

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 10 - 19,682
FECHA : MARZO 11 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-122025- -00010-0000

Fecha: 2010-04-05 15:44:20 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 149

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
ALVARO CASTELLANOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	325822405	11/03/2010	2,332,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
		99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	14,000.00
		TOTAL :	\$ 14,000.00

SON: DATORCE MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIBENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

7
7

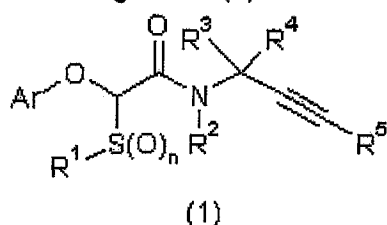
DERIVADOS DE N-ALQUINIL -2 (ARILOXI-SUSTITUIDO) AMIDAS COMO FUNGICIDAS

La presente invención se refiere a nuevas *N*-alquinil-2-alquiltio-2- alquilamidas (ariloxi y heteroariloxi sustituidas) y a sus sulfinil y sulfonil derivados. Además se refiere a procesos para prepararlas, a composiciones que las contienen y a métodos para usarlas para combatir hongos, especialmente infecciones fúngicas de plantas.

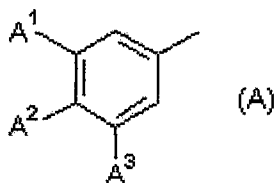
Ciertas *N*-alquinil-2-alquilamidas (fenoxi sustituidas) se describen en la Patente Estadounidense US 4.116.677 como de utilidad como herbicidas. Otras se describen en la Patente Estadounidense US 4.168.319 como de utilidad como agentes contra mohos. Varias *N*-dimetilpropinil- α -metoxi- y α -etoxi- α -acetamidas(fenoxi sustituidas) se describen en la Patente Estadounidense US 4.062.977 para su uso como acaricidas y el compuesto *N*-dimetilpropinil- α -metoxi- α -(3,5-dimetilfenoxi)acetamida se describe en la Patente Estadounidense US 4.083.867 para uso como herbicida.

La presente invención se