, 27.00 mmol), inmediatamente seguido por hidróxido de litio acuoso 2M (1.80 ml, 3.60 mmol). Después de agitar a esta temperatura durante 1 hora la mezcla de reacción se deja enfriar, luego se apaga con 10% de solución de metabisulfito de sodio (prueba de indicador de almidón KI negativa). La mezcla de reacción se extrae con éter de dietilo (x 3), luego la fase orgánica se lava adicionalmente con bicarbonato de sodio acuoso saturado (x 2) luego solución salina. Todos los orgánicos se combinan, se secan sobre sulfato de magnesio, se filtran y el filtrado se concentra *in vacuo* para proporcionar 2-(5-bromo-2-trifluorometoxifenil)-4,4,6,6-tetrametil-1,5-dioxaspiro[2.4]heptan-7-ona (6.34 g, 86%) como un aceite amarillo.

Etapa 3: Preparación de 4-(5-bromo-2-trifluorometoxifenil)-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona

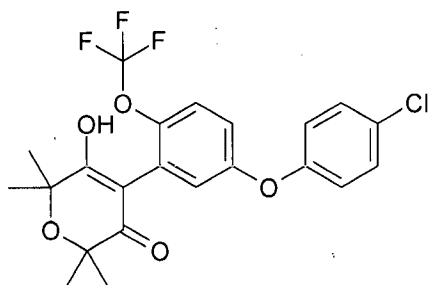


A una solución enfriada con hielo de ácido sulfúrico concentrado (10 ml) se agrega una segunda solución de 2-(5-bromo-2-trifluorometoxifenil)-4,4,6,6-tetrametil-1,5-dioxaspiro[2.4]heptan-7-ona (6.34 g, 15.00mmol) en 1,2-dicloroetano (10 ml) en forma de gota guante 5 minutos. Esta

117

mezcla bifásica se agita vigorosamente durante 2 horas a 0°C, luego se vierte en agua con hielo, se enjuaga con una pequeña cantidad de 1,2-dicloroetano/agua adicional. Esta mezcla luego se concentra bajo vacío para eliminar todos los disolventes orgánicos, hasta que se produce un sólido que fluye libre. El sólido se filtra, se lava con agua luego isohexano, seguido por secado bajo vacío durante la noche. El sólido luego se redissuelve en acetato de etilo, se seca sobre sulfato de magnesio, se filtra y el filtrado se concentra *in vacuo* para proporcionar 4-(5-bromo-2-trifluorometoxifenil)-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona (4.17 g, 68%).

Etapa 4: Preparación de 4-[5-(4-clorofenoxi)-2-trifluorometoxifenil]-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona

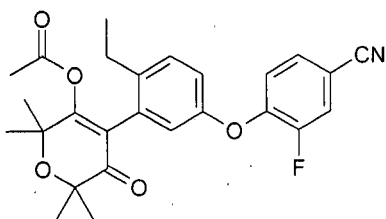


A una mezcla de 4-(5-bromo-2-trifluorometoxifenil)-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona (0.254 g, 0.62 mmol), 4-clorofenol (0.400 g, 3.11 mmol), carbonato de cesio (0.440 g, 1.25 mmol), trifluorometanosulfonato de cobre (II) (11mg, 0.03 mmol) y tamices moleculares de 4Å en polvo (0.40 g) se agrega tolueno anhidro (3.5 ml). Después de lavar a chorro con nitrógeno la mezcla se calienta a 160°C durante 1 hora bajo irradiación de microondas, luego se enfría a temperatura ambiente y se apaga con ácido clorhídrico acuoso 2M. El producto crudo se extrae con

diclorometano (x 3), y las fracciones orgánicas se combinan, se lavan con solución salina, se secan sobre sulfato de magnesio y se concentran *in vacuo*. La purificación mediante HPLC de fase inversa preparativo proporciona 4-[5-(4-cloro-fenoxi)-2-trifluorometoxifenil]-2,2,6,6-tetrametilpiran-3,5-diona como un polvo blanco.

Ejemplo 13

Preparación de éster de 4-[5-(4-ciano-2-fluorofenoxi)-2-etilfenil]-2,2,6,6-tetrametil-5-oxo-5,6-dihidro-2H-piran-3-ilo de ácido acético

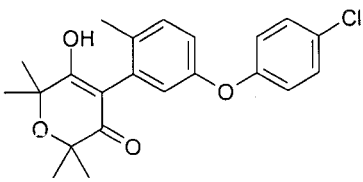
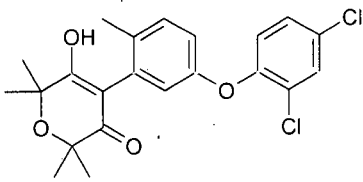
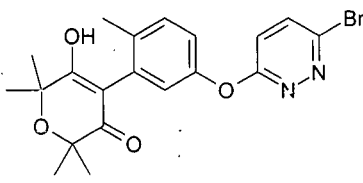
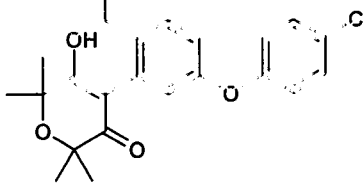
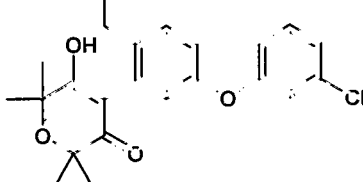


A una solución de 4-[4-etil-3-(2,2,6,6-tetrametil-3,5-dioxotetrahidropiran-4-il)fenoxi]-3-fluorobenzonitrilo (0.130 g, 0.31 mmol) en diclorometano a 0°C se agrega trietilamina (0.133 ml, 0.95 mmol) seguida por cloruro de acetilo (0.067 ml, 0.95 mmol). La mezcla se agita a 0° C durante 60 minutos, luego se deja calentar a temperatura ambiente y se agita durante 18 horas adicionales. Después de concentración *in vacuo* el producto crudo se purifica mediante cromatografía de columna flash sobre gel de sílice (eluyente iso-hexano/acetato de etilo) para proporcionar éster de 4-[5-(4-ciano-2-fluorofenoxi)-2-etilfenil]-2,2,6,6-tetrametil-5-oxo-5,6-dihidro-2H-piran-3-ilo.

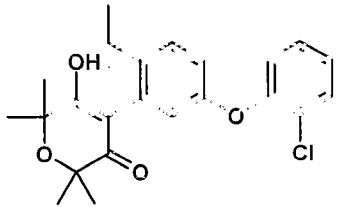
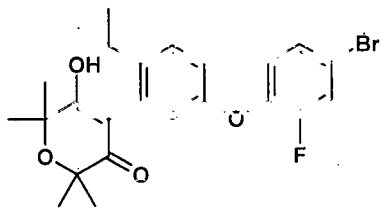
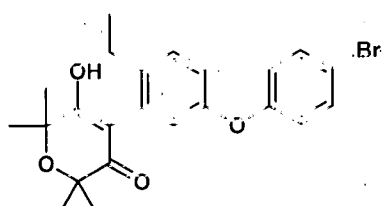
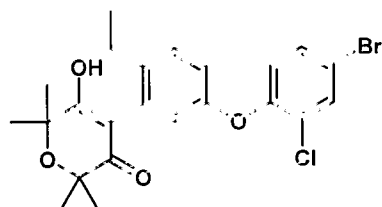
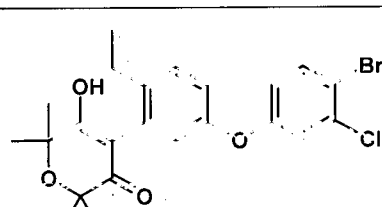
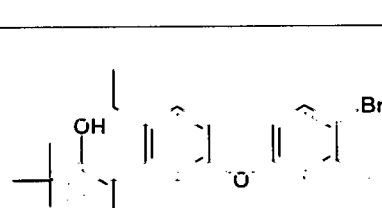
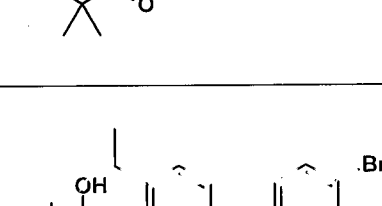
119

Se preparan los compuestos adicionales en la Tabla T1 adelante mediante métodos similares utilizando materiales de partida 5 apropiados.

Tabla T1

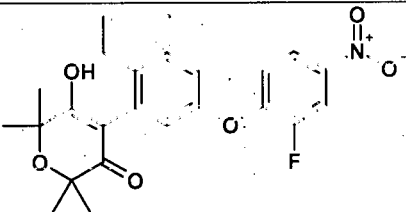
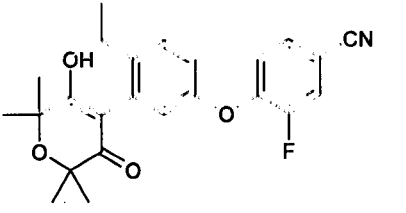
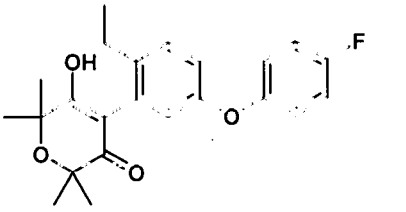
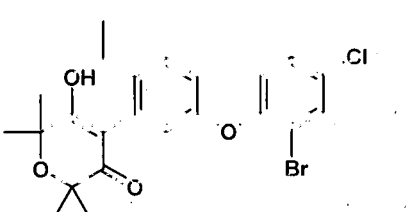
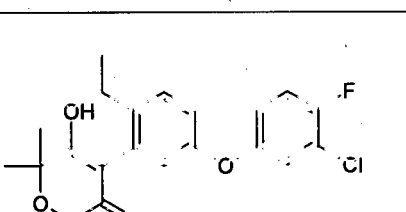
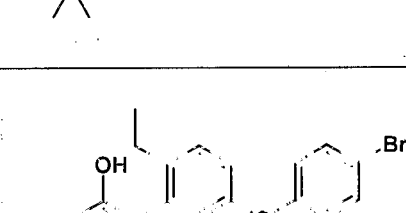
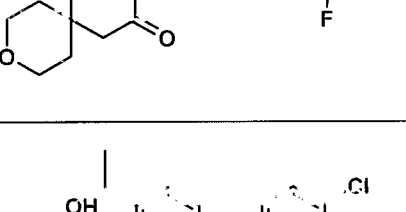
Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
A-1		δ 7.30-7.23 (m, 3H), 6.92-6.97 (m, 3H), 6.79 (d, 1H), 5.59 (br. s, 1H), 2.11 (s, 3H), 1.59 (app. d, 6H), 1.48 (app. d, 6H).
A-2		δ 7.45 (d, 1H), 7.28 (d, 1H), 7.19 (dd, 1H), 6.93 (d, 1H), 6.89 (dd, 1H), 6.79 (d, 1H), 5.62 (br. s, 1H), 2.11 (s, 3H), 1.60 (app. d, 6H), 1.48 (app. d, 6H).
A-3		d-DMSO δ 8.02 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.10 (dd, 1H), 6.80 (m, 1H), 2.05 (s, 3H), 1.30-1.60 (br. d, 12H)
A-4		δ 7.30 (m, 3H), 6.93-6.99 (m, 3H), 6.76 (dd, 1H), 5.57 (br. s, 1H), 2.41 (m, 2H), 1.59 (d, 6H), 1.47 (d, 6H), 1.11 (t, 3H)
A-5		δ 7.32 (dd, 1H), 7.25 (m, 1H), 7.07 (m, 1H), 7.03 (m, 1H), 7.00 (dd, 1H), 6.90 (m, 1H), 6.79 (dd, 1H), 5.65 (br. s, 1H), 2.42 (m, 2H), 1.54 (m, 12H), 1.12 (t, 3H)

120

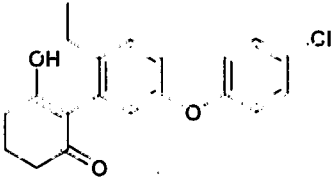
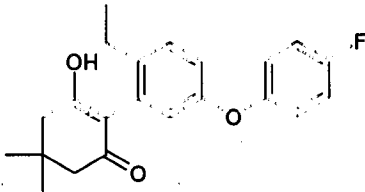
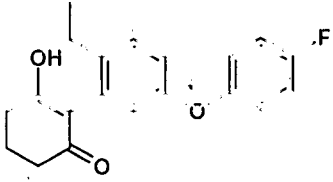
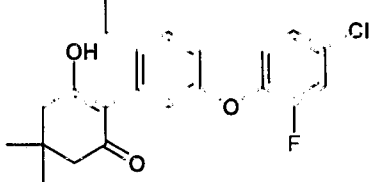
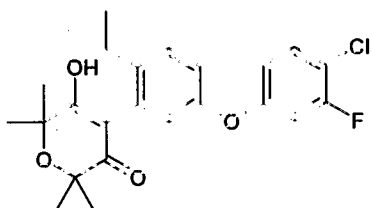
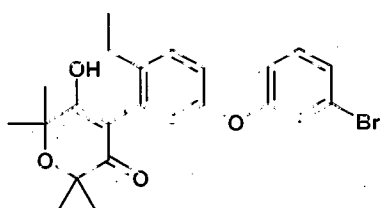
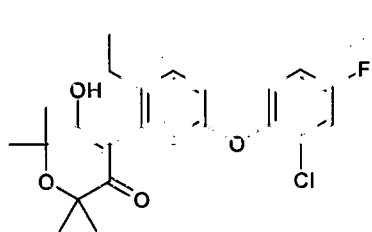
Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-6		δ 7.45 (m, 1H), 7.30 (dd, 1H), 7.23 (m, 1H), 7.08 (m, 1H), 7.02 (m, 1H), 6.92 (m, 1H), 6.78 (dd, 1H), 5.61 (br. s, 1H), 2.41 (m, 2H), 1.59 (d, 6H), 1.47 (d, 6H), 1.11 (t, 3H)
A-7		δ 7.21-7.38 (m, 3H), 6.91-7.00 (m, 2H), 6.76 (dd, 1H), 5.64 (br. s, 1H), 2.41 (m, 2H), 1.59 (m, 6H), 1.47 (m, 6H), 1.11 (t, 3H)
A-8		δ 7.43 (m, 2H), 7.31 (d, 1H), 6.98 (dd, 1H), 6.91 (m, 2H), 6.77 (d, 1H), 5.53 (br. s, 1H), 2.41 (m, 2H), 1.59 (d, 6H), 1.47 (d, 6H), 1.11 (t, 3H)
A-9		δ 7.60 (dd, 1H), 7.32 (m, 2H), 6.93 (dd, 1H), 6.89 (d, 1H), 6.77 (d, 1H), 5.61 (br. s, 1H), 2.42 (m, 2H), 1.59 (d, 6H), 1.47 (d, 6H), 1.11 (t, 3H)
A-10		δ 7.53 (dd, 1H), 7.33 (dd, 1H), 7.14 (dd, 1H), 7.00 (dd, 1H), 6.79 (m, 2H), 5.53 (br. s, 1H), 2.43 (m, 2H), 1.59 (d, 6H), 1.47 (d, 6H), 1.12 (t, 3H)
A-11		δ 7.45 (dd, 1H), 7.30 (dd, 1H), 6.96 (dd, 1H), 6.93 (dd, 1H), 6.76 (dd, 1H), 6.73 (dd, 1H), 5.54 (br. s, 1H), 2.41 (m, 2H), 2.36 (s, 3H), 1.59 (d, 6H), 1.47 (d, 6H), 1.11 (t, 3H)
A-12		δ 7.38 (dd, 1H), 7.23-7.30 (m, 2H), 6.85 (dd, 1H), 6.78 (dd, 1H), 6.71 (dd, 1H), 5.54 (br. s, 1H), 2.40 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 1.59 (d, 6H), 1.47 (d, 6H), 1.10 (t, 3H)

121

Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
A-13		δ 7.28 (d, 1H), 7.04-7.20 (m, 4H), 6.92 (dd, 1H), 6.78 (d, 1H), 5.68 (br. s, 1H), 2.40 (m, 2H), 1.59 (d, 6H), 1.47 (d, 6H), 1.10 (t, 3H)
A-14		δ 7.27 (d, 1H), 7.09 (m, 1H), 6.95 (m, 1H), 6.82-6.90 (m, 2H), 6.73 (d, 1H), 5.65 (br. s, 1H), 2.40 (m, 2H), 1.59 (d, 6H), 1.47 (d, 6H), 1.10 (t, 3H)
A-15		δ 7.29 (d, 1H), 7.21 (dd, 1H), 7.09 (m, 1H), 7.02 (t, 1H), 6.93 (dd, 1H), 6.76 (d, 1H), 5.65 (br. s, 1H), 2.41 (m, 2H), 1.59 (d, 6H), 1.47 (d, 6H), 1.10 (t, 3H)
A-16		δ 7.31 (d, 1H), 6.90-7.06 (m, 3H), 6.78-6.87 (m, 2H), 5.68 (br. s, 1H), 2.42 (m, 2H), 1.59 (d, 6H), 1.47 (d, 6H), 1.11 (t, 3H)
A-17		δ 7.31 (d, 1H), 7.08-7.16 (m, 1H), 6.97 (m, 1H), 6.75-6.83 (m, 3H), 5.68 (br. s, 1H), 2.42 (m, 2H), 1.59 (d, 6H), 1.47 (d, 6H), 1.11 (t, 3H)
A-18		δ 7.35 (d, 1H), 6.92-7.09 (m, 4H), 6.86 (m, 1H), 5.81 (br. s, 1H), 3.32 (br. s, 1H), 2.46 (m, 2H), 1.42-1.76 (m, 12H), 1.15 (t, 3H)
A-19		δ 7.46 (d, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.19 (dd, 1H), 6.90-6.97 (m, 2H), 6.76 (d, 1H), 5.66 (br. s, 1H), 2.42 (m, 2H), 1.59 (d, 6H), 1.47 (d, 6H), 1.11 (t, 3H)

Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
A-20		δ 8.08 (dd, 1H), 7.99 (m, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.03-7.10 (m, 2H), 6.86 (d, 1H), 2.46 (q, 2H), 1.53 (br. m, 12H), 1.14 (t, 3H)
A-21		δ 7.47 (dd, 1H), 7.35-7.41 (m, 2H), 7.01-7.07 (m, 2H), 6.84 (d, 1H), 2.45 (q, 2H), 1.53 (br. m, 12H), 1.13 (t, 3H)
A-22		δ 7.27 - 7.25 (m, 1H), 7.04 - 6.96 (m, 4H), 6.91 (dd, 1H), 6.72 (d, 1H), 5.78 (br. s, 1H), 2.44 - 2.33 (m, 2H), 1.57 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.09 (t, 3H).
A-23		δ 7.61 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.22 (dd, 1H), 6.93 - 6.90 (m, 2H), 6.75 (d, 1H), 5.66 (br. s, 1H), 2.44 - 2.37 (m, 2H), 1.58 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.10 (t, 3H)
A-24		δ 7.29 - 7.25 (m, 1H), 7.10 - 7.05 (m, 2H), 6.93 (dd, 1H), 6.89 - 6.85 (m, 1H), 6.74 (d, 1H), 5.82 (br. s, 1H), 2.43 - 2.36 (m, 2H), 1.57 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.09 (t, 3H).
A-25		δ 7.34 (dd, 1H), 7.29 (d, 1H), 7.23 (m, 1H), 6.98 (d, 1H), 6.94 (dd, 1H), 6.66 (d, 1H), 5.76 (br. s, 1H), 3.74 (q, 4H), 2.45-2.68 (m, 4H), 2.38 (m, 2H), 1.69 (m, 4H), 1.09 (t, 3H)
A-26		δ 7.29 (m, 3H), 6.95 (app. d, 3H), 6.69 (d, 1H), 5.61 (br. s, 1H), 2.40-2.50 (m, 4H), 2.38 (s, 2H), 1.17 (s, 3H), 1.19 (s, 3H), 1.11 (t, 3H)

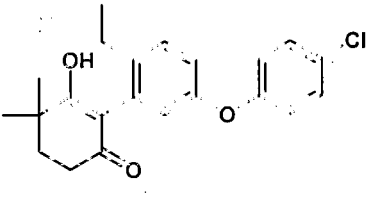
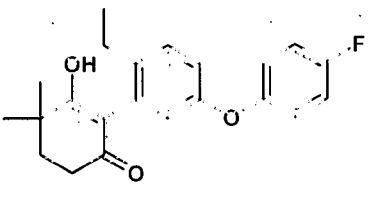
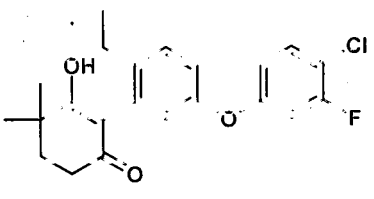
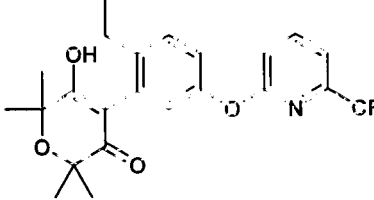
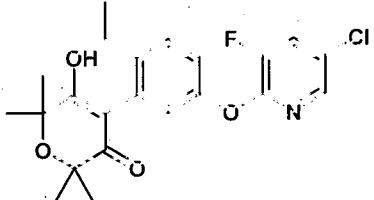
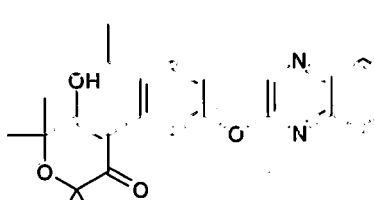
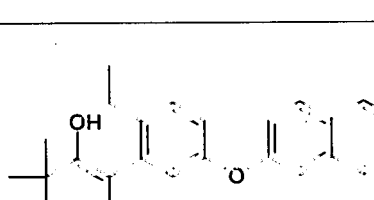
123

Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
A-27		δ 7.30 (m, 3H), 6.97 (m, 3H), 6.69 (d, 1H), 5.57 (br. s, 1H), 2.61 (br. s, 2H), 2.50 (br. s, 2H), 2.40 (m, 2H), 2.10 (m, 2H), 1.11 (t, 3H)
A-28		d ₄ -MeOH: δ 7.21 (d, 1H), 7.00 (m, 4H), 6.84 (dd, 1H), 6.53 (d, 1H), 2.40 (m, 6H), 1.17 (s, 3H), 1.14 (s, 3H), 1.07 (t, 3H)
A-29		d ₄ -MeOH: δ 7.25 (d, 1H), 7.05 (m, 4H), 6.88 (dd, 1H), 6.57 (d, 1H), 2.56 (m, 4H), 2.40 (q 2H), 2.10 (m, 2H), 1.10 (t, 3H)
A-30		d ₄ -MeOH δ 7.33 (dd, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.10 (m, 2H), 6.89 (dd, 1H), 6.60 (d, 1H), 2.45 (m, 6H), 1.19 (app. d, 6H), 1.11 (t, 3H)
A-31		δ 7.34 - 7.29 (m, 2H), 7.01 - 6.99 (m, 1H), 6.83 - 6.73 (m, 3H), 5.55 (s, 1H), 2.46 - 2.38 (m, 2H), 1.58 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.11 (t, 3H).
A-32		δ 7.31 (d, 1H), 7.23 - 7.16 (m, 3H), 6.98 (dd, 1H), 6.94 - 6.92 (m, 1H), 6.78 (d, 1H), 5.57 (s, 1H), 2.45 - 2.38 (m, 2H), 1.58 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.11 (t, 3H).
A-33		δ 7.27 (d, 1H), 7.20 (dd, 1H), 7.04 - 7.00 (m, 1H), 6.98 - 6.93 (m, 1H), 6.86 (dd, 1H), 6.72 (d, 1H), 2.40 (br. app. s, 2H), 1.57 - 1.45 (br. m, 12H), 1.10 (t, 3H).

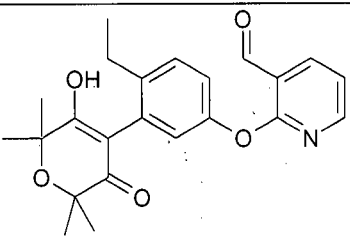
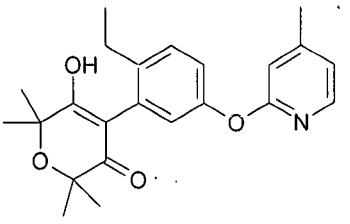
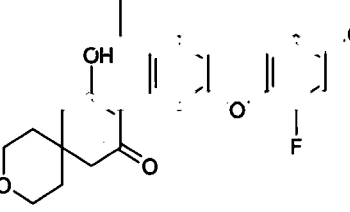
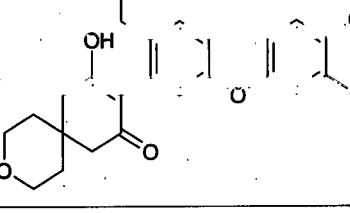
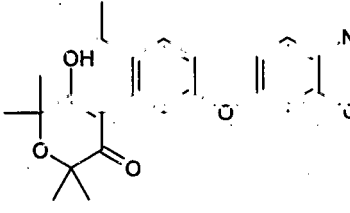
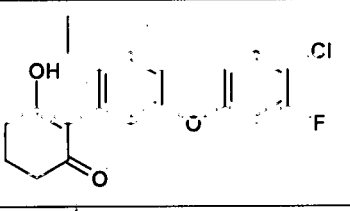
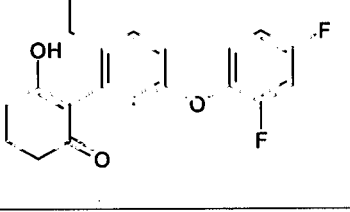
124

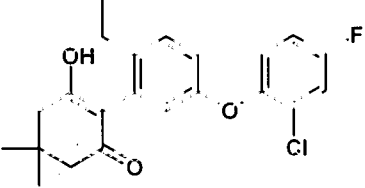
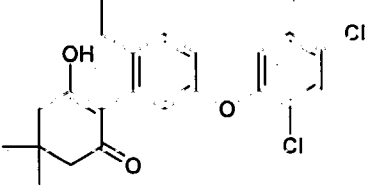
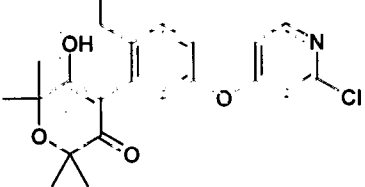
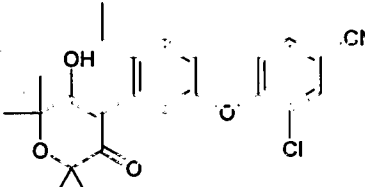
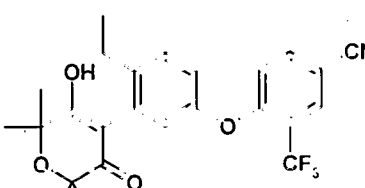
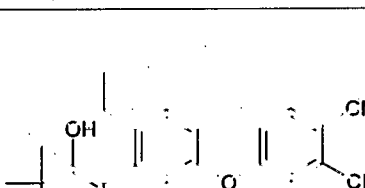
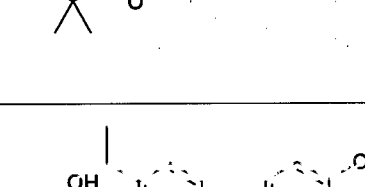
Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
A-34		δ 8.28 (s, 1H), 7.92 (dd, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.09 (d, 1H), 7.07 - 7.04 (m, 1H), 6.86 (d, 1H), 2.50 - 2.43 (m, 2H), 1.57 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.13 (t, 3H).
A-35		δ 7.28 (d, 1H), 6.95-7.07 (m, 4H), 6.93 (dd, 1H), 6.65 (d, 1H), 5.75 (br. s, 1H), 3.74 (q, 4H), 2.46-2.71 (m, 4H), 2.38 (m, 2H), 1.69 (m, 4H), 1.09 (t, 3H)
A-36		δ 7.25-7.33 (m, 3H), 6.92-6.99 (m, 3H), 6.68 (d, 1H), 5.71 (br. s, 1H), 3.74 (q, 4H), 2.47-2.70 (m, 4H), 2.39 (m, 2H), 1.68 (m, 4H), 1.10 (t, 3H)
A-37		δ 7.42 (m, 2H), 7.30 (d, 1H), 6.97 (dd, 1H), 6.90 (m, 2H), 6.68 (d, 1H), 5.69 (br. s, 1H), 3.74 (q, 4H), 2.47-2.68 (m, 4H), 2.39 (m, 2H), 1.68 (m, 4H), 1.10 (t, 3H)
A-38		d ₄ -MeOH δ 7.30 (dd, 1H), 7.22 (d, 1H), 7.05 (m, 2H), 6.84 (m, 1H), 6.56 (d, 1H), 2.53 (m, 4H), 2.38 (q 2H), 2.06 (m, 2H), 1.08 (t, 3H)
A-39		d ₄ -MeOH: δ 7.29 (m, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.05 (m, 2H), 6.80 (m, 1H), 6.51 (d, 1H), 2.53 (m, 4H), 2.37 (q 2H), 2.05 (m, 2H), 1.08 (t, 3H)
A-40		d ₄ -MeOH: δ 7.50 (d, 1H), 7.23 (m, 2H), 7.00 (d, 1H), 6.85 (m, 1H), 6.56 (d, 1H), 2.53 (m, 4H), 2.40 (q 2H), 2.06 (m, 2H), 1.09 (t, 3H)
A-41		d ₄ -MeOH: δ 7.41 (m, 2H), 7.22 (d, 1H), 6.90 (m, 3H), 6.60 (d, 1H), 2.53 (m, 4H), 2.40 (q 2H), 2.06 (m, 2H), 1.10 (t, 3H)

Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
A-42		δ 7.38 (d, 1H), 7.10 - 7.07 (m, 2H), 6.85 (d, 1H), 6.82 (dd, 1H), 2.52 - 2.40 (m, 2H), 1.57 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.14 (t, 3H).
A-43		δ 7.77 (q, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.07 (dd, 1H), 6.85 (d, 1H), 6.82 (dd, 1H), 6.57 (dd, 1H), 2.51 - 2.40 (m, 2H), 1.57 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.13 (t, 3H).
A-44		δ 7.86 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.09 (dd, 1H), 6.86 (d, 1H), 2.52 - 2.37 (m, 2H), 1.56 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.12 (t, 3H)
A-45		δ 8.18 - 8.17 (m, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.11 (dd, 1H), 6.89 (d, 1H), 2.50 - 2.42 (m, 2H), 1.56 (br. d, 6H), 1.45 (br. d, 6H), 1.13 (t, 3H).
A-46		d ₄ -MeOH δ 7.36 (t, 1H), 7.27 (d, 1H), 6.90 (m, 2H), 6.81 (m, 1H), 6.62 (d, 1H), 2.44 (m, 6H), 1.18 (s, 3H), 1.15 (s, 3H), 1.09 (t, 3H)
A-47		d ₄ -MeOH: δ 7.21 (d, 1H), 7.10 (m, 2H), 6.90 (m, 1H), 6.80 (dd, 1H), 6.52 (d, 1H), 2.40 (m, 6H), 1.17 (s, 3H), 1.14 (s, 3H), 1.07 (t, 3H)
A-48		d ₄ -MeOH: δ 7.45 (d, 2H), 7.26 (d, 1H), 6.95 (m, 3H), 6.60 (d, 1H), 2.44 (m, 6H), 1.20 (s, 3H), 1.18 (s, 3H), 1.12 (t, 3H)
A-49		d ₄ -MeOH: δ 7.43 (dd, 1H), 7.22 (m, 2H), 7.00 (t, 1H), 6.85 (dd, 1H), 6.56 (d, 1H), 2.40 (m, 6H), 1.17 (s, 3H), 1.14 (s, 3H), 1.08 (t, 3H)

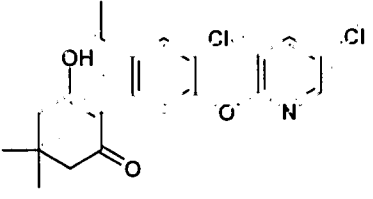
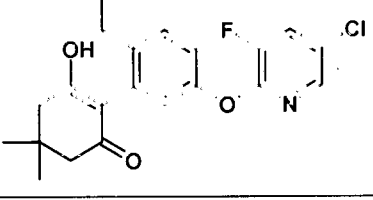
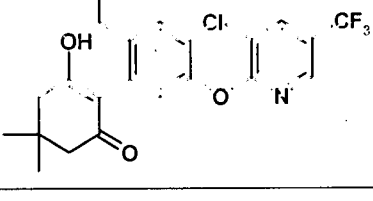
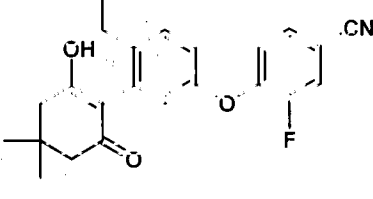
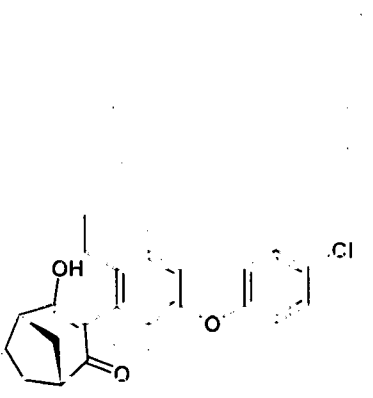
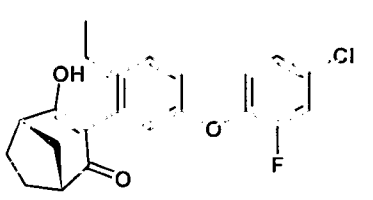
Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
A-50		d ₄ -MeOH δ 7.26 (d, 2H), 7.22 (d, 1H), 6.98 (d, 2H), 6.88 (dd, 1H), 6.55 (d, 1H), 2.62 (m, 2H), 2.37 (m, 2H), 1.90 (m, 2H), 1.19 (s, 3H), 1.15 (s, 3H), 1.07 (t, 3H)
A-51		d ₄ -MeOH: δ 7.20 (d, 1H), 7.00 (m, 4H), 6.84 (dd, 1H), 6.51 (d, 1H), 2.60 (m, 2H), 2.35 (m, 2H), 1.92 (m, 2H), 1.19 (s, 3H), 1.14 (s, 3H), 1.06 (t, 3H)
A-52		d ₄ -MeOH: δ 7.36 (t, 1H), 7.25 (d, 1H), 6.90 (m, 2H), 6.81 (m, 1H), 6.60 (d, 1H), 2.63 (m, 2H), 2.37 (m, 2H), 1.92 (m, 2H), 1.20 (s, 3H), 1.15 (s, 3H), 1.08 (t, 3H)
A-53		δ 7.84 (t, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.10 (dd, 1H), 6.92 (d, 1H), 2.49 - 2.42 (m, 2H), 1.56 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.13 (t, 3H).
A-54		δ 7.79 (d, 1H), 7.50 (dd, 1H), 7.34 (d, 1H), 7.11 (dd, 1H), 6.86 (d, 1H), 2.46 - 2.39 (m, 2H), 1.56 (br. d, 6H), 1.45 (br. d, 6H), 1.11 (t, 3H).
A-55		δ 8.71 (s, 2H), 8.04 (d, 1H), 7.64 - 7.62 (m, 1H), 7.59 - 7.56 (m, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.16 (dd, 1H), 6.98 (d, 1H), 2.53 - 2.45 (m, 2H), 1.57 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.16 (t, 3H).
A-56		δ 7.84 - 7.80 (m, 2H), 7.72 (d, 1H), 7.47 - 7.43 (m, 1H), 7.42 - 7.38 (m, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.27 - 7.24 (m, 1H), 7.04 (dd, 1H), 6.83 (d, 1H), 5.73 (br. s, 1H), 2.47 - 2.39 (m,

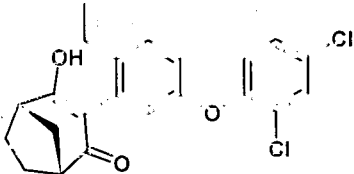
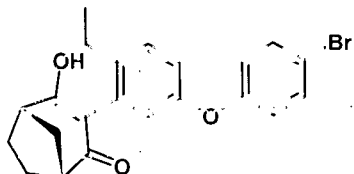
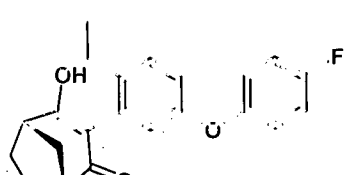
Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
		2H), 1.58 (d, 6H), 1.47 (d, 6H), 1.12 (t, 3H).
A-57		δ 7.43 - 7.39 (m, 1H), 7.35 - 7.33 (m, 2H), 7.27 - 7.26 (m, 1H), 7.24 - 7.21 (m, 1H), 6.99 (dd, 1H), 6.79 (d, 1H), 2.47 - 2.39 (m, 2H), 1.58 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.12 (t, 3H).
A-58		δ 7.33 (d, 1H), 7.31 - 7.25 (m, 1H), 7.02 (dd, 1H), 6.82 - 6.78 (m, 3H), 6.76 - 6.72 (m, 1H), 5.76 (br. s, 1H), 2.49 - 2.37 (m, 2H), 1.60 (d, 6H), 1.48 (d, 6H), 1.13 (t, 3H).
A-59		δ 7.34 (d, 1H), 7.06 (dd, 1H), 6.84 (d, 1H), 2.48 - 2.40 (m, 2H), 2.36 (t, 3H), 1.56 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.12 (t, 3H).
A-60		δ 7.39 (d, 1H), 7.10 (dd, 1H), 6.86 (d, 1H), 2.52 - 2.41 (m, 2H), 1.57 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.14 (t, 3H).
A-61		δ 7.95 (dd, 1H), 7.74 - 7.70 (m, 1H), 7.34 (d, 1H), 7.04 - 7.00 (m, 2H), 6.97 (dd, 1H), 6.85 (d, 1H), 2.45 (q, 2H), 1.52 - 1.44 (br. m, 12H), 1.12 (t, 3H).
A-62		δ 8.08 (d, 1H), 7.69 (dd, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.12 (dd, 1H), 6.90 (d, 1H), 2.50 - 2.43 (m, 2H), 2.18 (br. s, 1H), 1.57 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.14 (t, 3H).

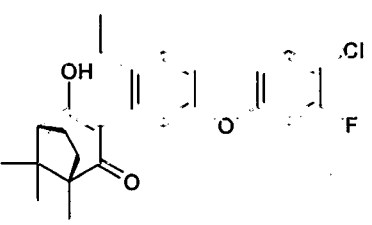
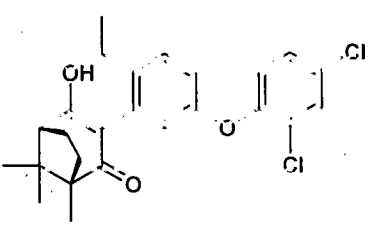
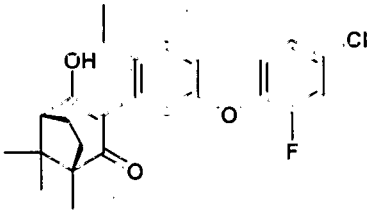
Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
A-63		δ 10.50 (s, 1H), 8.25 (dd, 1H), 8.18 (dd, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.13 - 7.09 (m, 2H), 6.92 (d, 1H), 2.51 - 2.43 (br. m, 2H), 1.56 (6d, H), 1.45 (d, 6H), 1.14 (t, 3H).
A-64		δ 7.81 - 7.80 (m, 1H), 7.52 (dd, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.04 (dd, 1H), 6.90 (d, 1H), 6.83 (d, 1H), 2.50 - 2.39 (m, 2H), 2.25 (s, 3H), 1.56 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.12 (t, 3H).
A-65		LCMS (Método A): t _r = 1.59 mins, MH ⁺ = 431
A-66		LCMS (Método A): t _r = 1.60 mins, MH ⁺ = 431
A-67		δ 7.95 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 7.07 (dd, 1H), 6.93 (dd, 1H), 6.83 (d, 1H), 5.52 (br. s, 1H), 2.47 - 2.44 (m, 2H), 1.59 (d, 6H), 1.47 (d, 6H), 1.14 (t, 3H).
A-68		d ₄ -MeOH: δ 7.35 (t, 1H), 7.25 (d, 1H), 6.90 (m, 2H), 6.80 (m, 1H), 6.63 (d, 1H), 2.53 (m, 4H), 2.40 (q, 2H), 2.05 (m, 2H), 1.09 (t, 3H)
A-69		d ₄ -MeOH: δ 7.20 (d, 1H), 7.15-7.05 (m, 2H), 6.90 (m, 1H), 6.80 (m, 1H), 6.53 (d, 1H), 2.52 (m, 4H), 2.37 (q, 2H), 2.05 (m, 2H), 1.07 (t, 3H)

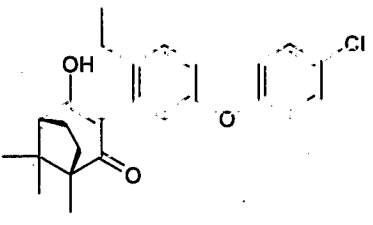
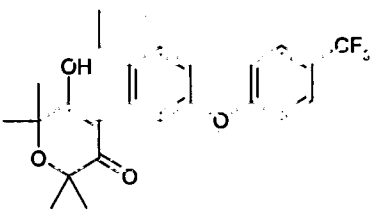
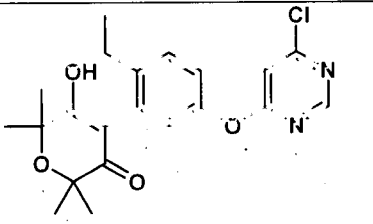
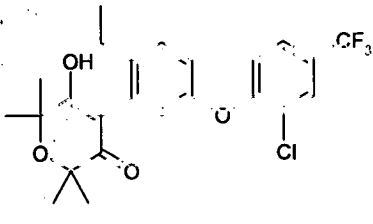
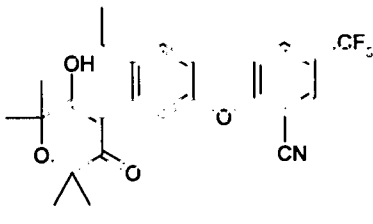
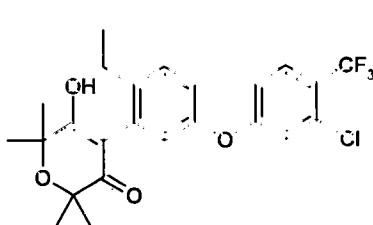
Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
A-70		d ₄ -MeOH: δ 7.30 (dd, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.10-7.00 (m, 2H), 6.80 (m, 1H), 6.51 (d, 1H), 2.41 (m, 6H), 1.17 (s, 3H), 1.14 (s, 3H), 1.07 (t, 3H)
A-71		d ₄ -MeOH: δ 7.49 (d, 1H), 7.23 (m, 2H), 6.98 (d, 1H), 6.85 (dd, 1H), 6.56 (d, 1H), 2.40 (m, 6H), 1.17 (s, 3H), 1.14 (s, 3H), 1.08 (t, 3H)
A-72		δ 8.18 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.04 (dd, 1H), 6.89 (d, 1H), 6.83 (d, 1H), 6.81 (dd, 1H), 5.36 (br. s, 1H), 2.46 (q, 2H), 1.53 (s, 6H), 1.51 (s, 6H), 1.14 (t, 3H).
A-73		δ 7.73 (d, 1H), 7.46 (dd, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.05 (dd, 1H), 6.96 (d, 1H), 6.83 (d, 1H), 2.45 - 2.41 (br. m, 2H), 1.56 - 1.44 (br. m, 1H), 1.13 (t, 3H).
A-74		δ 7.93 (s, 1H), 7.70 (dd, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.07 (dd, 1H), 7.01 (d, 1H), 6.86 (d, 1H), 2.51 - 2.36 (br. m, 2H), 1.56 - 1.45 (br. m, 12H), 1.13 (t, 3H).
A-75		δ 7.58 (dd, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.11 - 7.10 (m, 1H), 7.08 - 7.05 (m, 1H), 6.94 - 6.91 (m, 1H), 6.83 - 6.82 (m, 1H), 3.60 (br. s, 1H), 2.45 - 2.44 (m, 2H), 1.57 - 1.45 (m, 12H), 1.15 - 1.11 (m, 3H).
A-76		δ 7.73 (d, 1H), 7.41 - 7.39 (m, 2H), 7.14 (dd, 1H), 7.06 (dd, 1H), 6.83 (d, 1H), 5.78 (br. s, 1H), 2.47 - 2.44 (br. m, 2H), 1.56 - 1.44 (br. m, 12H), 1.13 (t, 3H).

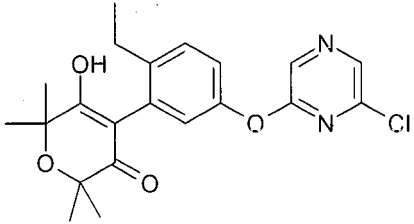
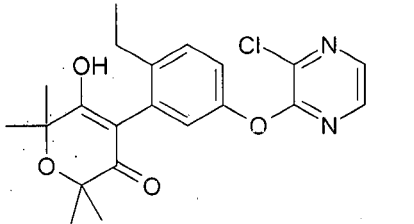
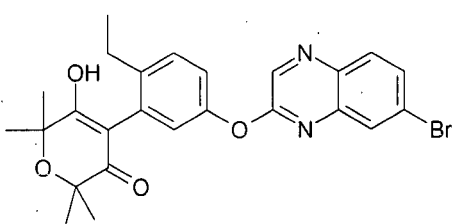
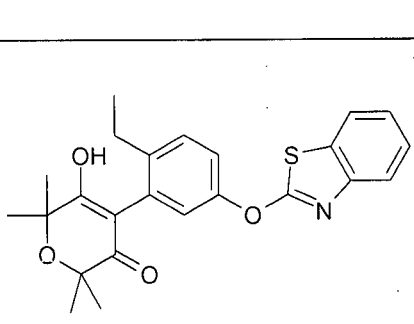
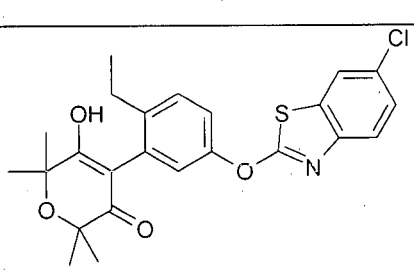
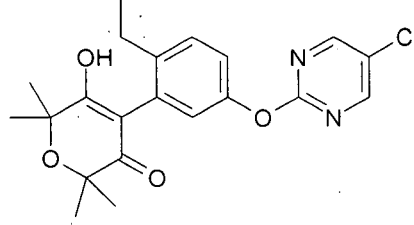
Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
A-77		δ 7.70 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.34 (d, 1H), 7.27 - 7.24 (m, 1H), 7.03 (dd, 1H), 6.82 (d, 1H), 6.08 (br. s, 1H), 2.49 - 2.42 (m, 2H), 1.57 (d, 6H), 1.44 (d, 6H), 1.13 (t, 3H).
A-78		δ 7.87 (s, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.01 (dd, 1H), 6.97 (d, 1H), 6.83 (d, 1H), 5.63 (br. s, 1H), 2.47 - 2.39 (m, 2H), 1.58 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.12 (t, 3H).
A-79		δ 7.59 - 7.56 (m, 2H), 7.36 (d, 1H), 7.05 - 7.01 (m, 3H), 6.81 (d, 1H), 5.72 (br. s, 1H), 2.47 - 2.40 (m, 2H), 1.57 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.12 (t, 3H).
A-80		δ 7.23 (s, 1H), 7.01 (d, 1H), 6.88 (dd, 1H), 6.82 - 6.79 (m, 1H), 6.74 (d, 1H), 6.69 (d, 1H), 5.59 (br. s, 1H), 3.92 (br. s, 2H), 2.44 - 2.32 (m, 2H), 1.58 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.08 (t, 3H).
A-81		δ 7.32 (d, 1H), 7.05 (dd, 1H), 6.84 (d, 1H), 6.26 (br. s, 2H), 2.47 - 2.41 (m, 5H), 1.53 (s, 6H), 1.50 (s, 6H), 1.12 (t, 3H).
A-82		d ₄ -MeOH: δ 8.73 (s, 1H), 8.03 (m, 1H), 7.70 (m, 2H), 7.37 (d, 1H), 7.19 (dd, 1H), 6.87 (d, 1H), 2.40-2.50 (m, 6H), 1.10-1.20 (m, 9H)
A-83		d ₄ -MeOH: δ 8.40 (s, 1H), 8.05 (m, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 7.04 (dd, 1H), 6.74 (d, 1H), 2.40-2.50 (m, 6H), 1.10-1.20 (m, 9H)

Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-84		$d_4\text{-MeOH}$: δ 8.02 (d, 1H), 7.96 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.00 (dd, 1H), 6.70 (d, 1H), 2.45 (m, 6H), 1.18 (s, 3H), 1.15 (s, 3H), 1.11 (t, 3H)
A-85		$d_4\text{-MeOH}$: δ 7.88 (d, 1H), 7.85 (dd, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.07 (dd, 1H), 6.77 (d, 1H), 2.45 (m, 6H), 1.21 (s, 3H), 1.18 (s, 3H), 1.14 (t, 3H)
A-86		$d_4\text{-MeOH}$: δ 8.29 (d, 1H), 8.26 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.08 (dd, 1H), 6.80 (d, 1H), 2.40-2.50 (m, 6H), 1.10-1.20 (m, 9H)
A-87		$d_4\text{-MeOH}$: δ 7.65 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.10 (t, 1H), 6.96 (dd, 1H), 6.67 (d, 1H), 2.44 (m, 6H), 1.18 (s, 3H), 1.15 (s, 3H), 1.10 (t, 3H)
A-88		$d_4\text{-MeOH}$ δ 7.30 (m, 2H, isómeros A y B), 7.23 (m, 1H, isómeros A y B), 7.00 (m, 2H, isómeros A y B), 6.89 (m, 1H, isómeros A y B), 6.62 (d, 0.6H, isómero A), 6.56 (d, 0.4H, isómero B), 3.00 (m, 2H, isómeros A y B), 2.46 (q, 0.8H, isómero B), 2.33 (q, 1.2H, isómero A), 2.20 (m, 3H, isómeros A y B), 1.85 (m, 2H, isómeros A y B), 1.70 (m, 1H, isómeros A y B), 1.10 (m, 3H, isómeros A y B)
A-89		$d_4\text{-MeOH}$: δ 7.28 (m, 1H, isómeros A y B), 7.20 (m, 1H, isómeros A y B), 7.00 - 7.12 (m, 2H, isómeros A y B), 6.83 (m, 1H, isómeros A y B), 6.56 (d, 0.6H, isómero A), 6.52 (d, 0.4H, isómero B), 2.96 (br. s, 2H,

Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
		isómeros A y B), 2.44 (q, 0.8H, isómero B), 2.30 (q, 1.2H, isómero A), 2.20 (m, 3H, isómeros A y B), 1.80 (m, 2H, isómeros A y B), 1.68 (m, 1H, isómeros A y B), 1.05 (m, 3H, isómeros A y B).
A-90		d ₄ -MeOH: δ 7.50 (m, 1H, isómeros A y B), 7.22 (m, 2H, isómeros A y B), 6.98 (m, 1H, isómeros A y B), 6.82 (m, 1H, isómeros A y B), 6.56 (d, 0.6H, isómero A), 6.52 (d, 0.4H, isómero B), 2.97 (br. s, 2H, isómeros A y B), 2.44 (q, 0.8H, isómero B), 2.30 (q, 1.2H, isómero A), 2.20 (m, 3H, isómeros A y B), 1.80 (m, 2H, isómeros A y B), 1.67 (m, 1H, isómeros A y B), 1.05 (m, 3H, isómeros A y B).
A-91		d ₄ -MeOH: δ 7.40 (m, 2H, isómeros A y B), 7.20 (m, 1H, isómeros A y B), 6.90 (m, 3H, isómeros A y B), 6.59 (d, 0.6H, isómero A), 6.53 (d, 0.4H, isómero B), 2.96 (br. s, 2H, isómeros A y B), 2.44 (q, 0.8H, isómero B), 2.30 (q, 1.2H, isómero A), 2.15 (m, 3H, isómeros A y B), 1.80 (m, 2H, isómeros A y B), 1.65 (m, 1H, isómeros A y B), 1.05 (m, 3H, isómeros A y B).
A-92		d ₄ -MeOH: δ 7.20 (m, 1H, isómeros A y B), 7.00 (m, 4H, isómeros A y B), 6.82 (m, 1H, isómeros A y B), 6.55 (d, 0.6H, isómero A), 6.50 (d, 0.4H, isómero B), 2.96 (br. s, 2H, isómeros A

Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
		y B), 2.43 (q, 0.8H, isómero B), 2.30 (q, 1.2H, isómero A), 2.18 (m, 3H, isómeros A y B), 1.80 (m, 2H, isómeros A y B), 1.68 (m, 1H, isómeros A y B), 1.05 (m, 3H, isómeros A y B).
A-93		d ₄ -MeOH δ 7.35-7.20 (m, 2H, isómeros A y B), 6.92-6.75 (m, 3H, isómeros A y B), 6.63 (d, 0.65H, isómero A), 6.55 (d, 0.35H, isómero B), 2.55-2.30 (m, 4H, isómeros A y B), 2.05-1.90 (m, 1H, isómeros A y B), 1.80-1.70 (m, 2H, isómeros A y B), 1.15-0.95 (m, 12H, isómeros A y B).
A-94		d ₄ -MeOH: δ 7.50 (m, 1H, isómeros A y B), 7.22 (m, 2H, isómeros A y B), 7.00 (m, 1H, isómeros A y B), 6.83 (m, 1H, isómeros A y B), 6.58 (d, 0.65H, isómero A), 6.51 (d, 0.35H, isómero B), 2.55-2.30 (m, 4H, isómeros A y B), 2.05-1.90 (m, 1H, isómeros A y B), 1.80-1.70 (m, 2H, isómeros A y B), 1.15-0.95 (m, 12H, isómeros A y B).
A-95		d ₄ -MeOH: δ 7.28 (m, 1H, isómeros A y B), 7.22 (m, 1H, isómeros A y B), 7.12-7.00 (m, 2H, isómeros A y B), 6.82 (m, 1H, isómeros A y B), 6.60 (d, 0.65H, isómero A), 6.52 (d, 0.35H, isómero B), 2.53 (m, 1H, isómeros A y B), 2.50-2.28 (m, 3H, isómeros A y B), 2.05-1.90 (m, 1H, isómeros A y B), 1.80-1.70 (m, 2H, isómeros A y B), 1.15-1.00 (m, 12H, isómeros A y B).

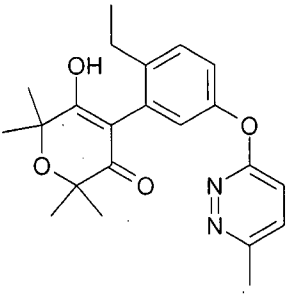
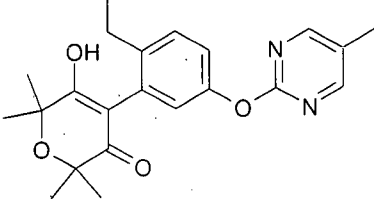
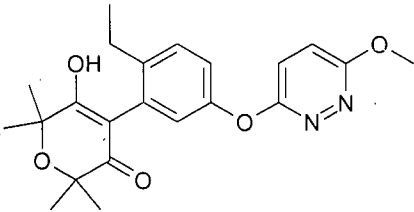
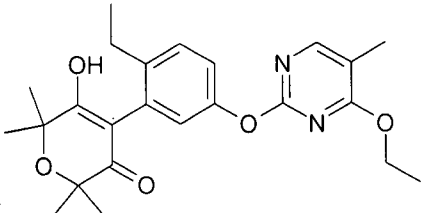
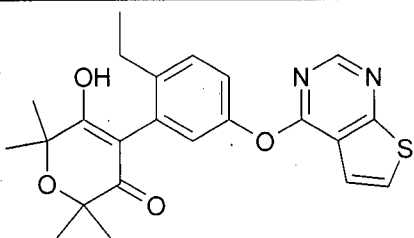
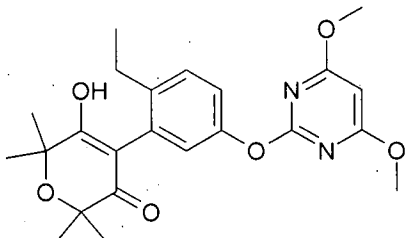
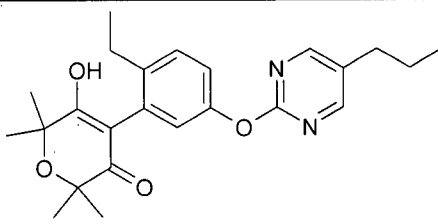
Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
A-96		d ₄ -MeOH: δ 7.30-7.00 (m, 3H, isómeros A y B), 6.96 (m, 2H, isómeros A y B), 6.86 (m, 1H, isómeros A y B), 6.60 (d, 0.65H, isómero A), 6.51 (d, 0.35H, isómero B), 2.54 (m, 1H, isómeros A y B), 2.50-2.28 (m, 3H, isómeros A y B), 2.05-1.90 (m, 1H, isómeros A y B), 1.80-1.68 (m, 2H, isómeros A y B), 1.15-1.00 (m, 12H, isómeros A y B).
A-97		δ 7.56 (d, 2H), 7.34 (d, 1H), 7.05 (d, 2H), 7.02 (dd, 1H), 6.81 (d, 1H), 5.70 (br. s, 1H), 2.47 - 2.39 (m, 2H), 1.57 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.12 (t, 3H).
A-98		δ 8.49 (s, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.08 (dd, 1H), 7.02 (s, 1H), 6.86 (d, 1H), 2.51 - 2.43 (m, 2H), 1.58 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.14 (t, 3H).
A-99		δ 7.71 (s, 1H), 7.44 - 7.42 (m, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.00 (dd, 2H), 6.82 (d, 1H), 5.63 (s, 1H), 2.47 - 2.39 (m, 2H), 1.58 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.12 (t, 3H).
A-100		δ 7.86 (d, 1H), 7.70 (dd, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.09 - 7.05 (m, 2H), 6.89 (d, 1H), 6.12 (br. s, 1H), 2.51 - 2.42 (m, 2H), 1.57 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.13 (t, 3H).
A-101		δ 7.60 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 7.05 (dd, 1H), 6.82 (d, 1H), 6.91 (dd, 1H), 5.65 (br. s, 1H), 2.46 - 2.42 (br. m, 2H), 1.59 (br. d, 6H), 1.47 (br. d, 6H), 1.13 (t, 3H).

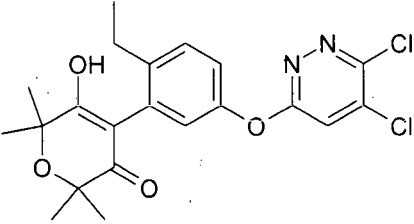
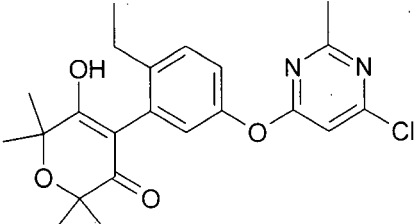
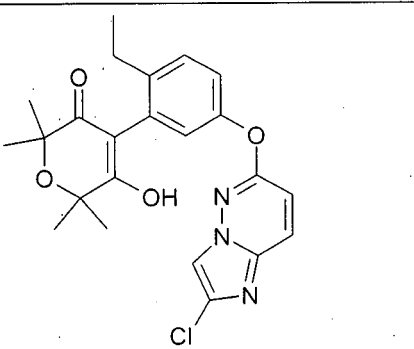
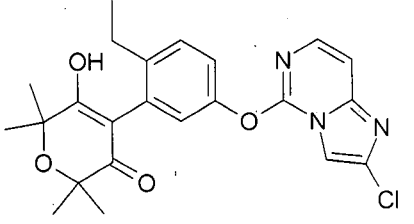
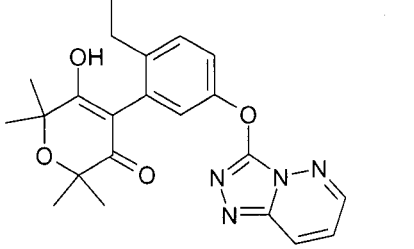
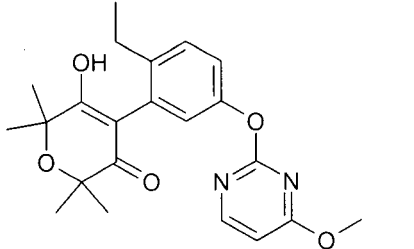
Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ ; a menos que se indique) u otros datos físicos
A-102		δ 8.33 (s, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.12 (dd, 1H), 6.89 (d, 1H), 2.50 - 2.43 (m, 2H), 1.58 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.14 (t, 3H).
A-103		δ 8.05 (d, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.91 (d, 1H), 2.53 - 2.40 (m, 2H), 1.57 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.14 (t, 3H).
A-104		δ 8.72 (s, 1H), 7.93 (d, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.71 (dd, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.22 (dd, 1H), 6.99 (d, 1H), 2.51 - 2.47 (br. m, 2H), 1.55 - 1.46 (br. m, 12H), 1.17 (t, 3H).
A-105		δ 7.71 - 7.67 (m, 1H), 7.59 - 7.56 (m, 1H), 7.42 - 7.36 (m, 2H), 7.31 - 7.23 (m, 2H), 7.07 - 7.06 (m, 1H), 2.54 - 2.46 (m, 2H), 1.61 - 1.57 (m, 6H), 1.50 - 1.46 (m, 6H), 1.19 - 1.14 (m, 3H).
A-106		δ 7.65 (d, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.32 (dd, 1H), 7.27 - 7.24 (m, 1H), 7.05 (d, 1H), 2.53 - 2.42 (m, 2H), 1.58 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.14 (t, 3H).
A-107		δ 8.46 (s, 2H), 7.39 (d, 1H), 7.15 (dd, 1H), 6.90 (d, 1H), 2.47 - 2.44 (br. m, 2H), 1.57 - 1.45 (br. m, 12H), 1.14 (t, 3H).

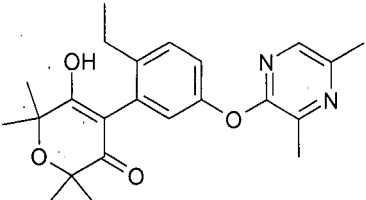
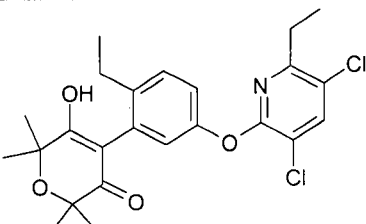
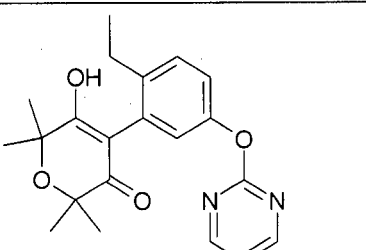
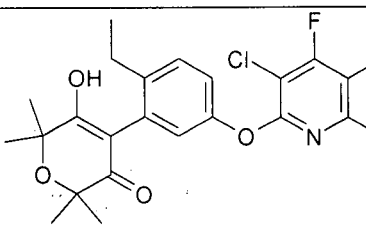
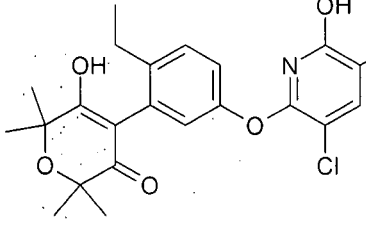
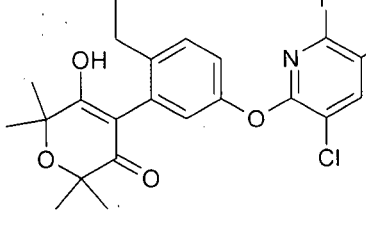
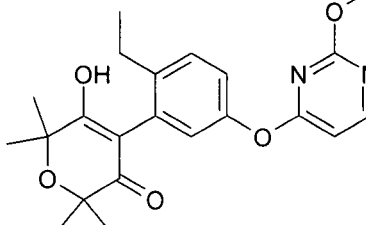
Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ ; a menos que se indique) u otros datos físicos
A-108		δ 8.76 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.19 (dd, 1H), 6.96 (d, 1H), 2.52 - 2.42 (m, 2H), 1.58 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.15 (t, 3H).
A-109		δ 8.53 (s, 2H), 7.38 (d, 1H), 7.13 (dd, 1H), 6.89 (d, 1H), 2.49 - 2.42 (m, 2H), 1.57 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.13 (t, 3H).
A-110		δ 8.77 (d, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.17 (d, 1H), 6.92 (s, 1H), 4.12 (br. s, 1H), 2.47 (q, 2H), 1.53 (br. d, 12H), 1.15 (t, 3H).
A-111		d ₄ -MeOH: δ 7.48 (m, 1H), 7.20 (m, 2H), 6.97 (m, 1H), 6.82 (m, 1H), 6.55 (d, 1H), 2.61 (m, 2H), 2.36 (m, 2H), 1.90 (m, 2H), 1.19 (s, 3H), 1.14 (s, 3H), 1.07 (t, 3H)
A-112		d ₄ -MeOH: δ 7.29 (dd, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.10-7.00 (m, 2H), 6.84 (m, 1H), 6.55 (d, 1H), 2.61 (m, 2H), 2.35 (m, 2H), 1.90 (m, 2H), 1.19 (s, 3H), 1.14 (s, 3H), 1.06 (t, 3H)
A-113		d ₄ -MeOH: δ 7.45 (m, 2H), 7.25 (d, 1H), 7.00-6.85 (m, 3H), 6.57 (d, 1H), 2.62 (m, 2H), 2.38 (m, 2H), 1.92 (m, 2H), 1.30-1.00 (m, 12H)
A-114		d ₄ -MeOH: δ 7.40 (dd, 1H), 7.22 (m, 2H), 7.00 (t, 1H), 6.85 (m, 1H), 6.55 (d, 1H), 2.62 (m, 2H), 2.35 (m, 2H), 1.91 (m, 2H), 1.19 (s, 3H), 1.15 (s, 3H), 1.06 (t, 3H)

137

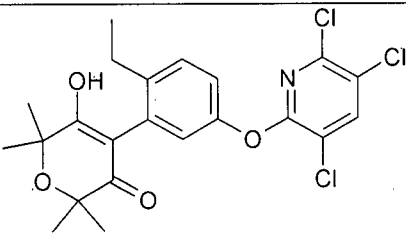
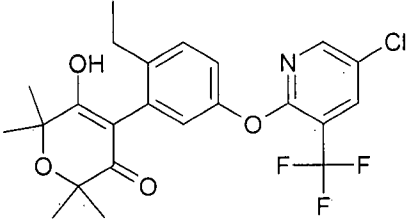
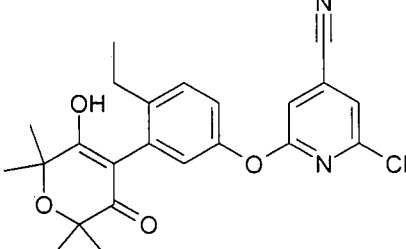
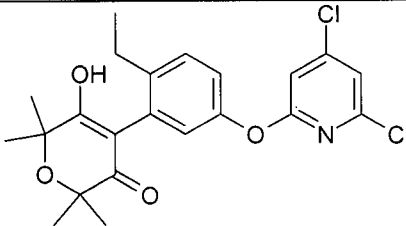
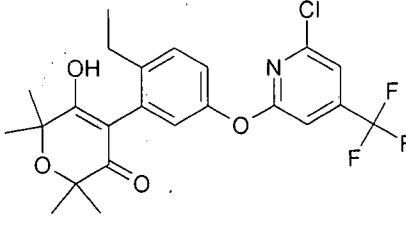
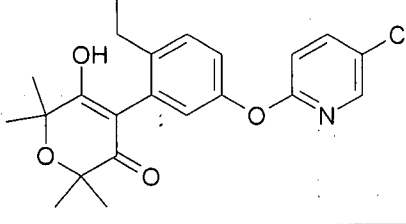
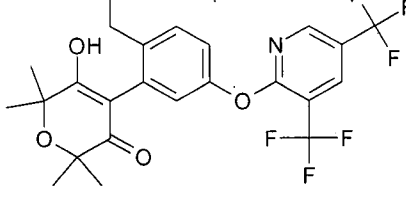
Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-115		d_6 -DMSO: δ 7.43 - 7.37 (m, 2H), 7.09 - 7.08 (m, 1H), 2.39 (q, 2H), 1.42 (br. app. s, 12H), 1.06 (t, 3H).
A-116		LCMS (Método A): t_r = 1.73 mins, MH^+ = 410
A-117		LCMS (Método A): t_r = 1.73 mins, MH^+ = 410
A-118		d_4 -MeOH: δ 7.52 - 7.50 (m, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.40 - 7.39 (m, 1H), 7.33 (dd, 1H), 7.30 - 7.28 (m, 2H), 7.06 (d, 1H), 2.49 (2q, H), 1.50 (s, 6H), 1.49 (s, 6H), 1.15 (t, 3H).
A-119		LCMS (Método B): t_r = 1.59 mins, MH^+ = 417.2
A-120		LCMS (Método B): t_r = 1.79 mins, MH^+ = 477.0
A-121		LCMS (Método B): t_r = 1.61 mins, MH^+ = 417.2

Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-122		LCMS (Método B): $t_r = 1.35$ mins, $\text{MH}^+ = 383.2$
A-123		LCMS (Método B): $t_r = 1.47$ mins, $\text{MH}^+ = 383.2$
A-124		LCMS (Método B): $t_r = 1.53$ mins, $\text{MH}^+ = 399.2$
A-125		LCMS (Método B): $t_r = 1.72$ mins, $\text{MH}^+ = 427.2$
A-126		LCMS (Método B): $t_r = 1.63$ mins, $\text{MH}^+ = 425.1$
A-127		LCMS (Método B): $t_r = 1.62$ mins, $\text{MH}^+ = 429.2$
A-128		LCMS (Método B): $t_r = 1.64$ mins, $\text{MH}^+ = 411.2$

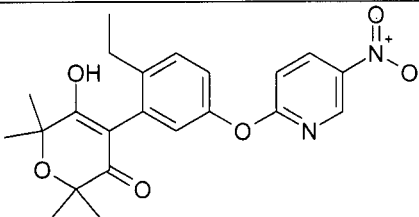
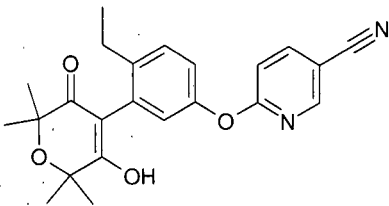
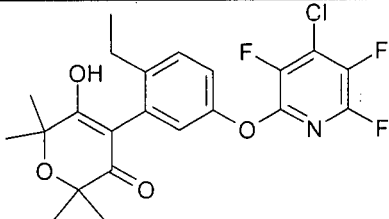
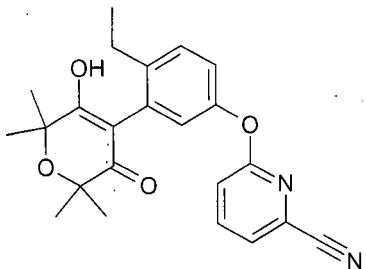
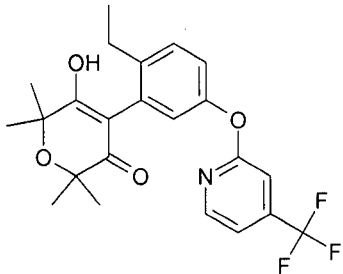
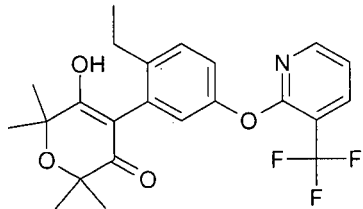
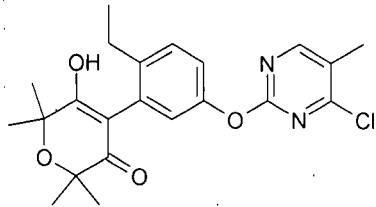
Número de Compuesto.	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 , a menos que se indique) u otros datos físicos
A-129		LCMS (Método B): $t_r = 1.62$ mins, $\text{MH}^+ = 437.1$
A-130		LCMS (Método B): $t_r = 1.62$ mins, $\text{MH}^+ = 417.2$
A-131		LCMS (Método B): $t_r = 1.61$ mins, $\text{MH}^+ = 442.1$
A-132		LCMS (Método B): $t_r = 1.58$ mins, $\text{MH}^+ = 442.1$
A-133		LCMS (Método B): $t_r = 1.36$ mins, $\text{MH}^+ = 409.2$
A-134		LCMS (Método B): $t_r = 1.53$ mins, $\text{MH}^+ = 399.2$

Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
A-135		LCMS (Método B): t _r = 1.55 mins, MH ⁺ = 397.2
A-136		LCMS (Método B): t _r = 2.05 mins, MH ⁺ = 464.0
A-137		LCMS (Método B): t _r = 1.40 mins, MH ⁺ = 369.2
A-138		LCMS (Método B): t _r = 1.68 mins, MH ⁺ = 472.1
A-139		δ 7.68 (s, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.10 (dd, 1H), 6.84 (d, 1H), 2.49 - 2.39 (m, 2H), 1.59 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.13 (t, 3H).
A-140		δ 7.88 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.15 (dd, 1H), 6.89 (d, 1H), 2.49 - 2.39 (m, 2H), 1.59 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.15 (t, 3H).
A-141		LCMS (Método B): t _r = 1.67 mins, MH ⁺ = 429.0

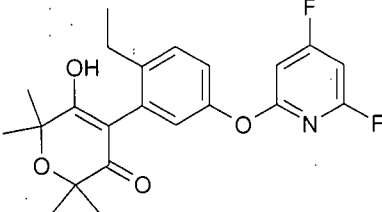
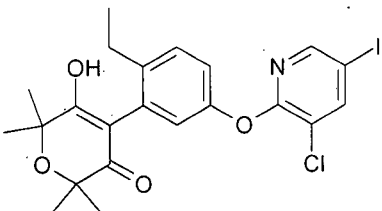
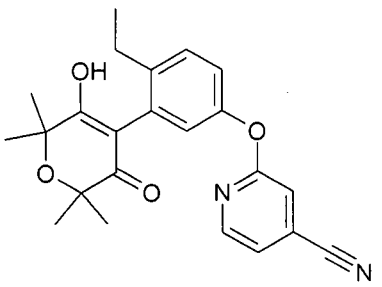
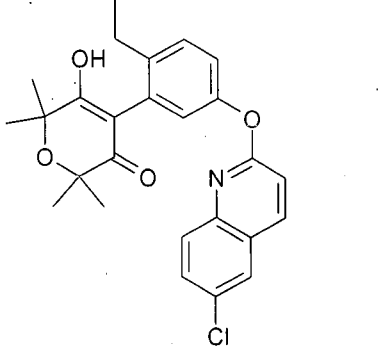
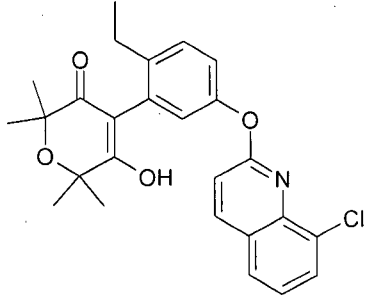
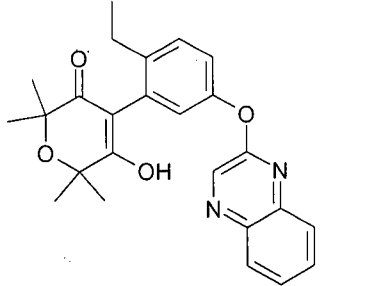
141

Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
A-142		LCMS (Método B): t _r = 1.92 mins, MH ⁺ = 470.1
A-143		LCMS (Método B): t _r = 1.87 mins, MH ⁺ = 470.1
A-144		LCMS (Método B): t _r = 1.72 mins, MH ⁺ = 427.1
A-145		LCMS (Método B): t _r = 1.85 mins, MH ⁺ = 436.1
A-146		LCMS (Método B): t _r = 1.89 mins, MH ⁺ = 470.1
A-147		LCMS (Método B): t _r = 1.72 mins, MH ⁺ = 402.1
A-148		LCMS (Método B): t _r = 1.90 mins, MH ⁺ = 504.2

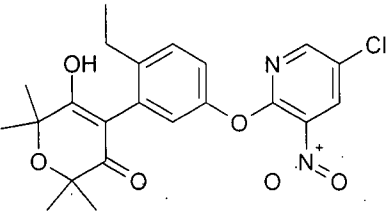
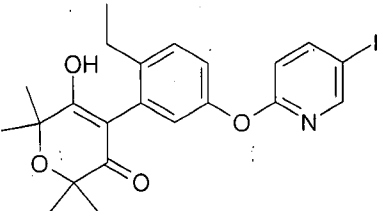
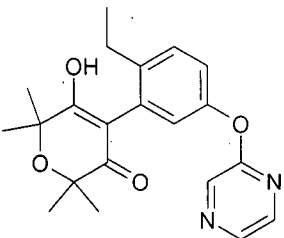
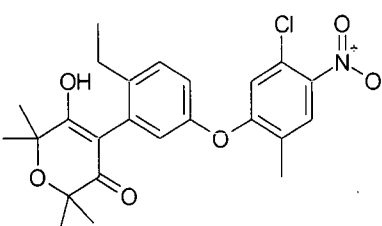
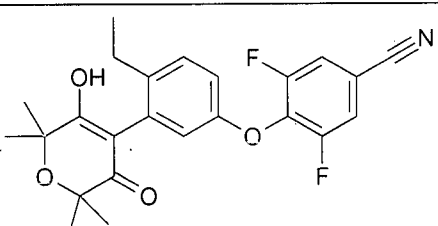
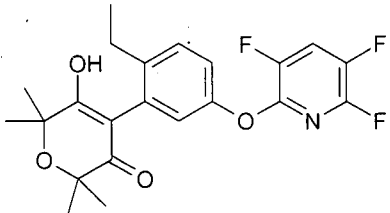
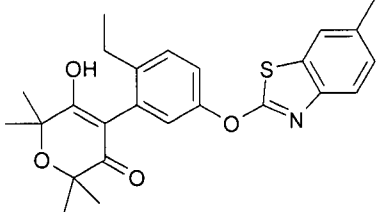
142

Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 , a menos que se indique) u otros datos físicos
A-149		LCMS (Método B): $t_r = 1.65$ mins, $\text{MH}^+ = 413.2$
A-150		LCMS (Método B): $t_r = 1.59$ mins, $\text{MH}^+ = 393.2$
A-151		LCMS (Método B): $t_r = 1.84$ mins, $\text{MH}^+ = 456.1$
A-152		LCMS (Método B): $t_r = 1.61$ mins, $\text{MH}^+ = 393.2$
A-153		LCMS (Método B): $t_r = 1.78$ mins, $\text{MH}^+ = 436.2$
A-154		LCMS (Método B): $t_r = 1.74$ mins, $\text{MH}^+ = 436.2$
A-155		LCMS (Método B): $t_r = 1.63$ mins, $\text{MH}^+ = 417.2$

143

Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-156		LCMS (Método B): $t_r = 1.71$ mins, $\text{MH}^+ = 404.2$
A-157		LCMS (Método B): $t_r = 1.90$ mins, $\text{MH}^+ = 528.0$
A-158		LCMS (Método B): $t_r = 1.60$ mins, $\text{MH}^+ = 393.2$
A-159		δ 8.09 (d, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.54 (dd, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.16 (dd, 1H), 6.99 (d, 1H), 2.52 (q, 2H), 1.56 - 1.51 (br. m, 12H), 1.19 (t, 3H).
A-160		LCMS (Método B): $t_r = 1.87$ mins, $\text{MH}^+ = 452.2$
A-161		LCMS (Método B): $t_r = 1.67$ mins, $\text{MH}^+ = 419.2$

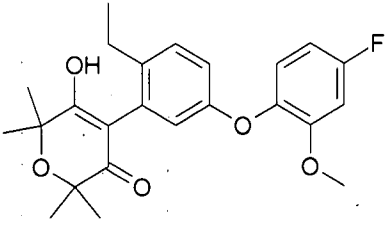
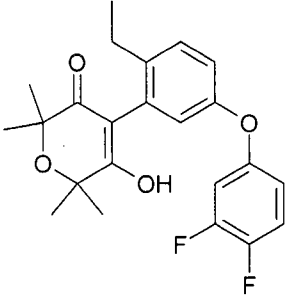
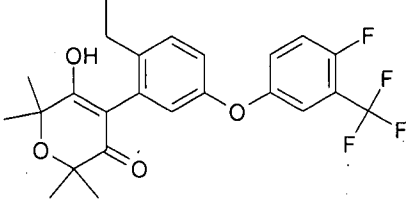
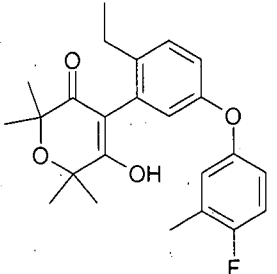
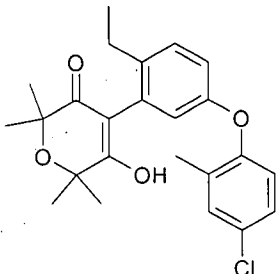
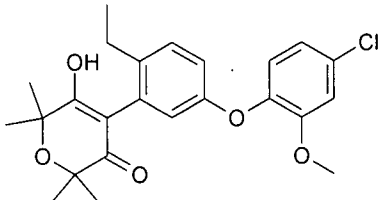
144

Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-162		LCMS (Método B): $t_r = 1.72$ mins, $\text{MH}^+ = 447.1$
A-163		LCMS (Método B): $t_r = 1.79$ mins, $\text{MH}^+ = 494.1$
A-164		LCMS (Método B): $t_r = 1.45$ mins, $\text{MH}^+ = 369.2$
A-165		δ 7.95 - 7.91 (m, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.03 (dd, 1H), 6.91 (d, 1H), 6.84 (d, 1H), 5.62 (br. s, 1H), 2.52 - 2.43 (m, 2H), 2.35 (d, 3H), 1.61 (d, 6H), 1.49 (d, 6H), 1.16 (t, 3H).
A-166		δ 7.37 - 7.35 (m, 2H), 7.29 (d, 1H), 6.88 (dd, 1H), 6.75 (d, 1H), 5.67 (br. s, 1H), 2.48 - 2.37 (m, 2H), 1.61 - 1.59 (m, 6H), 1.48 (d, 6H), 1.11 (t, 3H).
A-167		δ 7.54 (q, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.12 (dd, 1H), 6.89 (d, 1H), 2.51 - 2.43 (m, 2H), 1.59 (d, 6H), 1.48 (d, 6H), 1.15 (t, 3H).
A-168		δ 7.48 (d, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.28 - 7.25 (m, 1H), 7.17 (dd, 1H), 7.06 (d, 1H), 2.50 - 2.43 (m, 5H), 1.60 - 1.47 (m, 12H), 1.15 (t, 3H).

MS

Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-169		LCMS (Método B): $t_r = 1.54$ mins, $\text{MH}^+ = 433.1$
A-170		LCMS (Método B): $t_r = 1.59$ mins, $\text{MH}^+ = 433.1$
A-171		LCMS (Método B): $t_r = 1.72$ mins, $\text{MH}^+ = 402.1$
A-172		δ 8.75 (s, 1H), 7.75 - 7.71 (m, 2H), 7.44 (d, 2H), 7.22 (dd, 1H), 7.02 (d, 1H), 2.58 - 2.46 (m, 2H), 1.60 (d, 6H), 1.51 (d, 6H), 1.19 (t, 3H).
A-173		δ 7.97 (dd, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.42 - 7.36 (m, 2H), 7.24 (dd, 1H), 7.03 (d, 1H), 2.56 - 2.48 (m, 2H), 1.60 (d, 6H), 1.49 (d, 6H), 1.19 (t, 3H).
A-174		δ 8.18 (d, 1H), 7.79 (d, 2H), 7.74 - 7.70 (m, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.24 (dd, 1H), 7.05 (d, 1H), 2.56 - 2.48 (m, 2H), 1.59 (d, 6H), 1.48 (d, 6H), 1.19 (t, 3H).
A-175		LCMS (Método B): $t_r = 1.84$ mins, $\text{MH}^+ = 399.2$

146

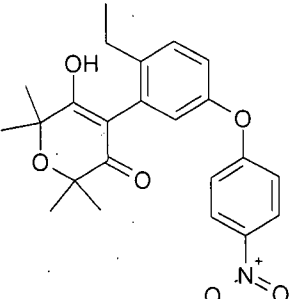
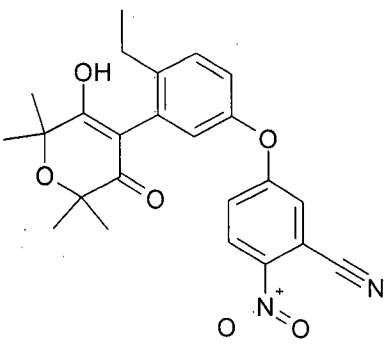
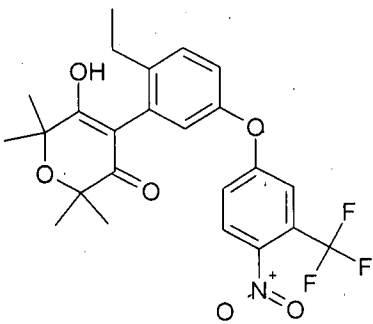
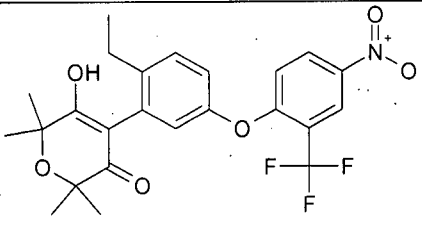
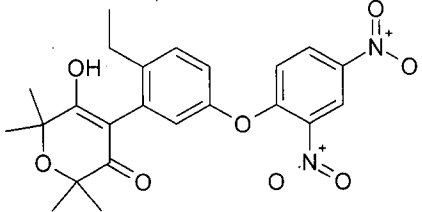
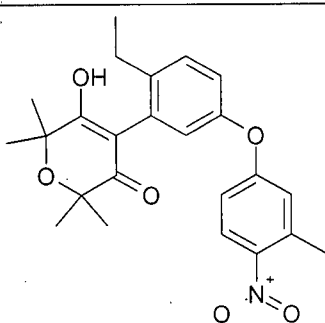
Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 , a menos que se indique) u otros datos físicos
A-176		LCMS (Método B): $t_r = 1.72$ mins, $\text{MH}^+ = 415.2$
A-177		LCMS (Método B): $t_r = 1.79$ mins, $\text{MH}^+ = 403.2$
A-178		LCMS (Método B): $t_r = 1.89$ mins, $\text{MH}^+ = 453.2$
A-179		LCMS (Método B): $t_r = 1.83$ mins, $\text{MH}^+ = 399.2$
A-180		LCMS (Método B): $t_r = 1.92$ mins, $\text{MH}^+ = 415.2$
A-181		LCMS (Método B): $t_r = 1.80$ mins, $\text{MH}^+ = 431.2$

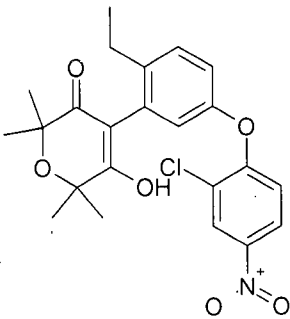
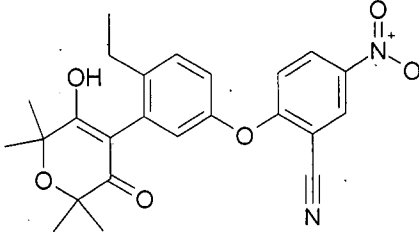
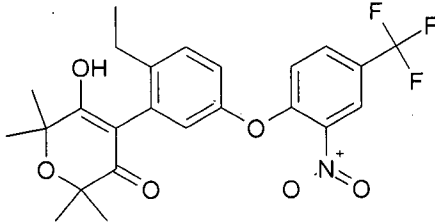
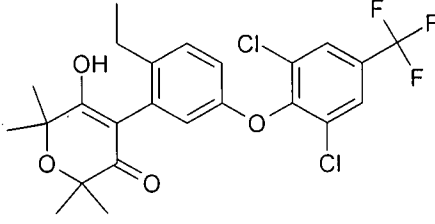
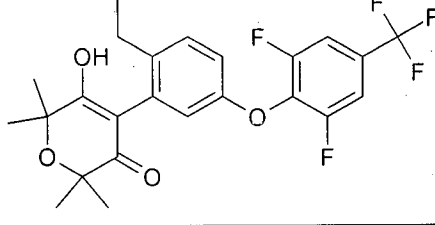
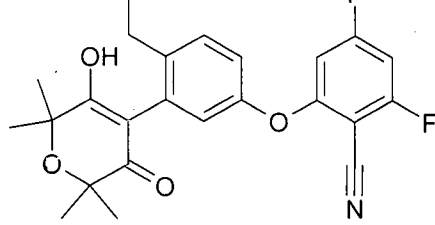
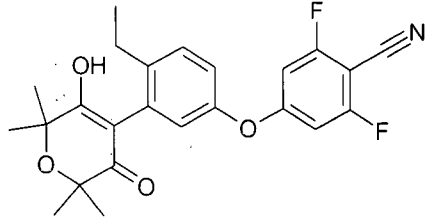
147

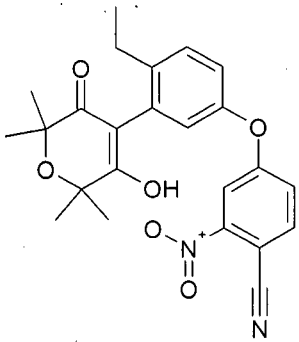
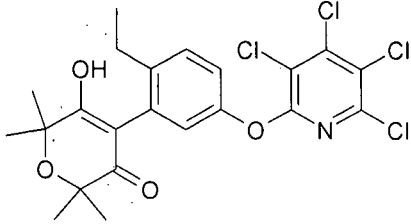
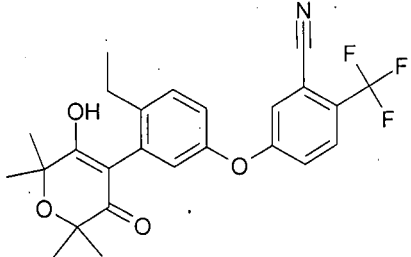
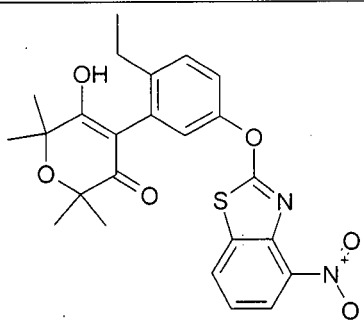
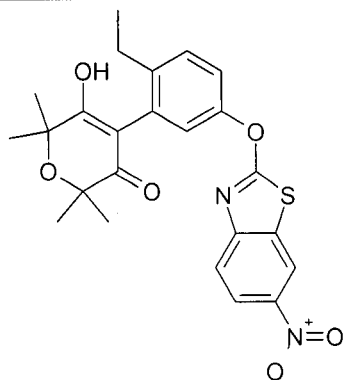
Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 , a menos que se indique) u otros datos físicos
A-182		LCMS (Método B): $t_r = 1.95$ mins, $\text{MH}^+ = 435.1$
A-183		LCMS (Método B): $t_r = 1.97$ mins, $\text{MH}^+ = 469.1$
A-184		LCMS (Método B): $t_r = 1.93$ mins, $\text{MH}^+ = 415.2$
A-185		LCMS (Método B): $t_r = 1.88$ mins, $\text{MH}^+ = 435.2$
A-186		LCMS (Método B): $t_r = 1.86$ mins, $\text{MH}^+ = 437.2$
A-187		LCMS (Método B): $t_r = 1.76$ mins, $\text{MH}^+ = 411.2$
A-188		δ 7.47 (d, 1H), 7.45 - 7.43 (m, 1H), 7.38 - 7.34 (m, 2H), 7.26 - 7.22 (m, 1H), 7.11 (d, 1H), 2.53 - 2.44 (m, 2H), 1.60 (d, 6H), 1.49 (d, 6H), 1.15 (t, 3H).

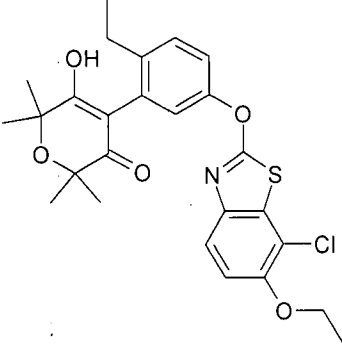
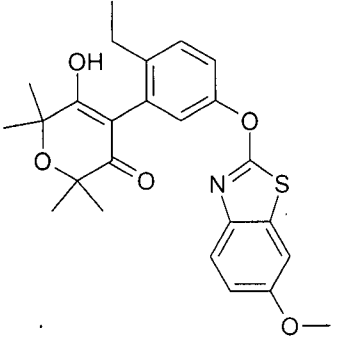
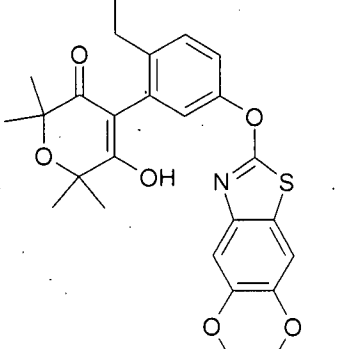
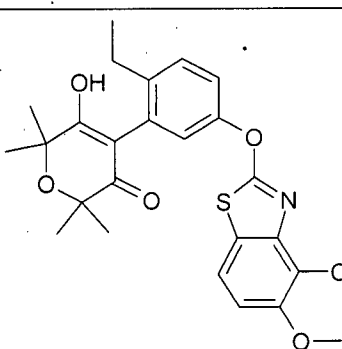
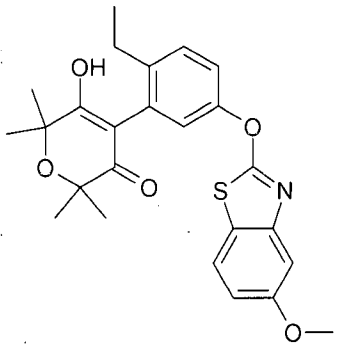
148

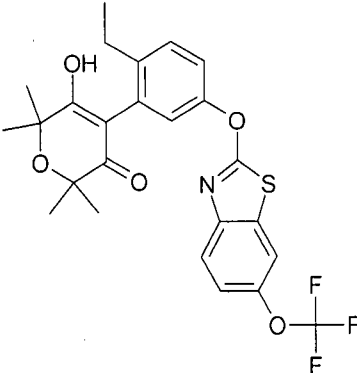
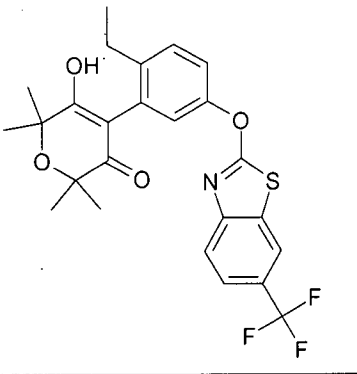
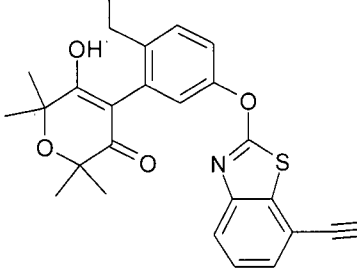
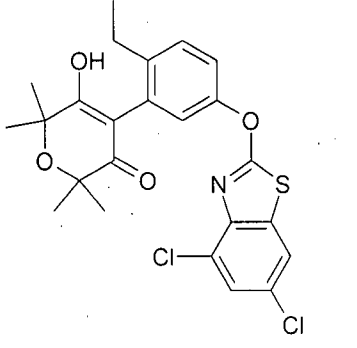
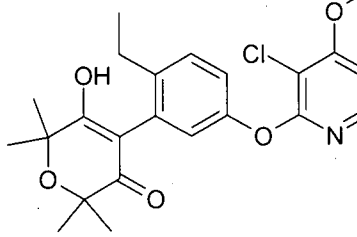
Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 , a menos que se indique) u otros datos físicos
A-189		δ 7.60 (d, 1H), 7.34 - 7.30 (m, 2H), 6.94 (dd, 1H), 6.90 (d, 1H), 6.65 (d, 1H), 3.74 (q, 4H), 2.65 - 2.55 (br. m, 4H), 2.41 - 2.37 (br. m, 2H), 1.72 - 1.66 (m, 4H), 1.10 (t, 3H).
A-190		δ 7.42 (d, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.92 - 6.88 (m, 2H), 6.61 (d, 1H), 3.72 (q, 4H), 2.58 - 2.48 (br. m, 4H), 2.39 - 2.31 (m, 2H), 1.67 - 1.62 (m, 4H), 1.07 (t, 3H).
A-191		δ 8.08 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.54 (dd, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.19 (d, 1H), 7.15 (dd, 1H), 6.93 (d, 1H), 3.73 (dt, 4H), 2.58 (q, 4H), 2.48 (q, 2H), 1.73 - 1.71 (m, 2H), 1.68 - 1.65 (m, 2H), 1.17 (t, 3H).
A-192		LCMS (Método B): t_r = 1.74 mins, MH^+ = 438.1
A-193		LCMS (Método B): t_r = 1.88 mins, MH^+ = 458.1
A-194		LCMS (Método B): t_r = 1.92 mins, MH^+ = 475.1

Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-195		LCMS (Método B): $t_r = 1.75$ mins, $\text{MH}^+ = 412.2$
A-196		LCMS (Método B): $t_r = 1.71$ mins, $\text{MH}^+ = 437.2$
A-197		LCMS (Método B): $t_r = 1.86$ mins, $\text{MH}^+ = 480.2$
A-198		LCMS (Método B): $t_r = 1.88$ mins, $\text{MH}^+ = 480.2$
A-199		LCMS (Método B): $t_r = 1.75$ mins, $\text{MH}^+ = 457.2$
A-200		LCMS (Método B): $t_r = 1.81$ mins, $\text{MH}^+ = 426.2$

Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-201		LCMS (Método B): $t_r = 1.83$ mins, $\text{MH}^+ = 446.1$
A-202		LCMS (Método B): $t_r = 1.72$ mins, $\text{MH}^+ = 437.2$
A-203		LCMS (Método B): $t_r = 1.85$ mins, $\text{MH}^+ = 480.2$
A-204		LCMS (Método B): $t_r = 1.97$ mins, $\text{MH}^+ = 503.1$
A-205		δ 7.31 (d, 1H), 7.26 (d, 1H), 6.85 (dd, 1H), 6.77 (d, 1H), 6.18 (br. s, 1H), 2.44 - 2.36 (m, 2H), 1.59 (d, 6H), 1.47 (d, 6H), 1.10 (t, 3H).
A-206		δ 7.38 (d, 1H), 7.06 (dd, 1H), 6.89 (d, 1H), 6.61 (td, 1H), 6.53 (dt, 1H), 2.50 - 2.43 (m, 2H), 1.58 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.14 (t, 3H).
A-207		δ 7.39 (d, 1H), 7.09 - 7.03 (m, 1H), 6.91 - 6.83 (m, 1H), 6.67 - 6.51 (m, 2H), 2.51 - 2.44 (m, 2H), 1.59 (d, 6H), 1.47 (d, 6H), 1.15 (t, 3H).

Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-208		LCMS (Método B): $t_r = 1.69$ mins, $\text{MH}^+ = 437.2$
A-209		δ 7.41 (d, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.91 (d, 1H), 2.52 - 2.45 (m, 2H), 1.60 (d, 6H), 1.48 (d, 6H), 1.19 - 1.14 (m, 3H).
A-210		LCMS (Método B): $t_r = 1.84$ mins, $\text{MH}^+ = 460.2$
A-211		LCMS (Método B): $t_r = 1.74$ mins, $\text{MH}^+ = 469.1$
A-212		LCMS (Método B): $t_r = 1.79$ mins, $\text{MH}^+ = 469.1$

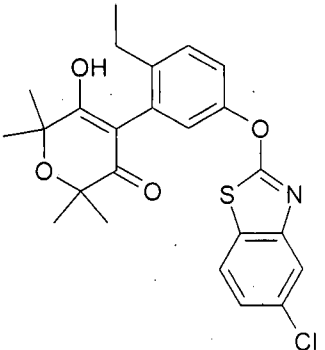
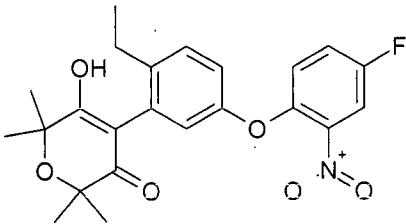
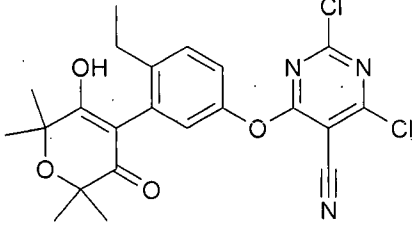
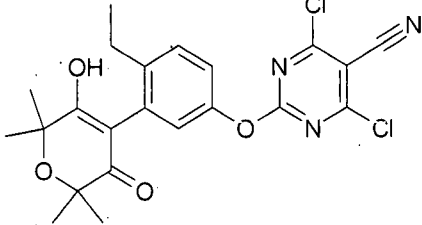
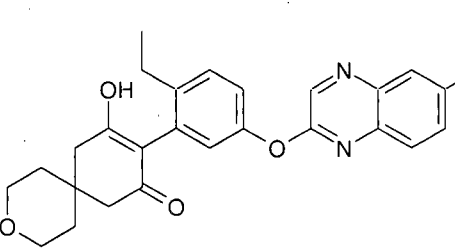
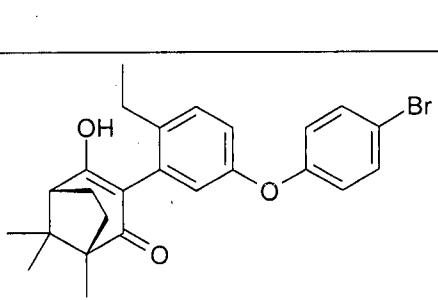
Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 , a menos que se indique) u otros datos físicos
A-213		LCMS (Método B): $t_r = 2.04$ mins, $\text{MH}^+ = 502.1$
A-214		LCMS (Método B): $t_r = 1.80$ mins, $\text{MH}^+ = 454.2$
A-215		LCMS (Método B): $t_r = 1.80$ mins, $\text{MH}^+ = 482.2$
A-216		LCMS (Método B): $t_r = 1.83$ mins, $\text{MH}^+ = 488.1$
A-217		δ 7.49 (d, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.16 (dd, 1H), 7.06 (d, 1H), 7.00 (d, 1H), 6.86 (dd, 1H), 3.76 (s, 3H), 2.48 - 2.43 (m, 2H), 1.53 - 1.44 (br. m, 12H), 1.12 (t, 3H).

Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
A-218		LCMS (Método B): t _r = 1.97 mins, MH ⁺ = 508.1
A-219		LCMS (Método B): t _r = 1.94 mins, MH ⁺ = 492.1
A-220		LCMS (Método B): t _r = 1.78 mins, MH ⁺ = 449.1
A-221		LCMS (Método B): t _r = 2.02 mins, MH ⁺ = 492.1
A-222		LCMS (Método B): t _r = 1.93 mins, MH ⁺ = 484.1

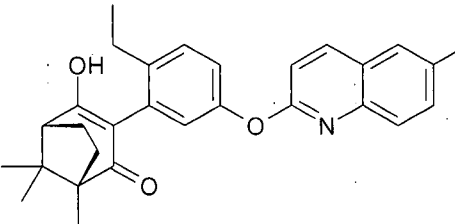
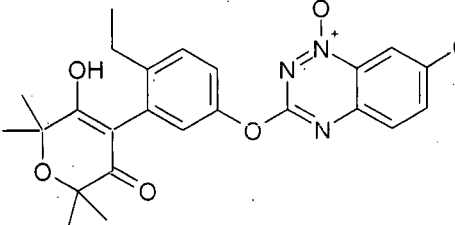
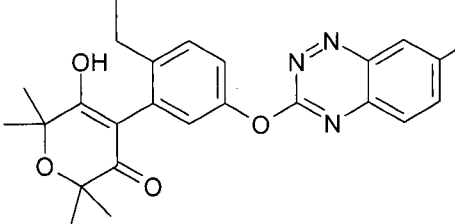
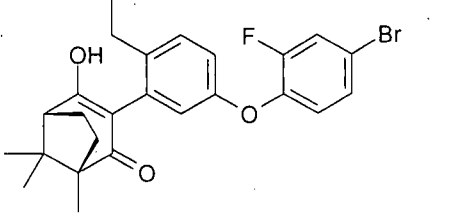
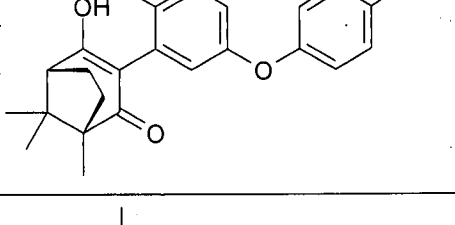
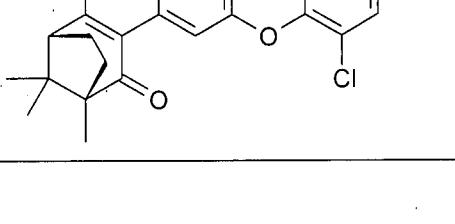
154

Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
A-223		LCMS (Método B): t _r = 1.78 mins, MH ⁺ = 418.2
A-224		LCMS (Método B): t _r = 1.80 mins, MH ⁺ = 426.1
A-225		LCMS (Método B): t _r = 1.82 mins, MH ⁺ = 470.1
A-226		LCMS (Método B): t _r = 1.82 mins, MH ⁺ = 446.1
A-227		LCMS (Método B): t _r = 1.85 mins, MH ⁺ = 490.1
A-228		δ 8.18 (d, 1H), 7.29 (d, 1H), 6.77 (dd, 1H), 6.71 (d, 1H), 2.48 - 2.37 (m, 2H), 1.61 (d, 6H), 1.48 (d, 6H), 1.12 (t, 3H).

155

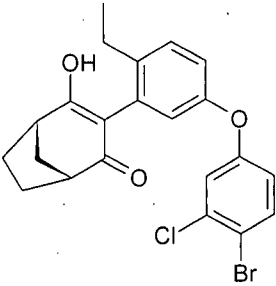
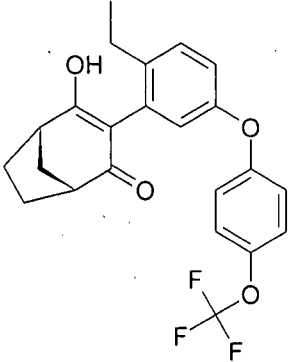
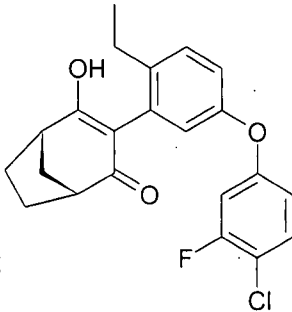
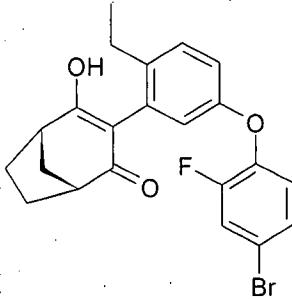
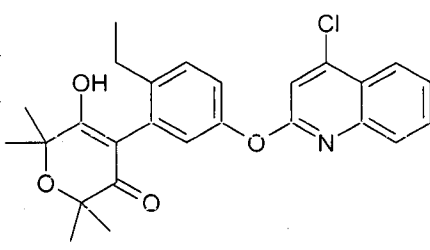
Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
A-229		LCMS (Método B): t _r = 1.92 mins, MH ⁺ = 458.1
A-230		LCMS (Método B): t _r = 1.74 mins, MH ⁺ = 430.2
A-231		LCMS (Método B): t _r = 1.47 mins, MH ⁺ = 444.0
A-232		LCMS (Método B): t _r = 1.47 mins, MH ⁺ = 444.0
A-233		δ 8.64 (s, 1H), 8.02 (d, 1H), 7.64 - 7.62 (m, 1H), 7.59 - 7.56 (m, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.19 (dd, 1H), 6.94 (d, 1H), 3.75 - 3.68 (m, 4H), 2.63 - 2.43 (m, 6H), 1.72 - 1.64 (m, 4H), 1.15 (t, 3H).
A-234		LCMS (Método A): t _r = 1.97 mins, MH ⁺ = 455

156

Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 , a menos que se indique) u otros datos físicos
A-235		LCMS (Método A): $t_r = 2.00$ mins, $\text{MH}^+ = 462$
A-236		$d_4\text{-MeOH}$: δ 8.40 (d, 1H), 7.94 (dd, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.26 (dd, 1H), 6.97 (d, 1H), 2.51 (q, 2H), 1.52 (s, 6H), 1.48 (s, 6H), 1.17 (t, 3H).
A-237		$d_4\text{-MeOH}$: δ 8.41 (d, 1H), 7.95 (dd, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.26 (dd, 1H), 6.97 (d, 1H), 2.51 (q, 2H), 1.52 (s, 6H), 1.48 (s, 6H), 1.17 (t, 3H).
A-238		LCMS (Método A): $t_r = 1.96$ mins, $\text{MH}^+ = 473$
A-239		LCMS (Método A): $t_r = 1.86$ mins, $\text{MH}^+ = 395$
A-240		LCMS (Método A): $t_r = 2.03$ mins, $\text{MH}^+ = 489$

157

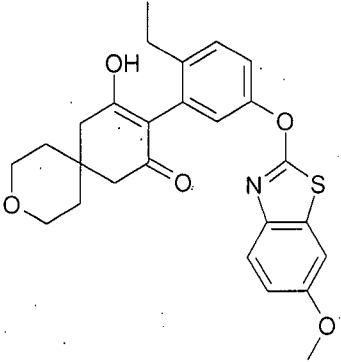
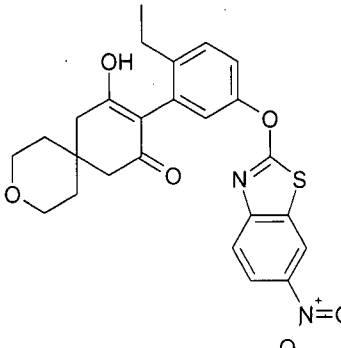
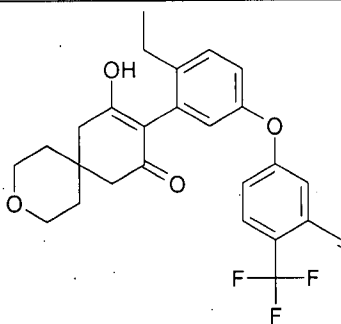
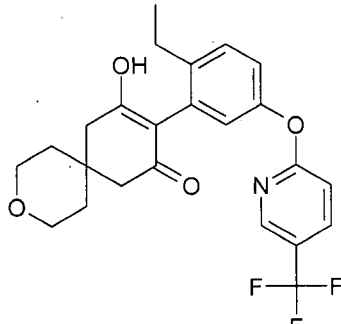
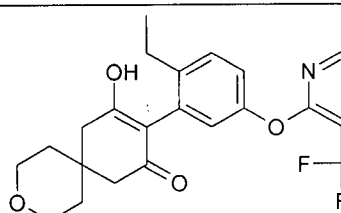
Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-241		LCMS (Método A): $t_r = 2.04$ mins, $\text{MH}^+ = 489$
A-242		δ 7.32 (d, 1H), 7.20 - 7.17 (m, 2H), 7.04 - 6.97 (m, 3H), 6.79 (d, 1H), 5.71 (br. s, 1H), 2.48 - 2.37 (m, 2H), 1.59 (d, 6H), 1.49 (d, 6H), 1.14 - 1.09 (m, 3H).
A-243		δ 8.70 - 8.69 (m, 1H), 8.04 (d, 1H), 7.67 - 7.62 (m, 1H), 7.61 - 7.58 (m, 1H), 7.41 - 7.37 (m, 1H), 7.17 (br. d, 1H), 6.97 y 6.85 (d, 1H), 2.56 - 2.32 (br. m, 4H), 1.96 - 1.74 (br. m, 3H), 1.21 - 1.00 (m, 12H).
A-244		LCMS (Método B): $t_r = 1.71$ mins, $\text{MH}^+ = 447.0$
A-245		LCMS (Método B): $t_r = 1.62$ mins, $\text{MH}^+ = 413.1$
A-246		LCMS (Método B): $t_r = 1.62$ mins, $\text{MH}^+ = 387.1$

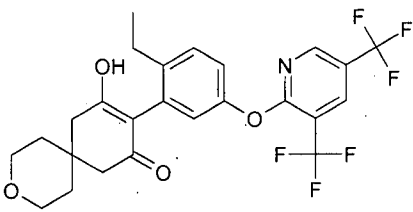
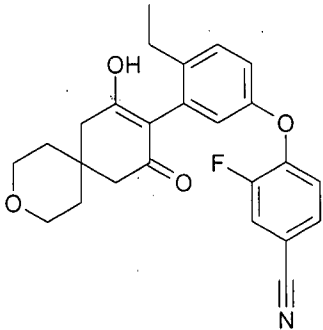
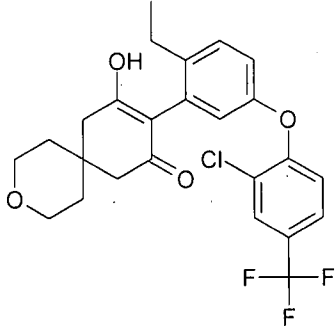
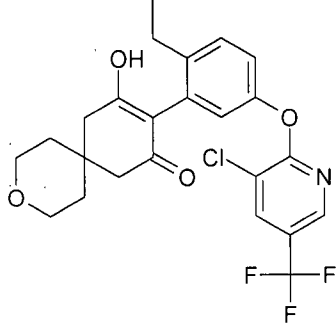
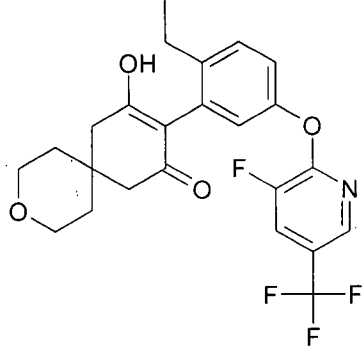
Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 , a menos que se indique) u otros datos físicos
A-247		LCMS (Método B): $t_r = 1.72$ mins, $\text{MH}^+ = 447.0$
A-248		LCMS (Método B): $t_r = 1.71$ mins, $\text{MH}^+ = 419.1$
A-249		LCMS (Método B): $t_r = 1.63$ mins, $\text{MH}^+ = 387.1$
A-250		LCMS (Método B): $t_r = 1.67$ mins, $\text{MH}^+ = 431.1$
A-251		δ 8.17 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.66 (t, 1H), 7.52 (t, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.32 (s, 1H), 7.15 (dd, 1H), 6.99 (d, 1H), 2.53 - 2.50 (br. m, 2H), 1.60 - 1.47 (br. m, 12H), 1.19 (t, 3H).

Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
A-252		δ 8.27 (d, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.77 (t, 1H), 7.58 (t, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.18 (dd, 1H), 6.99 (d, 1H), 6.62 (s, 1H), 2.55 - 2.50 (br. m, 2H), 1.62 - 1.46 (br. m, 12H), 1.19 (t, 3H).
A-253		δ 8.09 (d, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.61 (t, 1H), 7.47 (t, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.18 (dd, 1H), 7.00 (d, 1H), 2.56 - 2.50 (m, 5H), 1.56 (s, 6H), 1.50 (s, 6H), 1.20 (t, 3H).
A-254		δ 7.95 (d, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.64 (t, 1H), 7.50 (t, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.15 (dd, 1H), 7.09 (s, 1H), 6.98 (d, 1H), 4.80 (br. s, 1H), 2.75 (s, 3H), 2.52 (q, 2H), 1.56 (s, 6H), 1.50 (s, 6H), 1.19 (t, 3H).
A-255		LCMS (Método A): t _r = 1.65 mins, MH ⁺ = 421
A-256		δ 8.10 (d, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.69 - 7.62 (m, 2H), 7.41 (d, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.16 (dd, 1H), 6.99 (d, 1H), 2.52 (q, 2H), 1.56 (s, 6H), 1.51 (s, 6H), 1.19 (t, 3H).
A-257		LCMS (Método A): t _r = 1.75 mins, MH ⁺ = 389

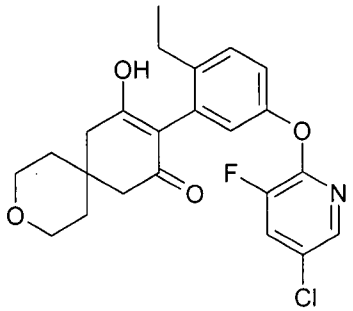
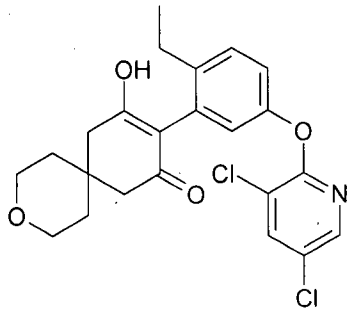
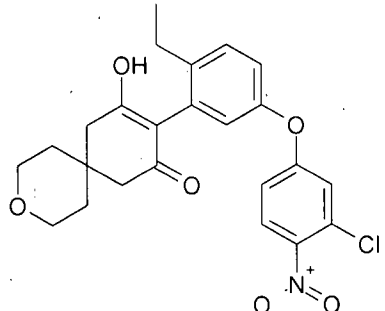
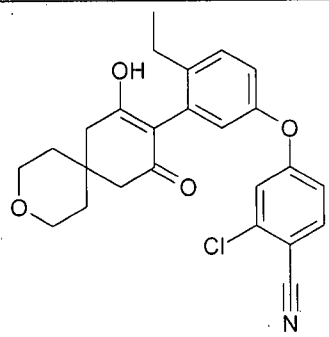
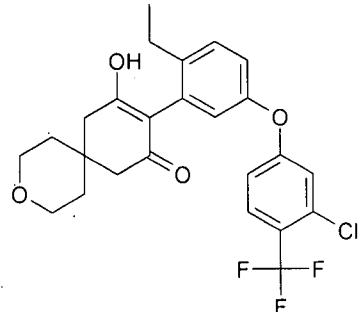
160

Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u. otros datos físicos
A-258		LCMS (Método A): t _r = 1.86 mins, MH ⁺ = 449
A-259		LCMS (Método A): t _r = 1.78 mins, MH ⁺ = 415
A-260		LCMS (Método A): t _r = 1.73 mins, MH ⁺ = 420
A-261		δ 8.04 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.67 - 7.65 (m, 1H), 7.51 (dd, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.16 (d, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.94 (d, 1H), 2.65 - 2.37 (m, 6H), 1.19 - 1.15 (m, 9H).
A-262		δ 7.46 (1H, d), 7.20 (1H, dd), 7.06 (1H, d), 6.96 (1H, d), 6.88 (1H, dd), 6.78 (1H, d), 5.76 (1H, br. s), 1.71 - 1.64 (1H, m), 1.60 (6H, d), 1.49 (6H, d), 0.85 - 0.82 (2H, m), 0.70 - 0.67 (1H, m), 1.51 - 1.49 (1H, m).
A-263		LCMS (Método B): t _r = 1.36 mins, MH ⁺ = 415.1

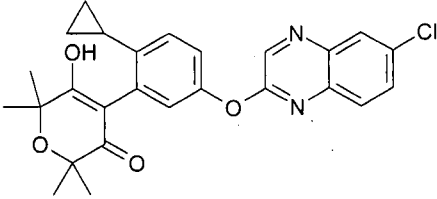
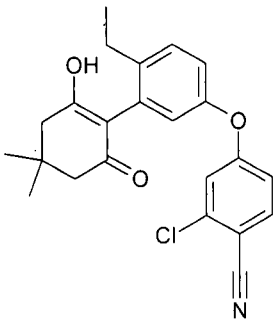
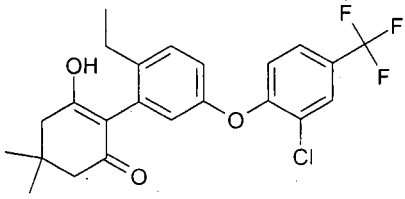
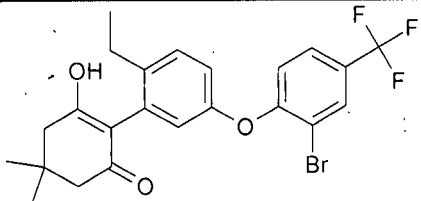
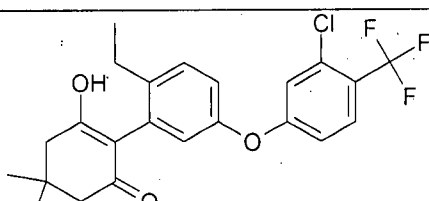
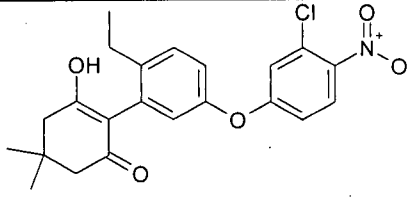
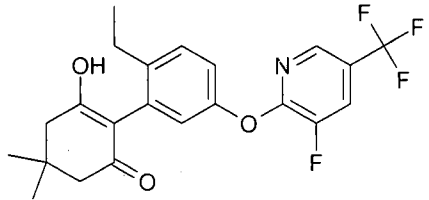
Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-264		LCMS (Método B): $t_r = 1.45$ mins, $\text{MH}^+ = 466.2$
A-265		LCMS (Método B): $t_r = 1.53$ mins, $\text{MH}^+ = 481.1$
A-266		LCMS (Método B): $t_r = 1.54$ mins, $\text{MH}^+ = 472.2$
A-267		LCMS (Método B): $t_r = 1.50$ mins, $\text{MH}^+ = 448.2$
A-268		LCMS (Método B): $t_r = 1.60$ mins, $\text{MH}^+ = 482.1$

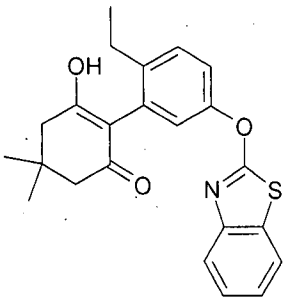
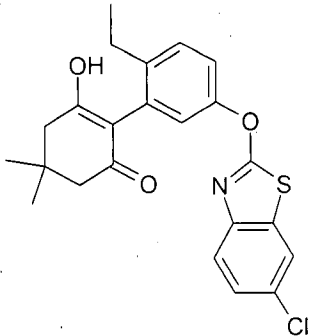
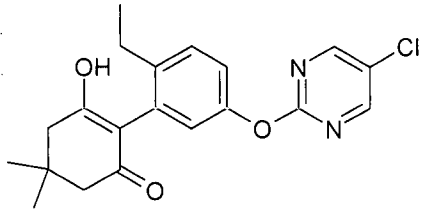
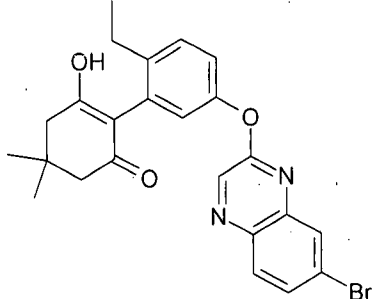
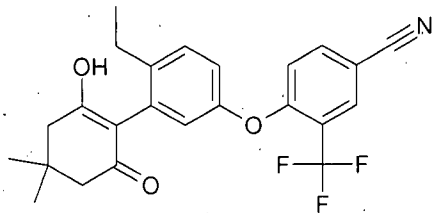
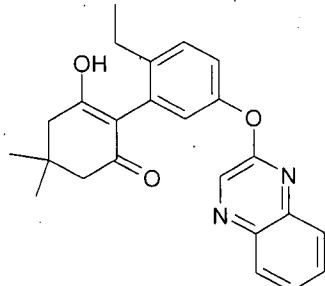
Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
A-269		δ 8.49 (s, 1H), 8.18 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.11 - 7.10 (m, 1H), 6.84 (d, 1H), 3.74 - 3.69 (m, 4H), 2.55 - 2.43 (m, 6H), 1.70 - 1.64 (m, 4H), 1.13 (t, 3H).
A-270		LCMS (Método B): t _r = 1.45 mins, MH ⁺ = 422.2
A-271		LCMS (Método B): t _r = 1.70 mins, MH ⁺ = 481.1
A-272		LCMS (Método B): t _r = 1.60 mins, MH ⁺ = 482.1
A-273		LCMS (Método B): t _r = 1.53 mins, MH ⁺ = 466.2

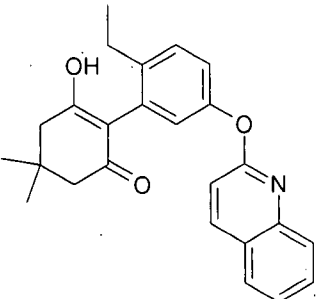
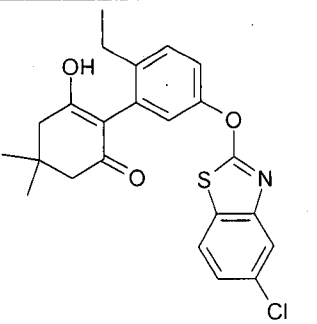
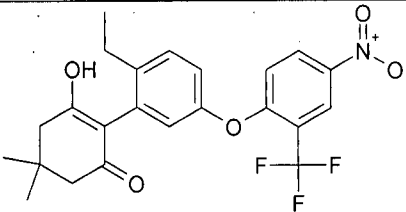
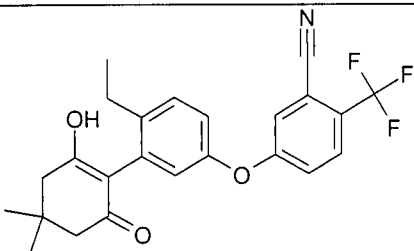
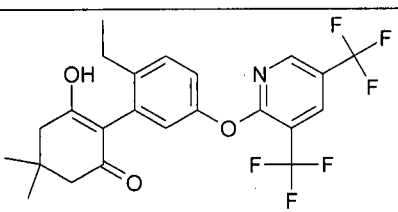
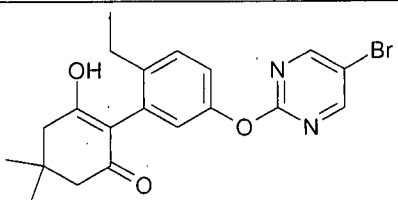
163

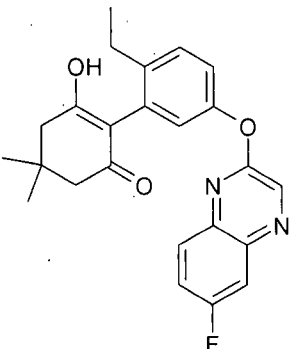
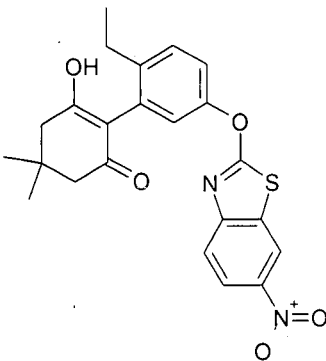
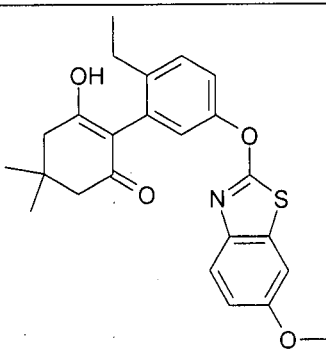
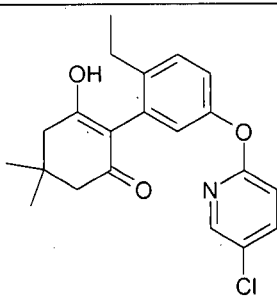
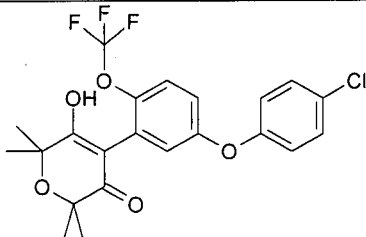
Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-274		LCMS (Método B): $t_r = 1.46$ mins, $\text{MH}^+ = 432.1$
A-275		LCMS (Método B): $t_r = 1.55$ mins, $\text{MH}^+ = 448.1$
A-276		LCMS (Método B): $t_r = 1.56$ mins, $\text{MH}^+ = 458.1$
A-277		LCMS (Método B): $t_r = 1.51$ mins, $\text{MH}^+ = 438.1$
A-278		LCMS (Método B): $t_r = 1.71$ mins, $\text{MH}^+ = 481.1$

164

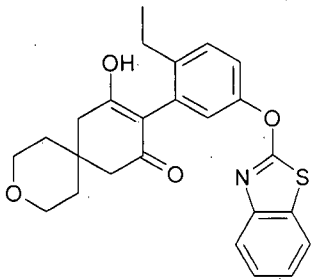
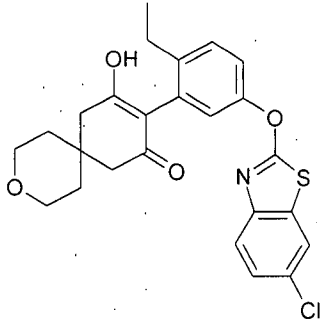
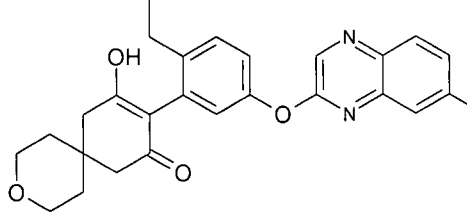
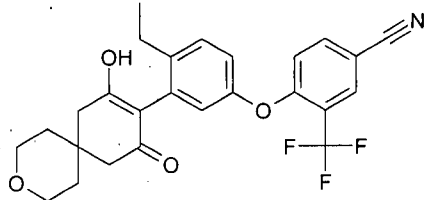
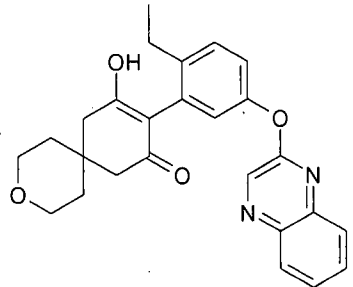
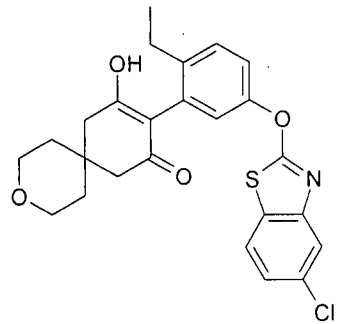
Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
A-279		δ 8.74 (s, 1H), 8.07 (d, 1H), 7.67 - 7.59 (m, 2H), 7.20 - 7.14 (m, 2H), 7.03 (d, 1H), 1.87 - 1.76 (m, 1H), 1.60 (d, 6H), 1.49 (d, 6H), 0.90 - 0.87 (m, 2H), 0.78 - 0.75 (m, 1H), 0.58 - 0.55 (m, 1H).
A-280		LCMS (Método B): t _r = 1.65 mins, MH ⁺ = 396.1
A-281		LCMS (Método B): t _r = 1.81 mins, MH ⁺ = 439.1
A-282		LCMS (Método B): t _r = 1.85 mins, MH ⁺ = 485.1
A-283		LCMS (Método B): t _r = 1.83 mins, MH ⁺ = 439.1
A-284		LCMS (Método B): t _r = 1.68 mins, MH ⁺ = 416.1
A-285		LCMS (Método B): t _r = 1.66 mins, MH ⁺ = 424.1

Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-286		LCMS (Método B): $t_r = 1.63$ mins, $\text{MH}^+ = 394.1$
A-287		LCMS (Método B): $t_r = 1.75$ mins, $\text{MH}^+ = 428.1$
A-288		δ 8.44 (s, 2H), 7.34 (d, 1H), 7.09 (dd, 1H), 6.84 (d, 1H), 2.48 - 2.40 (m, 6H), 1.17 - 1.11 (m, 9H).
A-289		LCMS (Método B): $t_r = 1.70$ mins, $\text{MH}^+ = 469.1$
A-290		LCMS (Método B): $t_r = 1.68$ mins, $\text{MH}^+ = 430.2$
A-291		LCMS (Método B): $t_r = 1.53$ mins, $\text{MH}^+ = 389.2$

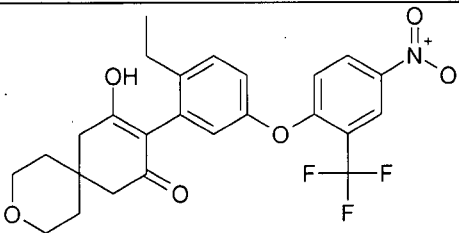
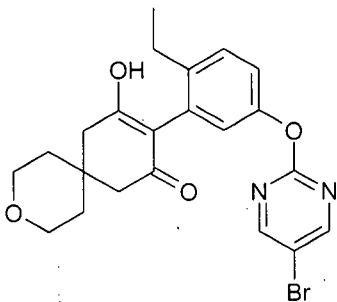
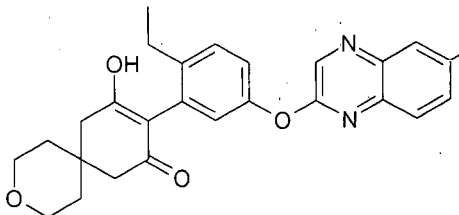
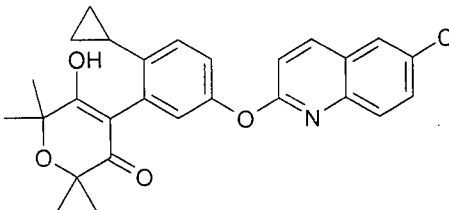
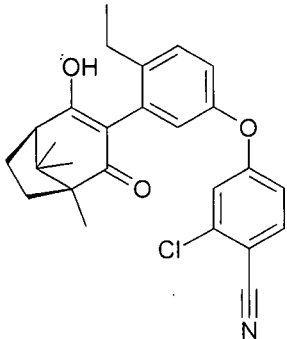
Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 , a menos que se indique) u otros datos físicos
A-292		LCMS (Método B): $t_r = 1.60$ mins, $\text{MH}^+ = 388.2$
A-293		LCMS (Método B): $t_r = 1.75$ mins, $\text{MH}^+ = 428.1$
A-294		LCMS (Método B): $t_r = 1.73$ mins, $\text{MH}^+ = 450.1$
A-295		LCMS (Método B): $t_r = 1.71$ mins, $\text{MH}^+ = 430.2$
A-296		LCMS (Método B): $t_r = 1.76$ mins, $\text{MH}^+ = 474.1$
A-297		LCMS (Método B): $t_r = 1.45$ mins, $\text{MH}^+ = 419.1$

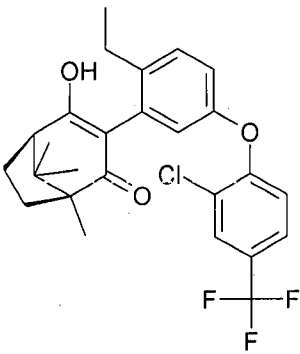
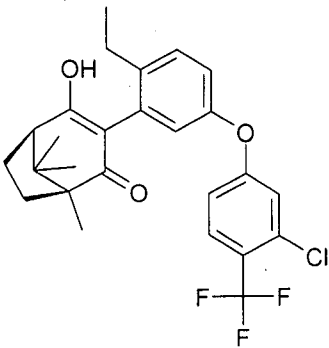
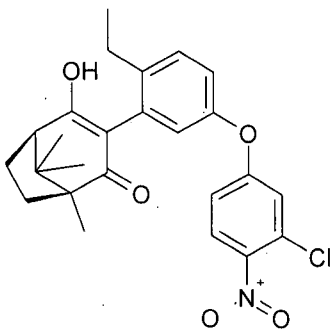
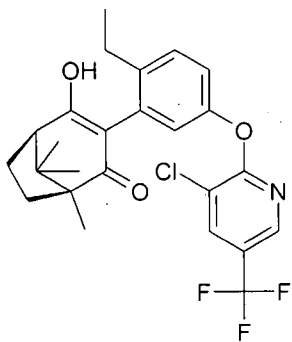
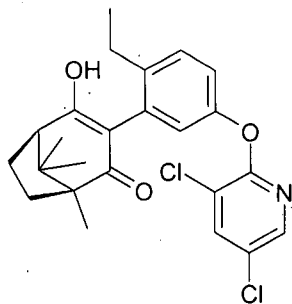
Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-298		LCMS (Método B): $t_r = 1.58$ mins, $\text{MH}^+ = 407.2$
A-299		LCMS (Método B): $t_r = 1.65$ mins, $\text{MH}^+ = 439.1$
A-300		LCMS (Método B): $t_r = 1.61$ mins, $\text{MH}^+ = 424.2$
A-301		LCMS (Método B): $t_r = 1.55$ mins, $\text{MH}^+ = 372.1$
A-302		LCMS (Método A): $t_r = 1.95$ mins, $\text{MH}^+ = 457, 459$

168

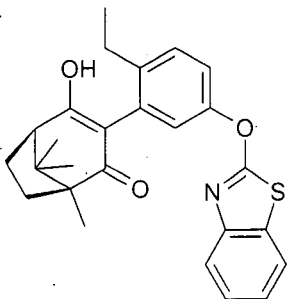
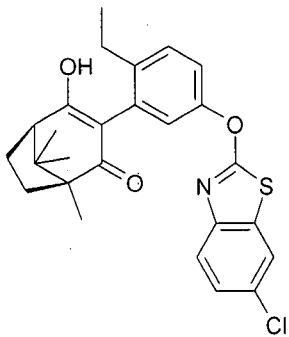
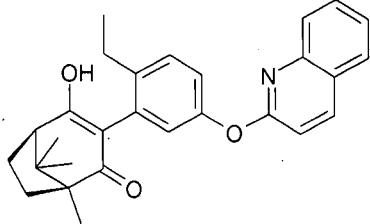
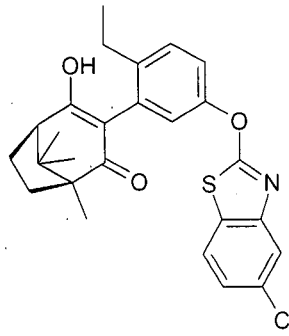
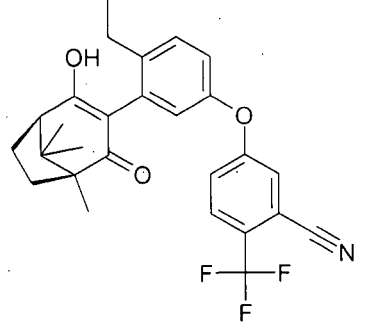
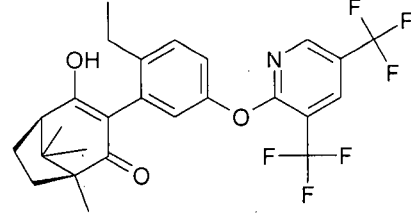
Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-303		LCMS (Método B): $t_r = 1.56$ mins, $\text{MH}^+ = 436.2$
A-304		LCMS (Método B): $t_r = 1.63$ mins, $\text{MH}^+ = 470.1$
A-305		LCMS (Método B): $t_r = 1.56$ mins, $\text{MH}^+ = 509.1$
A-306		LCMS (Método B): $t_r = 1.50$ mins, $\text{MH}^+ = 472.2$
A-307		LCMS (Método B): $t_r = 1.38$ mins, $\text{MH}^+ = 431.2$
A-308		LCMS (Método B): $t_r = 1.61$ mins, $\text{MH}^+ = 470.1$

169

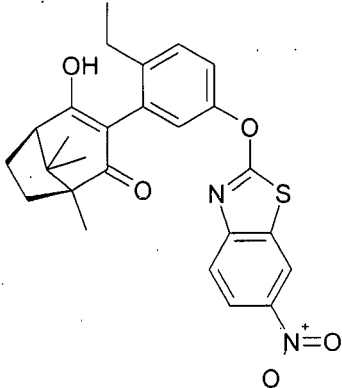
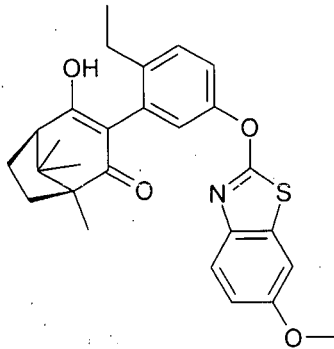
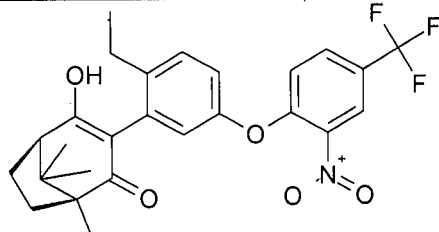
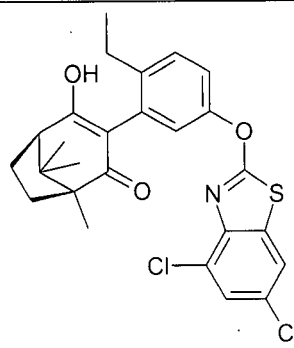
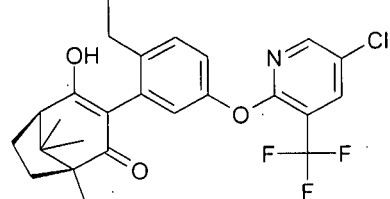
Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-309		LCMS (Método B): $t_r = 1.61$ mins, $\text{MH}^+ = 492.2$
A-310		LCMS (Método B): $t_r = 1.30$ mins, $\text{MH}^+ = 459.1$
A-311		LCMS (Método B): $t_r = 1.45$ mins, $\text{MH}^+ = 449.2$
A-312		δ 8.10 (d, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.55 (dd, 1H), 7.22 - 7.11 (m, 3H), 7.01 (m, 1H), 1.82 - 1.75 (m, 1H), 1.56 (s, 6H), 1.52 (s, 6H), 0.88 - 0.85 (m, 2H), 0.65 (br. app. s, 2H).
A-313		LCMS (Método B): $t_r = 1.81$ mins, $\text{MH}^+ = 436.2$

Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 , a menos que se indique) u otros datos físicos
A-314		LCMS (Método B): $t_r = 1.94$ mins, $\text{MH}^+ = 479.2$
A-315		LCMS (Método B): $t_r = 1.96$ mins, $\text{MH}^+ = 479.2$
A-316		LCMS (Método B): $t_r = 1.81$ mins, $\text{MH}^+ = 456.1$
A-317		LCMS (Método B): $t_r = 1.84$ mins, $\text{MH}^+ = 480.1$
A-318		LCMS (Método B): $t_r = 1.81$ mins, $\text{MH}^+ = 446.1$

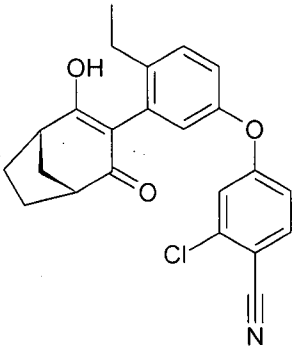
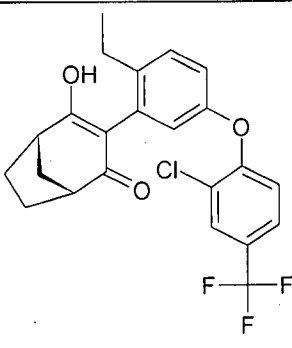
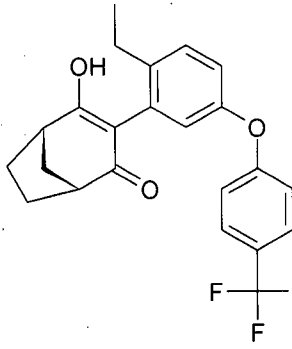
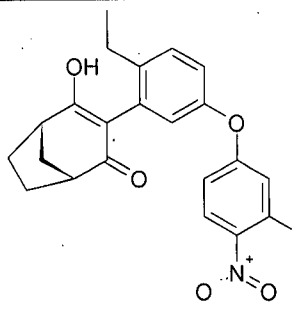
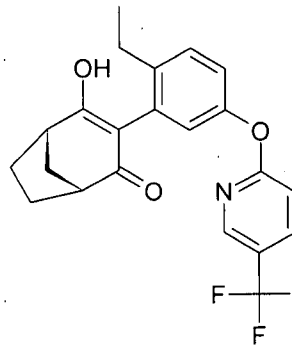
171

Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-319		LCMS (Método B): $t_r = 1.76$ mins, $\text{MH}^+ = 434.2$
A-320		LCMS (Método B): $t_r = 1.87$ mins, $\text{MH}^+ = 468.1$
A-321		LCMS (Método B): $t_r = 1.72$ mins, $\text{MH}^+ = 428.2$
A-322		LCMS (Método B): $t_r = 1.87$ mins, $\text{MH}^+ = 468.1$
A-323		LCMS (Método B): $t_r = 1.81$ mins, $\text{MH}^+ = 470.2$
A-324		LCMS (Método B): $t_r = 1.87$ mins, $\text{MH}^+ = 514.2$

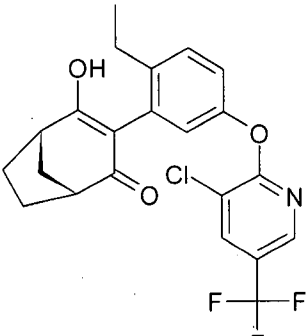
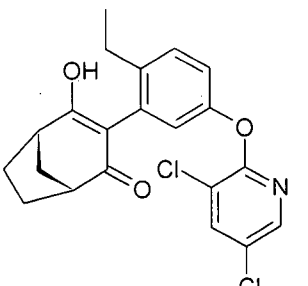
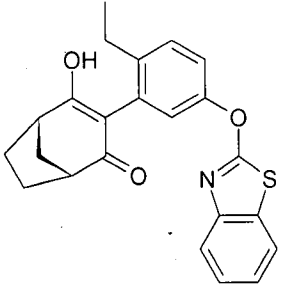
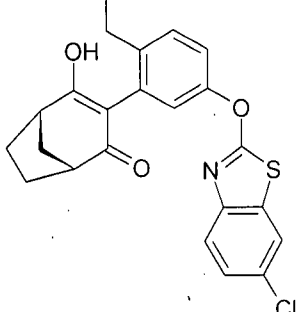
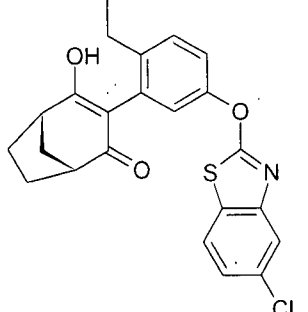
172

Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 , a menos que se indique) u otros datos físicos
A-325		LCMS (Método B): $t_r = 1.77$ mins, $\text{MH}^+ = 479.2$
A-326		LCMS (Método B): $t_r = 1.76$ mins, $\text{MH}^+ = 464.2$
A-327		LCMS (Método B): $t_r = 1.84$ mins, $\text{MH}^+ = 490.2$
A-328		LCMS (Método B): $t_r = 1.97$ mins, $\text{MH}^+ = 502.1$
A-329		LCMS (Método B): $t_r = 1.84$ mins, $\text{MH}^+ = 480.1$

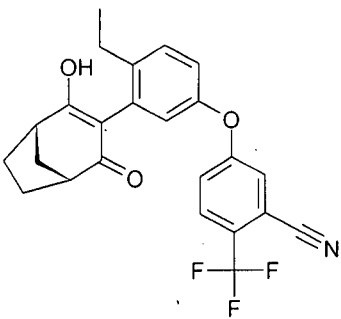
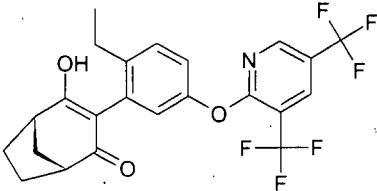
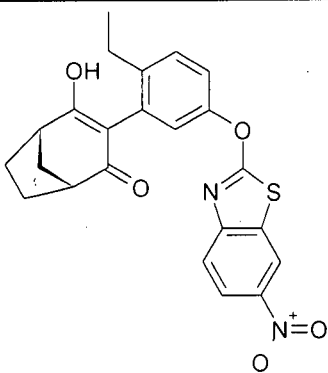
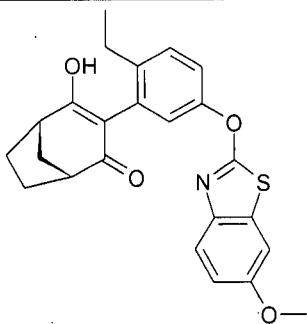
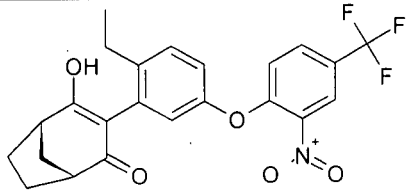
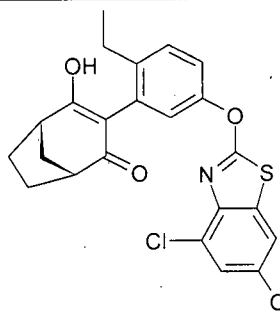
173

Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-330		LCMS (Método B): $t_r = 1.61$ mins, $\text{MH}^+ = 394.1$
A-331		LCMS (Método B): $t_r = 1.77$ mins, $\text{MH}^+ = 437.1$
A-332		LCMS (Método B): $t_r = 1.74$ mins, $\text{MH}^+ = 437.1$
A-333		LCMS (Método B): $t_r = 1.62$ mins, $\text{MH}^+ = 414.1$
A-334		LCMS (Método B): $t_r = 1.52$ mins, $\text{MH}^+ = 404.1$

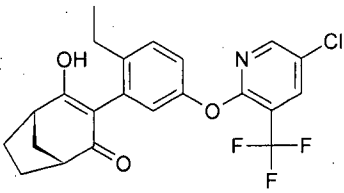
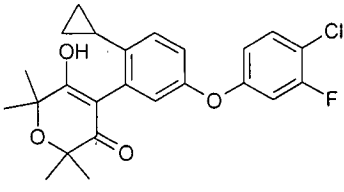
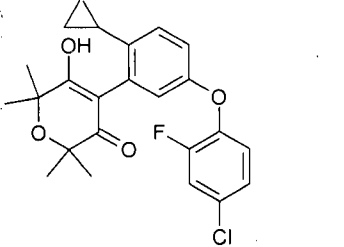
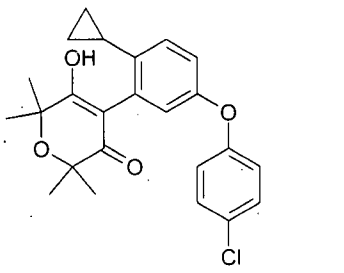
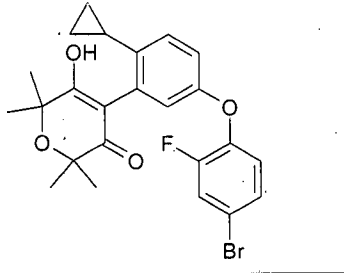
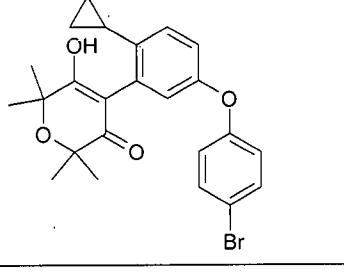
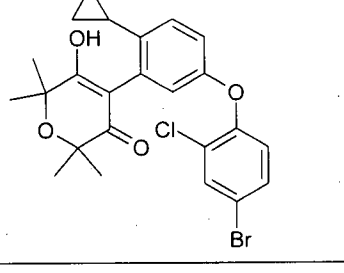
124

Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-335		LCMS (Método B): $t_r = 1.62$ mins, $\text{MH}^+ = 438.1$
A-336		LCMS (Método B): $t_r = 1.57$ mins, $\text{MH}^+ = 404.1$
A-337		LCMS (Método B): $t_r = 1.52$ mins, $\text{MH}^+ = 392.1$
A-338		LCMS (Método B): $t_r = 1.66$ mins, $\text{MH}^+ = 426.1$
A-339		LCMS (Método B): $t_r = 1.66$ mins, $\text{MH}^+ = 426.1$

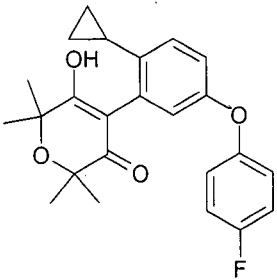
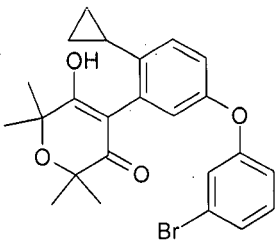
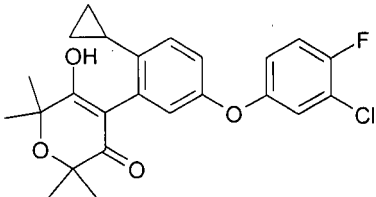
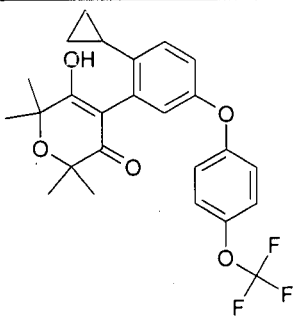
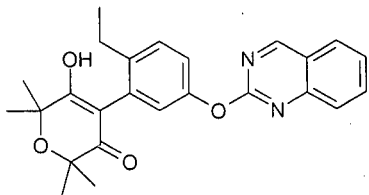
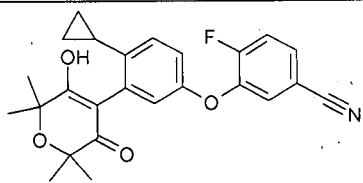
175

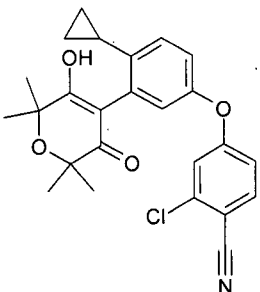
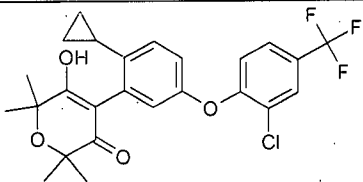
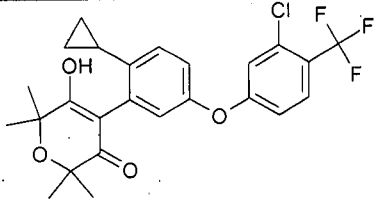
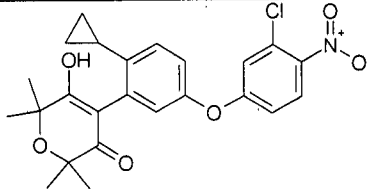
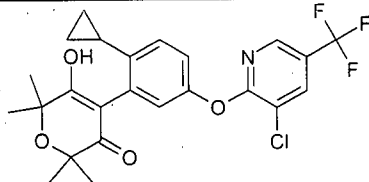
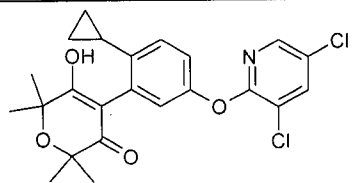
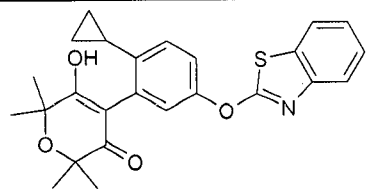
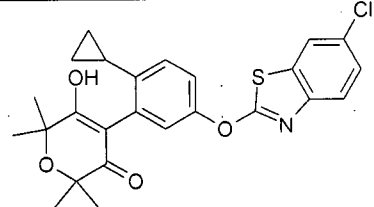
Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-340		LCMS (Método B): $t_r = 1.61$ mins, $\text{MH}^+ = 428.1$
A-341		LCMS (Método B): $t_r = 1.67$ mins, $\text{MH}^+ = 472.1$
A-342		LCMS (Método B): $t_r = 1.56$ mins, $\text{MH}^+ = 437.1$
A-343		LCMS (Método B): $t_r = 1.54$ mins, $\text{MH}^+ = 422.1$
A-344		LCMS (Método B): $t_r = 1.62$ mins, $\text{MH}^+ = 448.1$
A-345		LCMS (Método B): $t_r = 1.76$ mins, $\text{MH}^+ = 460.0$

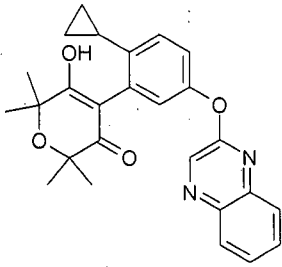
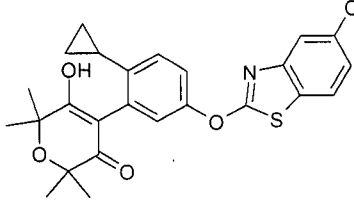
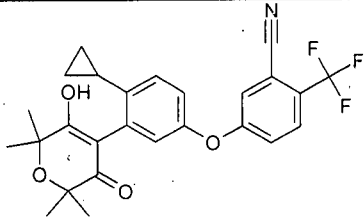
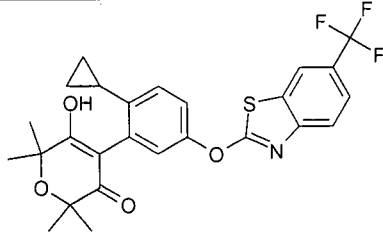
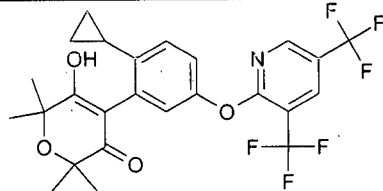
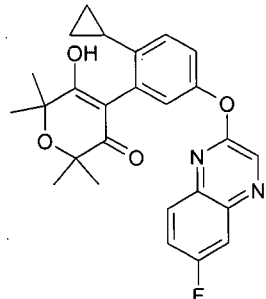
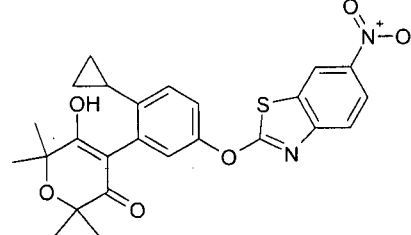
176

Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
A-346		LCMS (Método B): t _r = 1.62 mins, MH ⁺ = 438.1
A-347		LCMS (Método B): t _r = 1.87 mins, MH ⁺ = 431.1
A-348		LCMS (Método B): t _r = 1.84 mins, MH ⁺ = 431.1
A-349		LCMS (Método B): t _r = 1.84 mins, MH ⁺ = 413.1
A-350		LCMS (Método B): t _r = 1.86 mins, MH ⁺ = 477.1
A-351		LCMS (Método B): t _r = 1.86 mins, MH ⁺ = 459.1
A-352		LCMS (Método B): t _r = 1.94 mins, MH ⁺ = 493.1

177

Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-353		LCMS (Método B): $t_r = 1.74$ mins, $\text{MH}^+ = 397.2$
A-354		LCMS (Método B): $t_r = 1.86$ mins, $\text{MH}^+ = 459.1$
A-355		LCMS (Método B): $t_r = 1.84$ mins, $\text{MH}^+ = 431.1$
A-356		LCMS (Método B): $t_r = 1.89$ mins, $\text{MH}^+ = 463.2$
A-357		δ 9.33 (s, 1H), 7.93 (d, 1H), 7.89 - 7.85 (m, 1H), 7.81 - 7.79 (m, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.21 (dd, 1H), 7.03 (d, 1H), 2.52 (q, 2H), 1.56 (s, 6H), 1.51 (s, 6H), 1.18 (t, 3H).
A-358		LCMS (Método B): $t_r = 1.71$ mins, $\text{MH}^+ = 422.2$

Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-359		LCMS (Método B): $t_r = 1.77$ mins, $\text{MH}^+ = 438.1$
A-360		LCMS (Método B): $t_r = 1.96$ mins, $\text{MH}^+ = 481.1$
A-361		LCMS (Método B): $t_r = 1.97$ mins, $\text{MH}^+ = 481.1$
A-362		LCMS (Método B): $t_r = 1.81$ mins, $\text{MH}^+ = 458.1$
A-363		LCMS (Método B): $t_r = 1.86$ mins, $\text{MH}^+ = 482.1$
A-364		LCMS (Método B): $t_r = 1.81$ mins, $\text{MH}^+ = 448.1$
A-365		LCMS (Método B): $t_r = 1.77$ mins, $\text{MH}^+ = 436.2$
A-366		LCMS (Método B): $t_r = 1.91$ mins, $\text{MH}^+ = 470.1$

Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
A-367		LCMS (Método B): $t_r = 1.67$ mins, $\text{MH}^+ = 431.2$
A-368		LCMS (Método B): $t_r = 1.91$ mins, $\text{MH}^+ = 470.1$
A-369		LCMS (Método B): $t_r = 1.82$ mins, $\text{MH}^+ = 472.2$
A-370		LCMS (Método B): $t_r = 1.92$ mins, $\text{MH}^+ = 504.1$
A-371		LCMS (Método B): $t_r = 1.89$ mins, $\text{MH}^+ = 516.2$
A-372		LCMS (Método B): $t_r = 1.72$ mins, $\text{MH}^+ = 449.2$
A-373		LCMS (Método B): $t_r = 1.79$ mins, $\text{MH}^+ = 481.1$

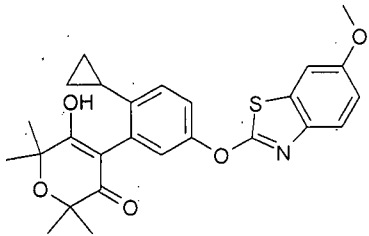
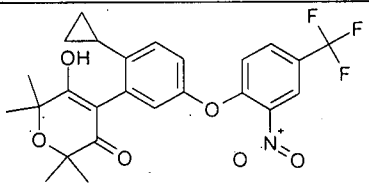
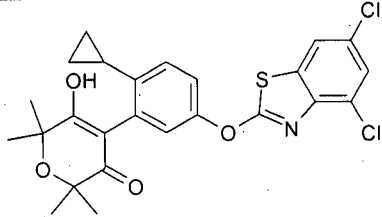
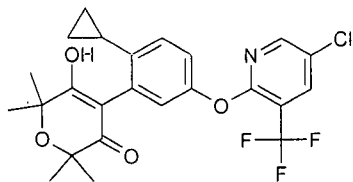
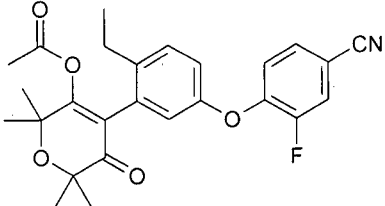
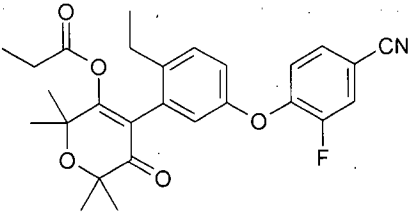
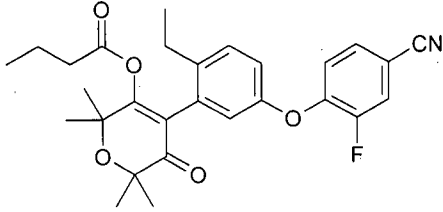
Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
A-374		LCMS (Método B): t _r = 1.79 mins, MH ⁺ = 466.2
A-375		LCMS (Método B): t _r = 1.84 mins, MH ⁺ = 492.2
A-376		LCMS (Método B): t _r = 2.01 mins, MH ⁺ = 504.1
A-377		LCMS (Método B): t _r = 1.86 mins, MH ⁺ = 482.1

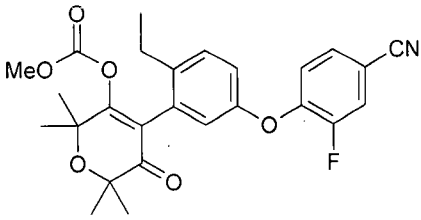
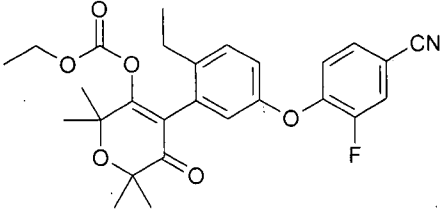
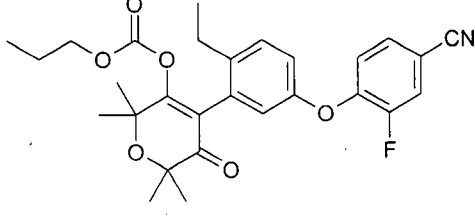
Tabla P1

Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
P-1		δ 7.45 (1H, dd), 7.38 - 7.36 (1H, m), 7.30 (1H, d), 7.01 (1H, dd), 6.96 (1H, t), 6.71 (1H, d), 2.46 (2H, q), 1.86 (3H, s),

181

Número de Compuesto	Estructura	RMN ¹ H (CDCl ₃ a menos que se indique) u otros datos físicos
		1.55 (12H, s), 1.51 - 1.49 (6H, m), 1.17 (3H, t).
P-2		δ 7.45 (1H, dd), 7.38 - 7.35 (1H, m), 7.29 (1H, d), 6.99 (1H, dd), 6.98 - 6.93 (1H, m), 6.72 (1H, d), 2.46 (2H, q), 2.19 - 2.08 (2H, m), 1.55 (3H, s), 1.51 - 1.50 (9H, m), 1.17 (3H, t), 0.88 (3H, t).
P-3		δ 7.45 (1H, dd), 7.36 (1H, dt), 7.29 - 7.27 (1H, m), 7.00 - 6.94 (2H, m), 6.72 (1H, d), 2.46 (2H, q), 2.10 (2H, td), 1.55 (3H, s), 1.51 - 1.49 (9H, m), 1.40 - 1.35 (2H, m), 1.16 (3H, t), 0.74 (3H, t)

182

Número de Compuesto	Estructura	RMN ^1H (CDCl_3 a menos que se indique) u otros datos físicos
P-4		δ 7.46 (1H, dd), 7.37 - 7.34 (1H, m), 7.32 (1H, d), 7.02 (1H, dd), 6.96 (1H, t), 6.76 (1H, d), 3.59 (3H, s), 2.46 (2H, qd), 1.59 - 1.50 (12H, m), 1.18 (3H, t).
P-5		δ 7.45 (1H, dd), 7.37 - 7.34 (1H, m), 7.31 (1H, d), 7.02 - 6.95 (2H, m), 6.66 (1H, d), 3.98 (2H, q), 2.50 - 2.43 (2H, m), 1.58 - 1.49 (12H, m), 1.18 (3H, t), 1.09 (3H, t).
P-6		δ 7.45 (1H, dd), 7.37 - 7.34 (1H, m), 7.31 (1H, d), 7.02 - 6.96 (2H, m), 6.77 (1H, d), 3.89 (2H, t), 2.50 - 2.44 (2H, m), 1.59 - 1.44 (14H, m), 1.18 (3H, t), 0.79 (3H, t).

Cabe notar que ciertos compuestos de la invención existen como una mezcla de isómeros, que incluyen atropisómeros, anotados anteriormente, bajo las condiciones utilizadas para obtener los datos ^1H RMN. Cuando esto ha ocurrido, los datos característicos se reportan para todos los isómeros presentes a temperatura ambiente en el disolvente especificado. A menos que se indique otra cosa, se registran los espectros de RMN de protón a temperatura ambiente. Los compuestos caracterizados por HPLC-MS se analizan utilizando uno de los dos métodos descritos adelante.

10 Método A

Se analizan los compuestos caracterizados por HPLC-MS utilizando un Waters 2795 HPLC equipado con una columna Waters Atlantis dC18 (longitud de columna 20 mm, diámetro interno de columna 3 mm, tamaño de partícula 3 micras, temperatura 40 °C), Matriz de fotodiodo Waters y Micromass ZQ2000. Se conduce el análisis utilizando un tiempo de serie de tres minutos, de acuerdo con la siguiente tabla de gradientes:

Tiempo (mins)	Disolvente A (%)	Disolvente B (%)	Flujo (ml / mn)
0.00	90.0	10.0	2.00
0.25	90.0	100	2.00
2.00	10.0	90.0	2.00
2.50	10.0	90.0	2.00
2.60	90.0	10.0	2.00
3.0	90.0	10.0	2.00

Disolvente A: H_2O que contiene 0.1% HCOOH .

20 Disolvente B: CH_3CN que contiene 0.1% HCOOH

Método B

184

Se analizan los compuestos caracterizados por HPLC-MS utilizando un inyector Waters 2777 con una microbomba de 1525 HPLC equipada con una columna Waters Atlantis dC18 IS (longitud de columna 20 mm, diámetro interno de columna 3 mm, tamaño de partícula 3 micras), matriz de fotodiodo Waters 2996, Waters 2420 ELSD y Micromass ZQ2000. Se conduce el análisis utilizando un tiempo de serie de tres minutos, de acuerdo con la siguiente tabla de gradientes:

Tiempo (mins)	Disolvente A (%)	Disolvente B (%)	Flujo (ml / mn)
0.00	95.0	5	1.300
2.50	0.0	100	1.300
2.80	0.00	100	1.300
2.90	95.0	5	1.300

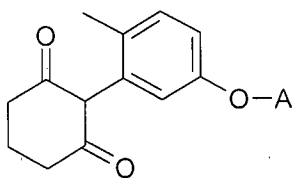
Disolvente A: H₂O con 0.05% TFA

Disolvente B: CH₃CN con 0.05% TFA

Los valores característicos obtenidos para cada compuesto son el tiempo de retención (rt, registrado en minutos) y el ión molecular (típicamente el catión MH⁺), como se enumera en la Tabla T1.

Se pueden obtener los compuestos de las siguientes Tablas 1 a 57 en una forma análoga.

La Tabla 1 cubre los compuestos del siguiente tipo



185

en donde A es como se define en la Tabla 1.

Tabla 1

Número de Compuesto	A	Número de Compuesto	A
1.001	fenilo	1.002	2-bromofenilo
1.003	2-clorofenilo	1.004	2-cianofenilo
1.005	2-difluorometoxifenilo	1.006	2-fluorofenilo
1.007	2-metoxifenilo	1.008	2-metilofenilo
1.009	2-nitrofenilo	1.010	2-trifluorometoxifenilo
1.011	2-trifluorometilofenilo	1.012	3-bromofenilo
1.013	3-clorofenilo	1.014	3-cianofenilo
1.015	3-difluorometoxifenilo	1.016	3-fluorofenilo
1.017	3-metoxifenilo	1.018	3-metilofenilo
1.019	3-nitrofenilo	1.020	3-trifluorometoxifenilo
1.021	3-trifluorometilofenilo	1.022	4-bromofenilo
1.023	4-clorofenilo	1.024	4-cianofenilo
1.025	4-difluorometoxifenilo	1.026	4-fluorofenilo
1.027	4-metanosulfonilo	1.028	4-metoxifenilo
1.029	4-metilofenilo	1.030	4-nitrofenilo
1.031	4-trifluorometoxifenilo	1.032	4-trifluorometilofenilo
1.033	4-bromo-2-clorofenilo	1.034	2,4-diclorofenilo
1.035	2-cloro-4-cianofenilo	1.036	2-cloro-4-difluorometoxifenilo
1.037	2-cloro-4-fluorofenilo	1.038	2-cloro-4-metoxifenilo
1.039	2-cloro-4-metilofenilo	1.040	2-cloro-4-nitrofenilo
1.041	2-cloro-4-trifluorometoxifenilo	1.042	2-cloro-4-trifluorometilofenilo
1.043	4-bromo-3-clorofenilo	1.044	3,4-diclorofenilo
1.045	3-cloro-4-cianofenilo	1.046	3-cloro-4-difluorometoxifenilo
1.047	3-cloro-4-fluorofenilo	1.048	3-cloro-4-metoxifenilo
1.049	3-cloro-4-metilofenilo	1.050	3-cloro-4-nitrofenilo
1.051	3-cloro-4-trifluorometoxifenilo	1.052	3-cloro-4-trifluorometilofenilo
1.053	2-bromo-4-clorofenilo	1.054	4-cloro-2-difluorometoxifenilo
1.055	4-cloro-2-cianofenilo	1.056	4-cloro-2-metoxifenilo
1.057	4-cloro-2-fluorofenilo	1.058	4-cloro-2-nitrofenilo

180

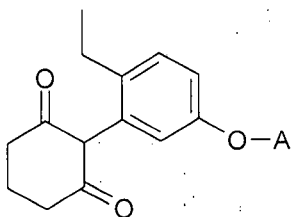
Número de Compuesto	A	Número de Compuesto	A
1.059	4-cloro-2-metilofenilo	1.060	4-cloro-2-trifluorometilofenilo
1.061	4-cloro-2-trifluorometoxifenilo	1.062	4-cloro-3-trifluorometoxifenilo
1.063	3-bromo-4-clorofenilo	1.064	4-cloro-3-difluorometoxifenilo
1.065	4-cloro-3-cianofenilo	1.066	4-cloro-3-metoxifenilo
1.067	4-cloro-3-fluorofenilo	1.068	4-cloro-3-nitrofenilo
1.069	4-cloro-3-metilofenilo	1.070	4-cloro-3-trifluorometilofenilo
1.071	4-bromo-2-fluorofenilo	1.072	2-difluoro-4-difluorometoxifenilo
1.073	4-ciano-2-fluorofenilo	1.074	2-fluoro-4-metoxifenilo
1.075	2,4-fluorofenilo	1.076	2-fluoro-4-nitrofenilo
1.077	2-fluoro-4-metilofenilo	1.078	2-fluoro-4-trifluorometilofenilo
1.079	2-fluoro-4-trifluorometoxifenilo	1.080	4-bromo-3-fluorofenilo
1.081	4-ciano-3-fluorofenilo	1.082	3-difluoro-4-difluorometoxifenilo
1.083	3,4-fluorofenilo	1.084	3-fluoro-4-metoxifenilo
1.085	3-fluoro-4-metilofenilo	1.086	3-fluoro-4-nitrofenilo
1.087	3-fluoro-4-trifluorometoxifenilo	1.088	3-fluoro-4-trifluorometilofenilo
1.089	4-cloro-2,3-difluorofenilo	1.090	4-cloro-2,5-difluorofenilo
1.091	4-cloro-2,6-difluorofenilo	1.092	4-cloro-3,5-difluorofenilo
1.093	2,4-dicloro-3-fluorofenilo	1.094	2,4-dicloro-5-fluorofenilo
1.095	2,4-dicloro-6-fluorofenilo	1.096	2,3,4-trifluorofenilo
1.097	2,4,6-trifluorofenilo	1.098	2,4,5-trifluorofenilo
1.099	3,4,5-trifluorofenilo	1.100	pentafluorofenilo
1.101	2-bromo-4-cianofenilo	1.102	3-bromo-4-cianofenilo
1.103	4-bromo-2-cianofenilo	1.104	4-bromo-3-cianofenilo
1.105	2-ciano-4-nitrofenilo	1.106	3-ciano-4-nitrofenilo
1.107	2-ciano-4-trifluorometilofenilo	1.108	3-ciano-4-trifluorometilofenilo
1.109	2,4-dicianofenilo	1.110	3,4-dicianofenilo

Número de Compuesto	A	Número de Compuesto	A
1.111	3-cloropiridin-2-ilo	1.112	4-cloropiridin-2-ilo
1.113	5-cloropiridin-2-ilo	1.114	6-cloropiridin-2-ilo
1.115	2-cloropiridin-3-ilo	1.116	4-cloropiridin-3-ilo
1.117	5-cloropiridin-3-ilo	1.118	6-cloropiridin-3-ilo
1.119	2-cloropiridin-4-ilo	1.120	3-cloropiridin-4-ilo
1.121	3,4-dicloropiridin-2-ilo	1.122	3,5-dicloropiridin-2-ilo
1.123	3,6-dicloropiridin-2-ilo	1.124	2,5-dicloropiridin-3-ilo
1.125	2,6-dicloropiridin-3-ilo	1.126	2,3-dicloropiridin-4-ilo
1.127	2,5-dicloropiridin-4-ilo	1.128	3,5,6-tricloropiridin-2-ilo
1.129	3-fluoropiridin-2-ilo	1.130	4-fluoropiridin-2-ilo
1.131	5-fluoropiridin-2-ilo	1.132	6-fluoropiridin-2-ilo
1.133	2-fluoropiridin-3-ilo	1.134	4-fluoropiridin-3-ilo
1.135	5-fluoropiridin-3-ilo	1.136	6-fluoropiridin-3-ilo
1.137	2-fluoropiridin-4-ilo	1.138	3-fluoropiridin-4-ilo
1.139	3,4-difluoropiridin-2-ilo	1.140	3,5-difluoropiridin-2-ilo
1.141	3,6-difluoropiridin-2-ilo	1.142	2,5-difluoropiridin-3-ilo
1.143	2,6-difluoropiridin-3-ilo	1.144	2,3-difluoropiridin-4-ilo
1.145	2,5-difluoropiridin-4-ilo	1.146	3,5,6-trifluoropiridin-2-ilo
1.147	3-trifluorometilopiridin-2-ilo	1.148	4-trifluorometilopiridin-2-ilo
1.149	5-trifluorometilopiridin-2-ilo	1.150	6-trifluorometilopiridin-2-ilo
1.151	2-trifluorometilopiridin-3-ilo	1.152	4-trifluorometilopiridin-3-ilo
1.153	5-trifluorometilopiridin-3-ilo	1.154	6-trifluorometilopiridin-3-ilo
1.155	2-trifluorometilopiridin-4-ilo	1.156	3-trifluorometilopiridin-4-ilo
1.157	4-cloro-3-fluoropiridin-2-ilo	1.158	5-cloro-3-fluoropiridin-2-ilo

Número de Compuesto	A	Número de Compuesto	A
1.159	6-cloro-3-fluoropiridin-2-ilo	1.160	3-cloro-4-fluoropiridin-2-ilo
1.161	3-cloro-5-fluoropiridin-2-ilo	1.162	3-cloro-6-fluoropiridin-2-ilo
1.163	3-cloro-5-trifluorometilopiridin-2-ilo	1.164	3-fluoro-5-trifluorometilopiridin-2-ilo
1.165	6-fluoro-3,4,5-tricloropiridin-2-ilo	1.166	4-metilo-3,5,6-trifluoropiridin-2-ilo
1.167	pirimidin-2-ilo	1.168	5-fluoropirimidin-2-ilo
1.169	5-cloropirimidin-2-ilo	1.170	5-bromopirimidin-2-ilo
1.171	6-cloropiridazin-3-ilo	1.172	6-bromopiridazin-3-ilo
1.173	quinoline-2-ilo	1.174	6-fluoroquinolin-2-ilo
1.175	7-fluoroquinolin-2-ilo	1.176	6-cloroquinolin-2-ilo
1.177	7-cloroquinolin-2-ilo	1.178	6-bromoquinolin-2-ilo
1.179	7-bromoquinolin-2-ilo	1.180	6-trifluorometiloquinolin-2-ilo
1.181	7-trifluorometiloquinolin-2-ilo	1.182	quinoxalin-2-ilo
1.183	6-fluoroquinoxazin-2-ilo	1.184	7-fluoroquinoxalin-2-ilo
1.185	6-cloroquinoxalin-2-ilo	1.186	7-cloroquinoxalin-2-ilo
1.187	6-bromoquinoxalin-2-ilo	1.188	7-bromoquinoxalin-2-ilo
1.189	6-trifluorometiloquinoxalin-2-ilo	1.190	7-trifluorometiloquinoxalin-2-ilo
1.191	quinazolin-2-ilo	1.192	6-fluoroquinazolin-2-ilo
1.193	7-fluoroquinazolin-2-ilo	1.194	6-cloroquinazolin-2-ilo
1.195	7-cloroquinazolin-2-ilo	1.196	6-bromoquinazolin-2-ilo
1.197	7-bromoquinazolin-2-ilo	1.198	benzoxazol-2-ilo
1.199	5-fluorobenzoxazol-2-ilo	1.200	6-fluorobenzoxazol-2-ilo
1.201	5-clorobenzoxazol-2-ilo	1.202	6-clorobenzoxazol-2-ilo

Número de Compuesto	A	Número de Compuesto	A
1.203	5-bromobenzotiazol-2-ilo	1.204	6-bromobenzotiazol-2-ilo
1.205	5-trifluorometilobenzotiazol-2-ilo	1.206	6-trifluorometilobenzotiazol-2-ilo
1.207	benzotiazol-2-ilo	1.208	5-fluorobenzotiazol-2-ilo
1.209	6-fluorobenzotiazol-2-ilo	1.210	5-clorobenzotiazol-2-ilo
1.211	6-clorobenzotiazol-2-ilo	1.212	5-bromobenzotiazol-2-ilo
1.213	6-bromobenzotiazol-2-ilo	1.214	5-trifluorometilobenzotiazol-2-ilo
1.215	6-trifluorometilobenzotiazol-2-ilo	1.216	benzo[1,2,4]triazin-3-ilo
1.217	6-fluorobenzo[1,2,4]triazin-3-ilo	1.218	7-fluorobenzo[1,2,4]triazin-3-ilo
1.219	6-clorobenzo[1,2,4]triazin-3-ilo	1.220	7-clorobenzo[1,2,4]triazin-3-ilo
1.221	6-bromobenzo[1,2,4]triazin-3-ilo	1.222	7-bromobenzo[1,2,4]triazin-3-ilo

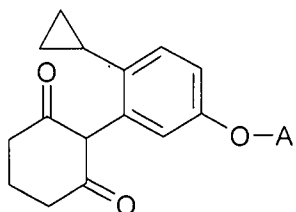
La Tabla 2 cubre los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

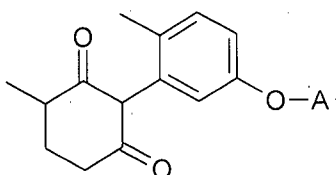
5 La Tabla 3 cubre los compuestos del siguiente tipo

190



en donde A es como se define en la Tabla 1.

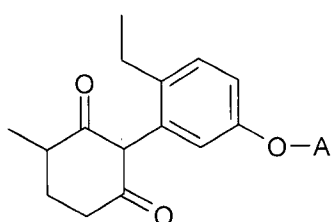
La Tabla 4 cubre los compuestos del siguiente tipo



5

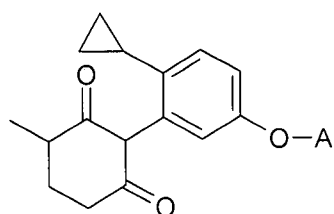
en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 5 cubre los compuestos del siguiente tipo



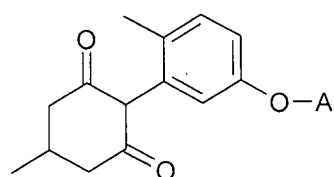
en donde A es como se define en la Tabla 1.

10 La Tabla 6 cubre los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

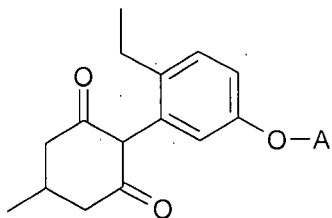
La Tabla 7 cubre los compuestos del siguiente tipo



15 en donde A es como se define en la Tabla 1.

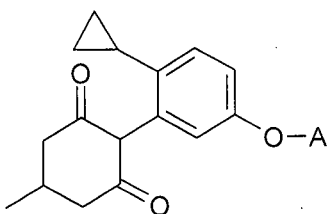
191

La Tabla 8 cubre los compuestos del siguiente tipo



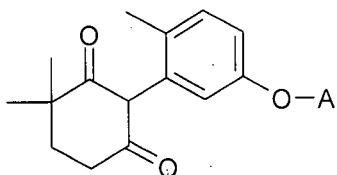
en donde A es como se define en la Tabla 1.

5 La Tabla 9 cubre los compuestos del siguiente tipo



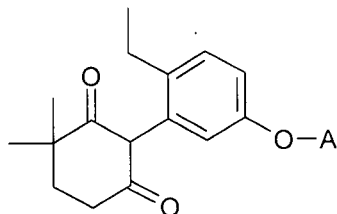
en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 10 cubre los compuestos del siguiente tipo



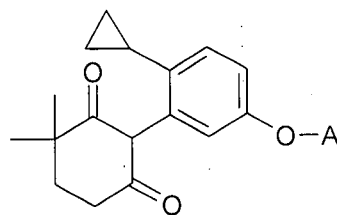
10 en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 11 cubre los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

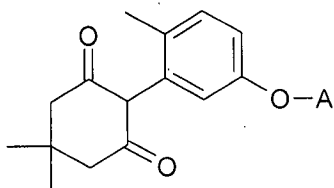
La Tabla 12 cubre los compuestos del siguiente tipo



192

en donde A es como se define en la Tabla 1.

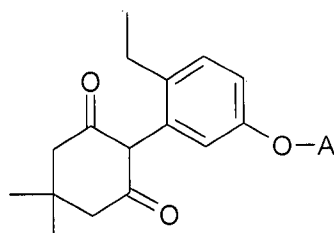
La Tabla 13 cubre los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

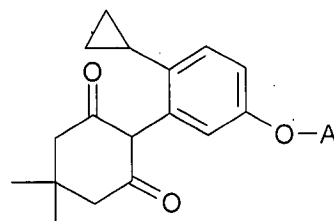
5

La Tabla 14 cubre los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

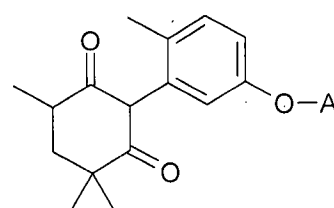
La Tabla 15 cubre los compuestos del siguiente tipo



10

en donde A es como se define en la Tabla 1.

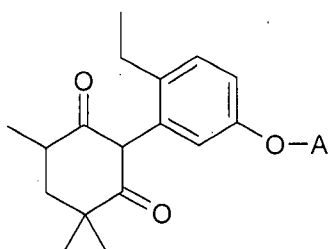
La Tabla 16 cubre los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

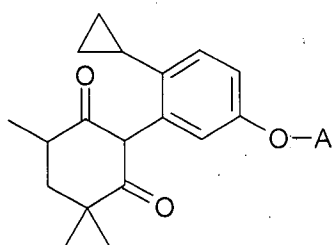
15 La Tabla 17 cubre los compuestos del siguiente tipo

193



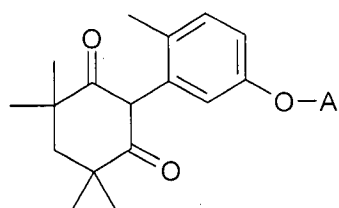
en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 18 cubre los compuestos del siguiente tipo



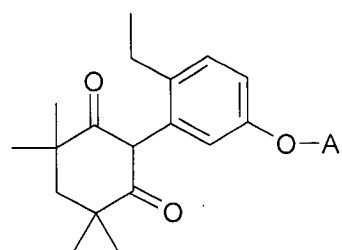
5 en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 19 cubre los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

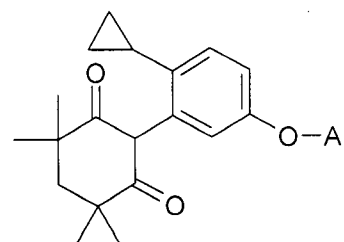
La Tabla 20 cubre los compuestos del siguiente tipo



10

en donde A es como se define en la Tabla 1.

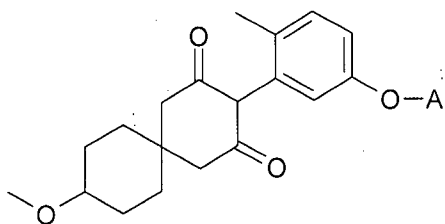
La Tabla 21 cubre los compuestos del siguiente tipo



194

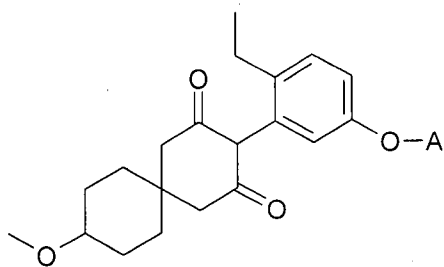
en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 22 cubre los compuestos del siguiente tipo



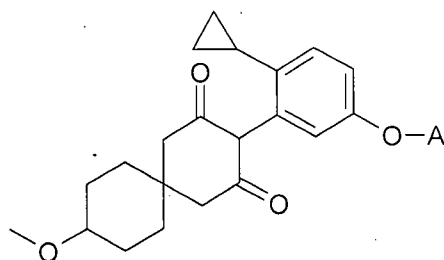
en donde A es como se define en la Tabla 1.

5 La Tabla 23 cubre los compuestos del siguiente tipo



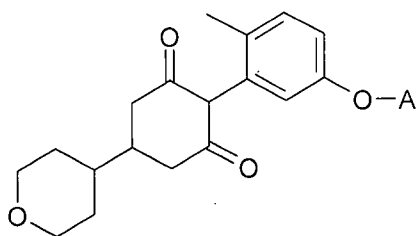
en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 24 cubre los compuestos del siguiente tipo



10 en donde A es como se define en la Tabla 1.

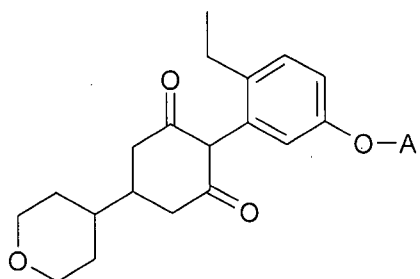
La Tabla 25 cubre los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

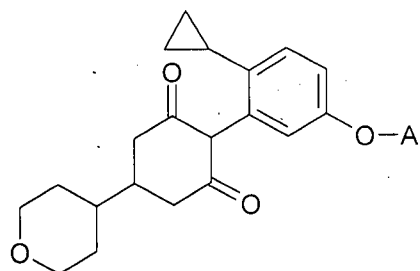
La Tabla 26 cubre los compuestos del siguiente tipo

195



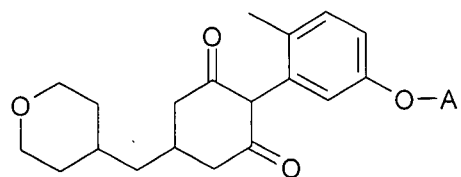
en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 27 cubre los compuestos del siguiente tipo



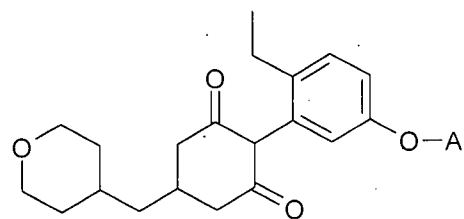
5 en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 28 cubre los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

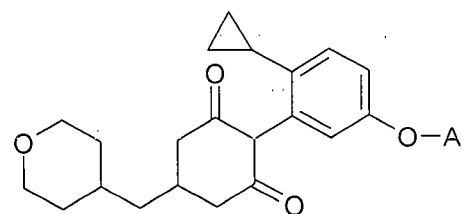
La Tabla 29 cubre los compuestos del siguiente tipo



10

en donde A es como se define en la Tabla 1.

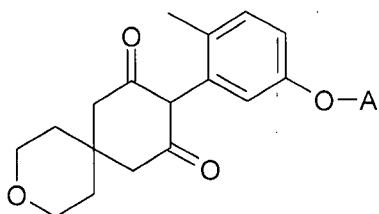
La Tabla 30 cubre los compuestos del siguiente tipo



196

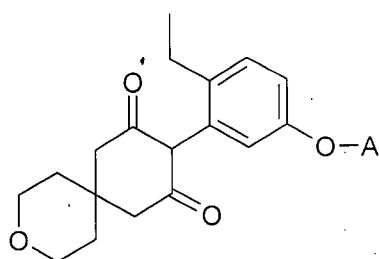
en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 31 cubre los compuestos del siguiente tipo



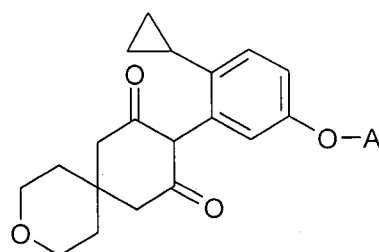
en donde A es como se define en la Tabla 1.

5 La Tabla 32 cubre los compuestos del siguiente tipo



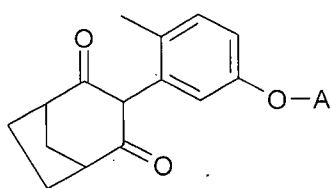
en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 33 cubre los compuestos del siguiente tipo



10 en donde A es como se define en la Tabla 1.

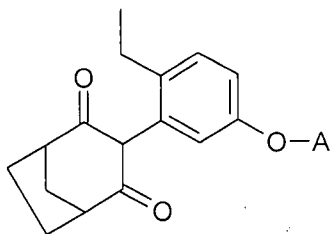
La Tabla 34 cubre los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

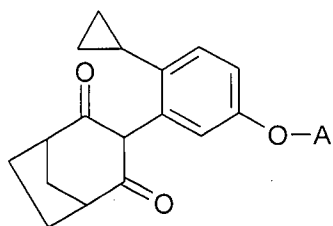
La Tabla 35 cubre los compuestos del siguiente tipo

197



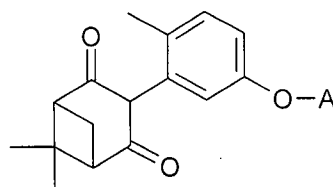
en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 36 cubre los compuestos del siguiente tipo



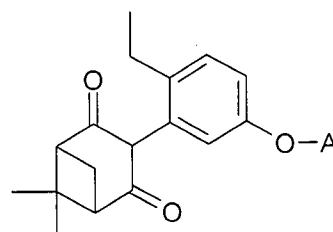
5 en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 37 cubre los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

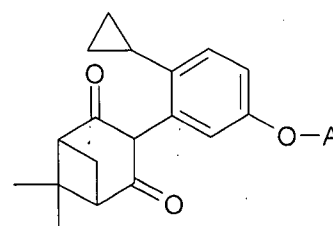
La Tabla 38 cubre los compuestos del siguiente tipo



10

en donde A es como se define en la Tabla 1.

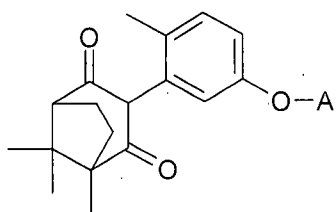
La Tabla 39 cubre los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

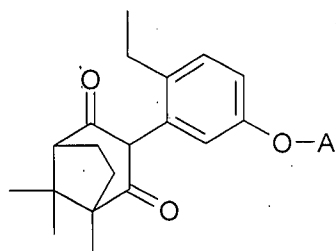
198

La Tabla 40 cubre los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

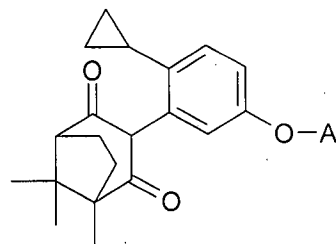
La Tabla 41 cubre los compuestos del siguiente tipo



5

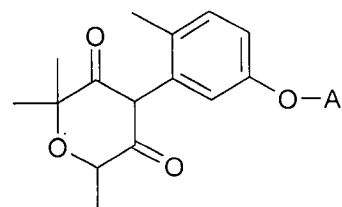
en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 42 cubre los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

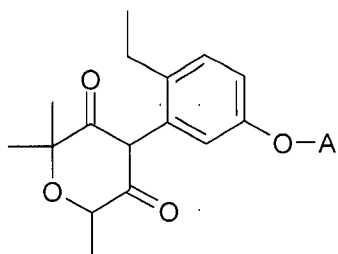
10 La Tabla 43 cubre los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

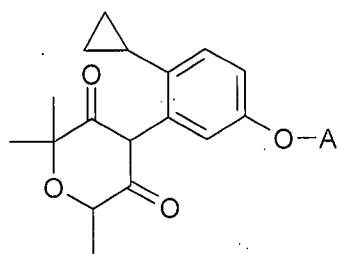
La Tabla 44 cubre los compuestos del siguiente tipo

199



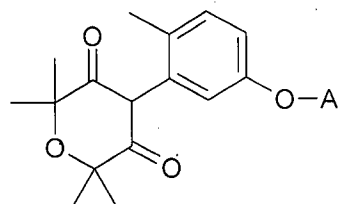
en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 45 cubre los compuestos del siguiente tipo



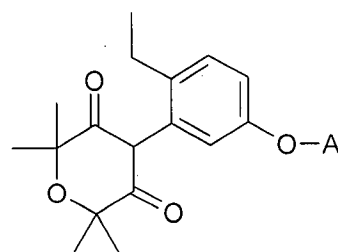
5 en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 46 cubre los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 47 cubre los compuestos del siguiente tipo

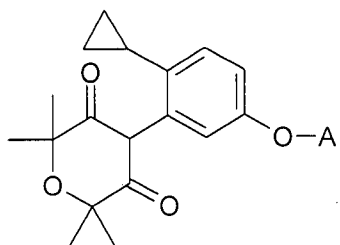


10

en donde A es como se define en la Tabla 1.

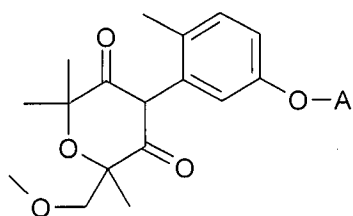
La Tabla 48 cubre los compuestos del siguiente tipo

200



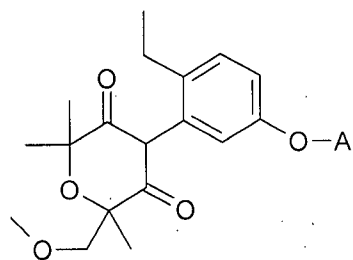
en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 49 cubre los compuestos del siguiente tipo

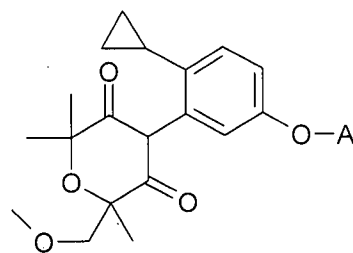


5 en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 50 cubre los compuestos del siguiente tipo



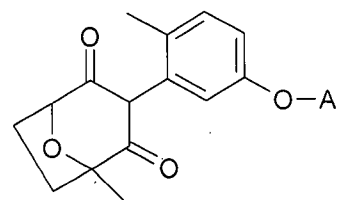
La Tabla 51 cubre los compuestos del siguiente tipo



10

en donde A es como se define en la Tabla 1.

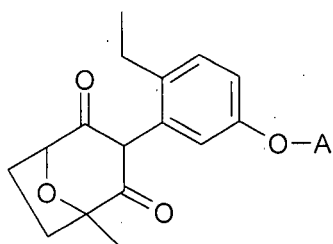
La Tabla 52 cubre los compuestos del siguiente tipo



201

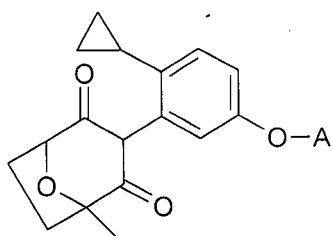
en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 53 cubre los compuestos del siguiente tipo



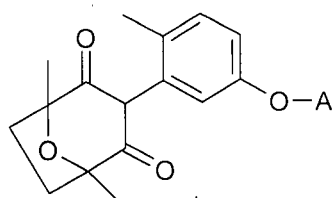
en donde A es como se define en la Tabla 1.

5 La Tabla 54 cubre los compuestos del siguiente tipo



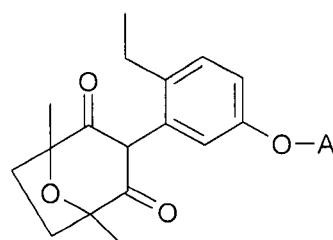
en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 55 cubre los compuestos del siguiente tipo



10 en donde A es como se define en la Tabla 1.

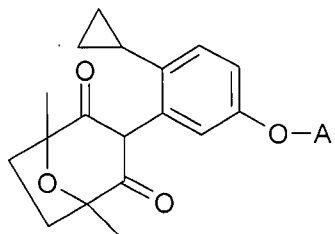
La Tabla 56 cubre los compuestos del siguiente tipo



en donde A es como se define en la Tabla 1.

La Tabla 57 cubre los compuestos del siguiente tipo

202



en donde A es como se define en la Tabla 1.

Ejemplos Biológicos

Las semillas de una variedad de especies de pruebas se siembran en suelo estándar en materas. Después de cultivo durante un día (pre-emergencia) o después de 8 días de cultivo (post-emergencia) bajo condiciones controladas en un invernadero (a 24/16°C, día/noche; 14 horas de luz; 65 % de humedad), las plantas se rocían con una solución de rociado acuosa derivada de la formulación del ingrediente activo técnico en solución de acetona / agua (50:50) que contiene 0.5% de Tween 20 (monolaurato de sorbitán polioxietileno, CAS RN 9005-64-5). Las plantas de prueba luego se hacen crecer en un invernadero bajo condiciones controladas en un invernadero (a 24/16°C, día/noche; 14 horas de luz; 65 % de humedad) y se hidrata dos veces diariamente. Después de 13 días para pre y post-emergencia, se evalúa la prueba (100 = daño total a la planta; 0 = sin daño a la planta).

Plantas de prueba:

Lolium perenne (LOLPE), *Alopecurus myosuroides* (ALOMY),
Echinochloa crus-galli (ECHCG), y *Avena fatua* (AVEFA).

203

Actividad Pre-Emergencia

Número de Compuesto	Índice g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-1	250	-	0	0	0
A-2	250	-	0	0	0
A-4	250	-	40	100	0
A-5	250	-	0	90	0
A-6	250	-	0	30	0
A-7	250	-	60	100	60
A-8	250	100	60	100	10
A-9	250	80	60	100	30
A-10	250	30	0	90	20
A-11	250	0	0	0	0
A-12	250	0	0	0	0
A-13	250	0	0	0	0
A-14	250	0	0	0	0
A-15	250	100	100	100	60
A-16	250	0	0	100	0
A-19	250	80	50	100	70
A-20	250	0	40	100	20
A-21	250	20	0	30	0
A-22	250	60	20	80	10
A-23	250	90	70	90	70
A-24	250	90	30	90	40
A-25	250	80	70	90	80
A-26	250	80	70	100	40
A-27	250	60	40	100	60
A-28	250	40	20	70	0
A-29	250	30	0	40	10
A-30	250	70	70	80	50
A-31	250	100	90	100	80
A-32	250	80	30	90	20
A-33	250	80	20	90	10
A-34	250	100	100	100	100
A-35	250	70	90	100	70
A-36	250	90	90	100	90
A-37	250	80	70	100	70
A-38	250	70	50	70	10
A-39	250	30	30	40	0
A-40	250	50	50	80	20
A-41	250	60	40	100	20
A-43	250	10	10	90	0
A-44	250	100	100	100	100
A-45	250	100	100	100	100

201

Número de Compuesto	Índice g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-46	250	70	100	90	30
A-47	250	40	50	90	0
A-48	250	70	100	100	30
A-49	250	100	90	100	40
A-50	250	70	0	100	0
A-52	250	70	40	60	20
A-53	250	40	0	20	0
A-54	250	100	100	100	90
A-55	250	100	80	100	90
A-56	250	100	80	80	30
A-58	250	0	0	70	0
A-59	250	100	80	100	70
A-60	250	40	0	50	0
A-62	250	100	100	100	100
A-64	250	80	60	20	0
A-65	250	80	70	100	90
A-66	250	80	100	100	90
A-67	250	100	90	100	90
A-68	250	70	30	100	30
A-69	250	30	20	80	0
A-70	250	50	60	100	10
A-71	250	40	30	90	0
A-72	250	70	60	90	30
A-73	250	80	90	100	80
A-74	250	100	60	100	90
A-75	250	100	100	100	80
A-76	250	60	70	100	80
A-77	250	30	40	70	20
A-78	250	100	100	100	80
A-79	250	90	80	100	80
A-81	250	40	30	90	10
A-82	250	100	70	100	90
A-83	250	90	70	100	90
A-84	250	100	70	100	60
A-85	250	100	100	100	100
A-86	250	100	90	100	100
A-87	250	40	30	60	20
A-88	250	100	80	100	60
A-89	250	100	80	100	80
A-90	250	90	70	100	70
A-91	250	100	80	100	70
A-92	250	90	40	100	30
A-93	250	90	60	100	60
A-94	250	100	40	90	20

205

Número de Compuesto	Índice g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-95	250	90	70	90	80
A-96	250	100	70	90	40
A-97	250	100	80	100	90
A-98	250	60	40	80	20
A-99	250	100	60	100	30
A-100	250	80	40	100	40
A-101	250	90	60	90	80
A-102	250	20	0	10	0
A-103	250	40	10	30	0
A-104	250	100	90	100	30
A-105	250	100	70	100	10
A-106	250	100	60	90	20
A-107	250	100	90	100	80
A-108	250	70	40	80	40
A-109	250	80	80	100	70
A-111	250	40	10	40	30
A-112	250	90	40	60	30
A-113	250	100	30	60	30
A-114	250	90	20	60	50
A-115	250	0	0	0	0
A-116	250	20	0	20	0
A-117	250	20	0	20	0
A-118	250	100	100	100	80
A-121	250	0	10	10	0
A-123	250	20	30	30	0
A-124	250	0	0	10	0
A-126	250	0	0	10	0
A-127	250	0	0	0	0
A-128	250	60	20	50	10
A-129	250	10	10	30	0
A-130	250	0	0	30	0
A-131	250	60	30	90	40
A-135	250	10	10	30	0
A-140	250	50	20	50	0
A-142	250	10	20	40	0
A-143	250	70	60	100	40
A-145	250	10	10	20	0
A-146	250	0	10	10	0
A-147	250	80	50	100	20
A-148	250	100	50	90	90
A-149	250	20	10	60	10
A-150	250	70	10	80	10
A-151	250	50	30	70	20
A-153	250	60	50	100	20

Número de Compuesto	Índice g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-154	250	10	0	20	0
A-156	250	20	20	60	0
A-157	250	50	40	80	30
A-159	250	100	30	90	40
A-160	250	0	0	50	0
A-161	250	90	70	100	50
A-162	250	50	30	60	10
A-163	250	100	70	100	70
A-166	250	10	20	40	20
A-167	250	30	30	100	10
A-168	250	80	60	70	10
A-169	250	10	20	30	0
A-172	250	100	90	100	60
A-173	250	10	0	50	0
A-174	250	70	50	100	40
A-177	250	30	0	60	0
A-178	250	0	10	10	0
A-179	250	0	0	-	0
A-180	250	0	0	-	0
A-181	250	0	0	0	0
A-182	250	80	30	90	30
A-183	250	80	30	60	20
A-184	250	50	10	50	0
A-185	250	0	0	30	0
A-188	250	100	90	90	90
A-189	250	60	50	90	40
A-190	250	50	30	80	30
A-191	250	60	40	90	40
A-192	250	0	0	20	0
A-193	250	70	30	90	20
A-195	250	40	30	100	0
A-196	250	0	0	0	0
A-197	250	20	0	30	10
A-198	250	10	0	60	0
A-200	250	60	20	50	0
A-201	250	30	10	60	0
A-202	250	10	0	60	0
A-203	250	90	20	50	30
A-204	250	10	0	20	0
A-205	250	60	20	60	10
A-206	250	10	0	30	0
A-207	250	60	30	70	10
A-210	250	20	30	60	10
A-212	250	50	30	70	10

208

Número de Compuesto	Índice g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-214	250	40	50	90	30
A-215	250	0	0	20	0
A-216	250	10	30	70	0
A-217	250	60	30	40	0
A-218	250	20	20	50	10
A-219	250	80	50	90	30
A-220	250	10	10	30	0
A-221	250	60	60	70	40
A-222	250	0	0	0	0
A-223	250	90	80	100	50
A-224	250	30	20	20	10
A-225	250	10	0	60	0
A-226	250	30	0	60	10
A-227	250	60	30	80	20
A-229	250	60	30	70	0
A-230	250	0	0	20	0
A-233	250	90	70	100	70
A-234	250	90	70	100	40
A-235	250	70	50	100	30
A-236	250	20	40	80	20
A-237	250	20	10	40	10
A-238	250	90	60	100	40
A-239	250	60	20	90	0
A-240	250	70	30	70	0
A-241	250	70	30	80	0
A-242	250	80	70	-	40
A-243	250	100	90	-	80
A-244	250	70	20	90	0
A-245	250	50	0	80	0
A-246	250	60	70	100	50
A-247	250	90	90	100	50
A-248	250	100	90	100	80
A-249	250	90	60	90	60
A-250	250	80	80	90	50
A-251	250	80	40	100	20
A-253	250	100	70	80	30
A-255	250	100	100	100	100
A-256	250	80	50	80	20
A-257	250	20	0	40	0
A-258	250	30	30	70	10
A-260	250	90	80	90	0
A-261	250	80	80	90	50
A-262	250	70	30	70	0
A-263	250	50	60	100	20

208

Número de Compuesto	Índice g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-264	250	90	90	100	80
A-265	250	80	60	90	0
A-266	250	90	50	90	50
A-267	250	100	100	100	100
A-268	250	100	90	100	80
A-269	250	90	100	100	80
A-270	250	90	90	100	60
A-271	250	90	90	100	50
A-272	250	100	100	100	100
A-273	250	100	100	100	100
A-274	250	100	100	100	100
A-275	250	100	100	100	90
A-276	250	70	40	100	10
A-277	250	100	30	100	30
A-278	250	70	60	0	70
A-279	250	100	90	100	100
A-280	250	70	70	100	40
A-281	250	80	70	100	0
A-282	250	60	10	100	10
A-283	250	60	70	90	10
A-284	250	70	60	100	0
A-285	250	100	90	100	70
A-286	250	100	90	100	40
A-287	250	100	100	100	90
A-288	250	100	90	100	60
A-289	250	90	60	100	40
A-290	250	0	0	20	0
A-291	250	100	70	100	90
A-292	250	100	90	100	50
A-293	250	100	80	100	30
A-294	250	70	60	90	0
A-295	250	50	50	70	20
A-297	250	100	70	100	50
A-298	250	100	100	100	100
A-299	250	100	50	100	20
A-300	250	100	80	100	0
A-301	250	100	70	100	60
A-302	250	20	10	60	40
A-303	250	90	80	100	80
A-304	250	70	80	100	80
A-305	250	90	80	100	60
A-306	250	70	60	100	0
A-307	250	90	100	100	70
A-308	250	70	90	100	80

Número de Compuesto	Índice g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-309	250	20	40	70	0
A-310	250	70	100	100	50
A-311	250	100	90	100	100
A-312	250	100	70	100	70
A-313	250	100	80	100	70
A-314	250	100	30	100	20
A-315	250	100	80	100	60
A-316	250	100	70	100	60
A-317	250	100	100	100	100
A-318	250	100	90	100	90
A-319	250	100	90	100	70
A-320	250	100	80	100	80
A-321	250	90	70	100	50
A-322	250	100	60	100	40
A-323	250	100	70	100	80
A-324	250	100	90	100	90
A-325	250	90	60	100	20
A-326	250	90	30	70	10
A-327	250	90	70	100	20
A-328	250	90	50	100	30
A-329	250	100	90	100	90
A-330	250	100	80	100	80
A-331	250	100	90	100	80
A-332	250	100	80	100	70
A-333	250	90	50	100	40
A-334	250	100	100	100	100
A-335	250	100	100	100	90
A-336	250	100	90	100	80
A-337	250	100	90	100	70
A-338	250	100	90	100	80
A-339	250	90	100	100	80
A-340	250	70	80	100	50
A-341	250	100	100	100	90
A-342	250	100	90	100	60
A-343	250	100	50	100	50
A-344	250	80	40	100	30
A-345	250	100	90	100	60
A-346	250	100	100	100	90
A-347	250	100	70	100	10
A-348	250	100	60	100	10
A-349	250	90	40	100	10
A-350	250	100	90	100	50
A-351	250	90	60	100	10
A-352	250	90	70	100	20

210

Número de Compuesto	Índice g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-353	250	30	0	100	0
A-356	250	100	90	100	70
A-358	250	90	60	90	0
A-364	250	90	70	100	60
A-365	250	90	80	100	0
A-366	250	90	50	90	30
A-370	250	90	50	70	30
A-372	250	100	70	90	90
A-374	250	100	50	90	30
A-375	250	90	30	90	60
A-377	250	80	70	100	60

Número de Compuesto	Índice g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
P-1	250	100	80	100	20
P-2	250	100	80	100	70
P-3	250	100	70	100	70
P-4	250	100	80	100	60
P-5	250	100	100	100	70
P-6	250	90	80	100	20

Actividad Post-Emergencia

Número de Compuesto	Índice g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-1	250	-	20	60	0
A-2	250	-	60	90	50
A-4	250	-	80	100	0
A-5	250	-	20	90	0
A-6	250	-	0	70	0
A-7	250	-	90	100	70
A-8	250	100	100	100	0
A-9	250	80	90	100	100
A-10	250	100	100	100	90
A-11	250	50	50	60	20
A-12	250	50	20	70	0
A-13	250	0	0	70	0
A-14	250	40	0	100	10
A-15	250	100	90	100	70
A-16	250	20	0	80	0
A-19	250	90	60	100	60
A-20	250	50	0	80	70
A-21	250	70	100	100	60

211

Número de Compuesto	Índice g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-22	250	30	20	100	30
A-23	250	90	80	100	80
A-24	250	70	70	100	70
A-25	250	90	90	100	100
A-26	250	70	80	100	40
A-27	250	30	30	90	40
A-28	250	40	30	80	20
A-29	250	10	0	70	0
A-30	250	60	70	100	60
A-31	250	100	90	100	80
A-32	250	40	30	100	20
A-33	250	50	40	100	50
A-34	250	100	100	100	100
A-35	250	80	80	100	90
A-36	250	90	100	100	100
A-37	250	90	100	100	100
A-38	250	30	20	80	30
A-39	250	30	30	70	0
A-40	250	30	30	90	40
A-41	250	30	30	90	10
A-43	250	20	0	70	0
A-44	250	100	100	100	100
A-45	250	100	100	100	100
A-46	250	60	80	100	50
A-47	250	30	30	80	10
A-48	250	70	80	100	40
A-49	250	90	90	100	70
A-50	250	60	0	50	0
A-52	250	50	30	90	40
A-53	250	30	0	80	0
A-54	250	100	100	100	100
A-55	250	100	100	100	100
A-56	250	100	100	100	0
A-58	250	0	0	80	0
A-59	250	70	80	100	70
A-60	250	0	0	0	0
A-62	250	100	100	100	100
A-64	250	40	40	30	0
A-65	250	80	90	100	90
A-66	250	80	100	100	100
A-67	250	90	100	100	80
A-68	250	60	60	100	40
A-69	250	20	10	60	0
A-70	250	10	30	70	10

Número de Compuesto	Índice g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-71	250	60	60	90	30
A-72	250	40	60	90	50
A-73	250	70	90	100	40
A-74	250	80	90	100	80
A-75	250	100	100	100	90
A-76	250	70	80	100	70
A-77	250	30	60	70	30
A-78	250	90	100	90	90
A-79	250	80	100	100	60
A-81	250	30	50	70	50
A-82	250	90	100	100	100
A-83	250	60	90	100	100
A-84	250	90	100	100	50
A-85	250	90	100	100	90
A-86	250	70	90	100	100
A-87	250	40	70	80	40
A-88	250	50	70	90	70
A-89	250	60	90	100	90
A-90	250	80	60	90	30
A-91	250	80	90	100	90
A-92	250	30	20	80	10
A-93	250	20	60	50	20
A-94	250	20	10	40	0
A-95	250	50	60	80	80
A-96	250	30	60	60	20
A-97	250	90	100	100	90
A-98	250	30	70	100	60
A-99	250	80	80	100	90
A-100	250	40	80	90	80
A-101	250	100	100	100	90
A-102	250	20	10	40	0
A-103	250	20	10	40	0
A-104	250	90	90	100	80
A-105	250	90	90	90	10
A-106	250	80	90	90	50
A-107	250	40	80	100	80
A-108	250	50	60	100	70
A-109	250	90	90	100	90
A-111	250	50	10	40	0
A-112	250	60	20	70	20
A-113	250	40	10	90	0
A-114	250	50	10	80	10
A-115	250	0	0	60	10
A-116	250	40	80	100	30

Número de Compuesto	Índice g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-117	250	40	80	100	30
A-118	250	100	90	100	80
A-121	250	20	10	50	0
A-123	250	30	20	50	10
A-124	250	10	10	40	0
A-126	250	10	10	50	20
A-127	250	10	0	30	0
A-128	250	40	50	70	30
A-129	250	10	10	30	10
A-130	250	10	10	40	0
A-131	250	70	70	90	80
A-135	250	30	30	50	20
A-140	250	70	70	100	70
A-142	250	10	20	70	20
A-143	250	100	100	100	100
A-145	250	20	20	70	20
A-146	250	20	30	70	30
A-147	250	90	80	100	70
A-148	250	90	90	100	100
A-149	250	30	10	50	30
A-150	250	40	60	100	70
A-151	250	30	20	70	20
A-153	250	30	70	90	80
A-154	250	20	20	60	10
A-156	250	20	30	50	20
A-157	250	90	90	100	100
A-159	250	100	80	100	80
A-160	250	20	20	60	10
A-161	250	90	100	100	70
A-162	250	70	80	90	50
A-163	250	100	90	100	90
A-166	250	20	30	60	20
A-167	250	50	60	100	40
A-168	250	90	90	90	20
A-169	250	20	20	30	30
A-172	250	100	100	100	100
A-173	250	10	0	20	10
A-174	250	90	90	100	100
A-177	250	40	0	70	20
A-178	250	30	40	80	40
A-179	250	20	0	20	0
A-180	250	10	0	30	0
A-181	250	20	0	30	0
A-182	250	60	90	100	60

214

Número de Compuesto	Índice g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-183	250	40	70	90	50
A-184	250	30	20	30	0
A-185	250	30	20	70	20
A-188	250	100	100	100	100
A-189	250	90	90	100	100
A-190	250	90	80	100	90
A-191	250	100	100	100	100
A-192	250	10	0	40	10
A-193	250	100	80	100	10
A-195	250	80	60	100	60
A-196	250	10	0	20	0
A-197	250	60	70	100	70
A-198	250	70	70	100	60
A-200	250	70	70	90	10
A-201	250	70	60	100	60
A-202	250	30	10	60	20
A-203	250	90	90	90	100
A-204	250	40	60	70	50
A-205	250	90	70	100	60
A-206	250	50	20	70	30
A-207	250	90	80	100	80
A-210	250	100	90	100	90
A-212	250	70	60	90	90
A-214	250	100	100	100	70
A-215	250	20	10	40	0
A-216	250	70	60	80	70
A-217	250	60	60	70	50
A-218	250	80	70	100	100
A-219	250	90	90	100	100
A-220	250	80	60	100	30
A-221	250	90	80	100	50
A-222	250	30	20	30	20
A-223	250	90	100	100	60
A-224	250	70	50	70	50
A-225	250	70	60	90	50
A-226	250	60	60	100	60
A-227	250	70	70	90	60
A-229	250	100	90	100	10
A-230	250	40	20	80	60
A-233	250	100	100	100	100
A-234	250	80	80	100	90
A-235	250	100	90	100	100
A-236	250	30	100	100	100
A-237	250	10	10	70	10

215

Número de Compuesto	Índice g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-238	250	90	70	100	90
A-239	250	30	20	70	10
A-240	250	60	30	70	40
A-241	250	60	40	90	70
A-242	250	100	100	100	100
A-243	250	100	100	100	100
A-244	250	80	60	90	70
A-245	250	20	0	80	10
A-246	250	20	50	100	60
A-247	250	100	90	100	100
A-248	250	100	100	100	100
A-249	250	70	90	100	100
A-250	250	80	90	100	80
A-251	250	0	80	100	30
A-253	250	70	50	70	40
A-255	250	100	100	100	100
A-256	250	90	90	90	80
A-257	250	50	30	80	0
A-258	250	80	70	100	70
A-260	250	80	90	90	100
A-261	250	100	90	100	100
A-262	250	60	80	90	50
A-263	250	60	100	100	90
A-264	250	100	90	100	90
A-265	250	70	70	100	70
A-266	250	70	90	100	90
A-267	250	100	100	100	100
A-268	250	70	90	100	90
A-269	250	70	90	100	90
A-270	250	70	90	100	90
A-271	250	70	90	100	90
A-272	250	70	90	100	90
A-273	250	100	100	100	100
A-274	250	100	100	100	100
A-275	250	100	90	100	100
A-276	250	40	60	100	10
A-277	250	100	30	100	80
A-278	250	100	100	100	100
A-279	250	100	100	100	100
A-280	250	60	90	100	70
A-281	250	60	90	100	80
A-282	250	40	70	100	60
A-283	250	90	80	90	90
A-284	250	60	60	100	0

Número de Compuesto	Índice g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-285	250	100	100	100	100
A-286	250	100	100	100	90
A-287	250	100	100	100	100
A-288	250	90	100	100	90
A-289	250	100	100	100	100
A-290	250	10	0	60	0
A-291	250	100	100	100	100
A-292	250	90	100	100	90
A-293	250	100	100	100	100
A-294	250	20	40	80	40
A-295	250	40	80	100	60
A-297	250	100	100	100	100
A-298	250	100	100	100	100
A-299	250	80	90	100	90
A-300	250	60	80	100	70
A-301	250	90	100	100	60
A-302	250	70	60	100	50
A-303	250	100	100	100	100
A-304	250	100	100	100	100
A-305	250	100	100	100	100
A-306	250	60	70	100	80
A-307	250	100	100	100	100
A-308	250	100	90	100	100
A-309	250	50	50	100	70
A-310	250	90	100	100	80
A-311	250	100	100	100	100
A-312	250	100	100	100	100
A-313	250	80	90	100	90
A-314	250	70	40	100	70
A-315	250	90	40	90	80
A-316	250	40	50	100	80
A-317	250	100	100	100	100
A-318	250	100	90	100	90
A-319	250	100	100	100	100
A-320	250	90	100	100	100
A-321	250	90	90	100	90
A-322	250	90	90	100	80
A-323	250	70	60	90	80
A-324	250	100	100	100	100
A-325	250	40	50	100	30
A-326	250	90	30	100	90
A-327	250	70	80	100	90
A-328	250	70	60	100	80
A-329	250	70	80	100	90

217

Número de Compuesto	Índice g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
A-330	250	70	70	100	80
A-331	250	80	80	100	80
A-332	250	100	100	100	100
A-333	250	60	60	100	70
A-334	250	100	90	100	100
A-335	250	100	100	100	90
A-336	250	100	90	100	80
A-337	250	90	90	100	90
A-338	250	100	100	100	100
A-339	250	100	100	100	90
A-340	250	70	60	100	80
A-341	250	100	90	100	100
A-342	250	60	60	100	70
A-343	250	80	50	100	80
A-344	250	70	60	90	90
A-345	250	100	80	100	100
A-346	250	90	70	100	90
A-347	250	100	90	100	50
A-348	250	90	100	100	60
A-349	250	80	60	100	0
A-350	250	90	90	100	90
A-351	250	100	90	100	10
A-352	250	90	90	100	70
A-353	250	50	10	100	10
A-356	250	100	100	100	100
A-358	250	60	90	100	60
A-364	250	90	100	100	90
A-365	250	100	100	100	10
A-366	250	100	100	100	80
A-370	250	80	90	100	100
A-372	250	100	100	100	100
A-374	250	100	90	100	90
A-375	250	70	90	100	90
A-377	250	100	100	100	100

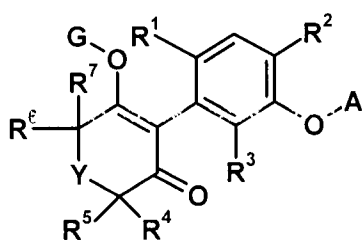
Número de Compuesto	Índice g/ha	LOLPE	ALOMY	ECHCG	AVEFA
P-1	250	90	80	100	60
P-2	250	90	90	100	70
P-3	250	90	90	100	60
P-4	250	90	90	100	60
P-5	250	80	80	100	70
P-6	250	70	90	90	50

REIVINDICACIONES

Lo que se reivindica es:

5

1. Un compuesto de la fórmula I



I,

en donde

10 A es un arilo mono o bicíclico o heteroarilo que contiene un heteroátomo seleccionado de nitrógeno, oxígeno y azufre, y que es no sustituido o sustituido,

R¹ es metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, halometilo, haloetilo, vinilo, propenilo, etinilo, propinilo, halógeno, metoxi, etoxi, halometoxi o haloetoxi,

15 R² y R³ son independientemente uno del otro hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, halometilo, haloetilo, vinilo, propenilo, etinilo, propinilo, halógeno, metoxi, etoxi, halometoxi o haloetoxi,

20 R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ son independientemente uno del otro hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₆ sustituido por alcoxi C₁-C₄ o halógeno, alquenilo C₂-C₆, alquenilo C₂-C₆ sustituido por alcoxi C₁-C₄ o halógeno,

25 alquinilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆ sustituido por alcoxi C₁-C₄ o halógeno, cicloalquilo C₃-C₇, cicloalquilo C₃-C₇ sustituido por alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄, cicloalquenilo C₅-C₇,

219

cicloalquenilo C₅-C₇ sustituido por alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄, heterociclilo o heterociclilo sustituido por alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄, o

R⁴ y R⁵, o R⁶ y R⁷, junto con los átomos a los cuales ellos se unen, forman un espiro-carbociclilo o espiro heterociclilo de 5 a 8 miembros, que contiene uno o dos heteroátomos seleccionados de nitrógeno, oxígeno o azufre, o

R⁵ y R⁶, junto con los átomos a los cuales ellos se unen, forman un carbociclilo o heterociclilo de 5 a 8 miembros, que contiene uno o dos heteroátomos seleccionados de nitrógeno, oxígeno o azufre,

Y es O, S(O)_n, C=O, CR⁸R⁹ o CR¹⁰R¹¹CR¹²R¹³,

n es 0, 1 o 2,

R⁸ y R⁹ son independientemente uno del otro hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₆ sustituido por alcoxi C₁-C₄ o halógeno, alquenilo C₂-C₆, alquenilo C₂-C₆ sustituido por alcoxi C₁-C₄ o halógeno,

alquinilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆ sustituido por alcoxi C₁-C₄ o halógeno, cicloalquilo C₃-C₇, cicloalquilo C₃-C₇ sustituido por alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄, cicloalquenilo C₅-C₇, cicloalquenilo C₅-C₇ sustituido por alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄, heterociclilo o heterociclilo sustituido por alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄, o

R⁸ y R⁹, junto con los átomos a los cuales ellos se unen, forman un espiro-carbociclilo o espiro heterociclilo de 5 a 8 miembros, que contiene uno o dos heteroátomos seleccionados de nitrógeno, oxígeno o azufre, y

R^{10} , R^{11} , R^{12} y R^{13} son independientemente uno del otro hidrógeno, alquilo C_1-C_6 o alcoxi C_1-C_6 , y

G es hidrógeno o un metal agrícolamente aceptable, sulfonio, amonio o grupo protector.

5

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde A es fenilo, naftilo, a 5- o 6-membered heteroarilo o a bicyclic 8- to 10-membered heteroarilo.

10

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde A es sustituido por halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , haloalqueno C_2-C_4 , alquino C_2-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfinilo C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfinilo C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , nitro, ciano, cicloalquilo C_3-C_6 , alquilcarbonilo C_1-C_3 , alcoxycarbonilo C_1-C_4 , aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo C_1-C_3 , di- alquilaminocarbonilo C_1-C_3 , alquilaminocarboniloxi C_1-C_3 , di- alquilaminocarboniloxi C_1-C_3 , aminotiocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo C_1-C_3 , dialquilaminotiocarbonilo C_1-C_3 , alquilcarbonilamino C_1-C_4 , cicloalquilcarbonilamino C_3-C_6 , alcoxycarbonilamino C_1-C_4 , alquiltiocarbonilamino C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_3 alquilo C_1-C_3 , alquilo C_1-C_6 tioalquilo C_1-C_6 , sulfinilalquilo C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 , alquilsulfinil C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 , alquilsulfoniloxi C_1-C_3 , haloalquilsulfoniloxi C_1-C_3 o dialquiloaminosulfonilo C_1-C_6 , o 2 sustituyentes sobre átomos de carbono adyacentes de A juntos forman un alquileo C_3-C_4 , en donde 1 o 2 grupos

25

221

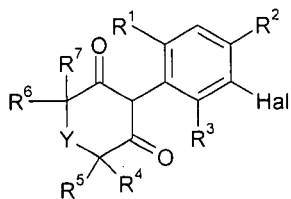
metileno se sustituyen opcionalmente por halógeno, o en donde se reemplazan 1 o 2 de estos grupos metileno por oxígeno.

- 5 4. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R^1 es metilo, etilo, *n*-propilo, ciclopropilo, halógeno o haloalcoxi C_1-C_2 .
- 10 5. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R^2 y R^3 son independientemente uno del otro hidrógeno, metilo o halógeno.
- 15 6. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R^4 , R^5 , R^6 y R^7 son independientemente uno del otro hidrógeno o alquilo C_1-C_6 , o R^4 y R^5 , o R^6 y R^7 juntos con los átomos a los cuales ellos se unen forman un espiro-tetrahidropiraniilo o un espiro-tetrahidrofuraniilo, o R^5 y R^6 juntos con los átomos a los cuales ellos se unen forman un carbocíclico de 6 a 7 miembros.
- 20 7. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde Y es O o CR^8R^9 , en donde R^8 y R^9 son como se define en la reivindicación 1.
- 25 8. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde G es hidrógeno.

9. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde A es fenilo, naftilo, piridilo, pirazinilo, pirimidinilo, piridazinilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, cinnolinilo, quinolinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo o benzotriazinilo, en cada caso sustituido por halógeno, metilo, trifluorometilo, nitro o ciano, R¹ es etilo, R² y R³ son hidrógeno, R⁴ a R⁷ son hidrógeno o metilo, o R⁵ y R⁶, junto con los átomos a los cuales ellos se unen, forman un carbociclilo de 6 o 7 miembros,

Y es O o CR⁸R⁹, en donde R⁸ y R⁹ son independientemente uno del otro hidrógeno o metilo, o R⁸ y R⁹, junto con los átomos a los cuales ellos se unen, forman un espiro-tetrahidropiraniilo o un espiro-tetrahidrofuranoilo, y G es hidrógeno.

10. Un proceso para la preparación de un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde G es hidrógeno, que comprende la reacción de un compuesto de la fórmula (K)



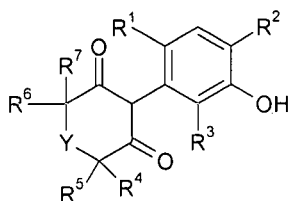
(K),

en donde Y y R¹ a R⁷ son como se define en la reivindicación 1 y Hal es bromo o yodo, con un compuesto A-OH, en donde A es como se define en la reivindicación 1, en la presencia de

223

un catalizador, un ligando o aditivo, y una base, en un disolvente.

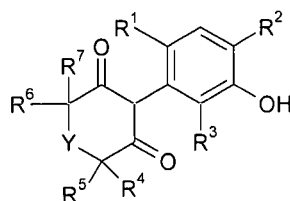
11. Un proceso para la preparación de un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde G es hidrógeno, que comprende la reacción de un compuesto de la fórmula (M)



(M).

en donde Y y R¹ a R⁷ son como se define en la reivindicación 1, con un compuesto A-Hal, en donde A es como se define en la reivindicación 1 y Hal es flúor, cloro, bromo o yodo, en la presencia o ausencia de un catalizador y ligando, y en la presencia de una base, y en un disolvente.

12. Un compuesto de la fórmula (M)



(M).

en donde Y y R¹ a R⁷ son como se define en la reivindicación 1.

13. Una composición herbicida, que, además de comprender adyuvantes de formulación, comprende una cantidad herbicidamente efectiva de un compuesto de la fórmula I.

224

14. Un método para controlar pastos y malezas en cultivos de plantas útiles, que comprende aplicar una cantidad herbicidamente efectiva de un compuesto de la fórmula I, o
5 de una composición que comprende tal un compuesto, a las plantas o al locus de las mismas.



(43) International Publication Date
22 July 2010 (22.07.2010)

(10) International Publication Number
WO 2010/081755 A1

(51) International Patent Classification:

C07D 309/10 (2006.01) C07D 413/10 (2006.01)
C07D 309/32 (2006.01) C07D 417/10 (2006.01)
C07D 311/96 (2006.01) C07D 493/10 (2006.01)
C07D 405/10 (2006.01) A01N 43/16 (2006.01)
C07D 407/04 (2006.01) C07C 17/093 (2006.01)
C07D 409/10 (2006.01)

(21) International Application Number:

PCT/EP2010/050074

(22) International Filing Date:

6 January 2010 (06.01.2010)

(25) Filing Language:

English

(26) Publication Language:

English

(30) Priority Data:

0900641.2 15 January 2009 (15.01.2009) GB

(71) Applicant (for all designated States except US): SYNGENTA LIMITED [GB/GB]; European Regional Centre, Priestley Road, Currey Research Park, Guildford Surrey GU2 7YH (GB).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): MATHEWS, Christopher, John [GB/GB]; Syngenta Limited, Jealotts Hill, International Research Center, Bracknell Berkshire RG42 6EY (GB). FINNEY, John [GB/GB]; Syngenta Limited, Jealotts Hill, International Research Centre, Bracknell Berkshire RG42 6EY (GB). SCUTT, James, Nicholas [GB/GB]; Syngenta Limited, Jealotts Hill, International Research Center, Bracknell Berkshire RG42 6EY (GB). ROBINSON, Louisa [GB/GB]; Syngenta Limited, Jealotts Hill, International Research Center, Bracknell

Berkshire RG42 6EY (GB). DELANEY, John, Stephen [GB/GB]; Syngenta Limited, Jealotts Hill International Research Center, Bracknell Berkshire RG42 6EY (GB).

(74) Agent: ARUNASALAM, V-Cumaran; Syngenta Crop Protection Münchwilen AG, Intellectual Property, Schaflihauserstrasse, CH-4332 Stein (CH).

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of national protection available): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LP, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

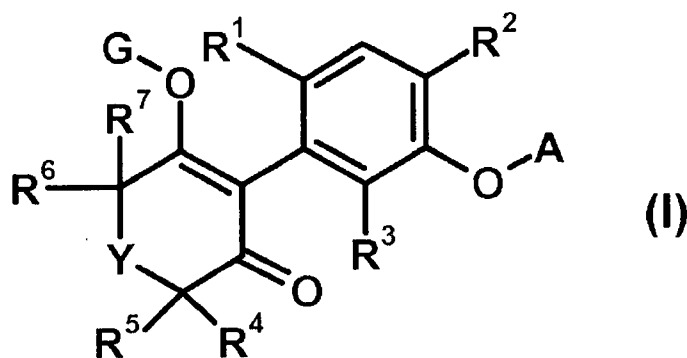
(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EurAsian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Declarations under Rule 4.17:

— as to applicant's entitlement to apply for and be granted a patent (Rule 4.17(ii))

[Continued on next page]

(54) Title: NOVEL HERBICIDES



(57) Abstract: Compounds of formula (I), wherein the substituents are as defined in claim 1, are suitable for use as herbicides.

226

WO 2010/081755 A1



Published:

— with international search report (Art. 21(3))

228



No. 11-100879- -00000-0000

Fecha: 2011-08-09 15:12:18 Dep. 2020 DIR NUEVASCR
Tra. 11 PATENTE/II Eje: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 227

PATENTE DE INVENCION ☐

MODELO

☐	Indicación que se solicita una patente.
☐	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
☐	Descripción de la invención
☐	Dibujos de ser estos pertinentes
☐	Comprobante de pago de las tasas establecidas (De ser el caso formato de descuento)
Completa ☐	Incompleta ☐

PATENTE DE INVENCION PCT ☒

MODELO DE UTILIDAD PCT ☐

Art.33 Decisión 486/00, Circular Única

☒	Indicación que se solicita una PCT
☒	Copia de la solicitud en español, tal como fue presentada inicialmente (capítulo descriptivo, reivindicatorio, resumen)
☐	Dibujos de ser estos pertinentes
☒	Comprobante de pago de las tasas establecidas (de ser el caso formato de descuento)
Completa ☒	Incompleta ☐

DISEÑO INDUSTRIAL ☐

(Art. 119 Decisión 486/00)

☐	Indicación que se solicita Diseño industrial
☐	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
☐	Representación gráfica y fotográfica del Diseño industrial o muestra del material que incorpora el diseño
☐	Comprobante de pago de las tasas establecidas
Completa ☐	Incompleta ☐

ESQUEMA DE TRAZADO ☐

(Art. 92 Decisión 486/00)

☐	Indicación que se solicita un esquema de trazado
☐	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
☐	Representación gráfica de un esquema de trazado
☐	Comprobante de pago de las tasas establecidas
Completa ☐	Incompleta ☐

Bogotá D.C.,
2020

Doctor(a)
RODRIGUEZ D' ALEMAN DILIA MARIA
Apoderado(a) y/o Representante de
SYNGENTA LIMITED

REFERENCIA	Radicación No.	11-100679
	Solicitud internacional	PCT/EP2010/050074
	Fecha inicio fase nacional	15/08/2011
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	

13710

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se le comunica que:

1. Con respecto al resumen y de conformidad con lo dispuesto en el artículo 31 D. 486 en el cual se establece que el resumen consiste en una síntesis de la divulgación técnica contenida en la solicitud de patente, debe adecuar el resumen a los dispuesto en dicha norma, teniendo en cuenta que el extracto permitirá precisar el objeto de la invención, sus elementos característicos y el campo de aplicación.

2. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante, conforme a lo establecido por el artículo 26 literal f) de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina. Cuando se trate de documentos otorgados en el extranjero, estos deberán legalizarse de conformidad con lo dispuesto por los artículos 259 y 260 del Código de Procedimiento Civil. Cuando se trate de las declaraciones a que hace referencia la Regla 4.17 ii) del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes PCT., el alcance de las tales declaraciones se determinará según indiquen claramente una cesión de derechos del inventor al solicitante o su causante, de conformidad con lo dispuesto en el numeral 5.2.15 del Capítulo Quinto, Título II de la Circular Única de Superintendencia de Industria y Comercio.

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Continúa en la página siguiente...

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Unica No.10 de 2001.



JOSE LUIS SALAZAR LOPEZ
Director de Nuevas Creaciones (C)

02 SET. 2011

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha _____
adpa11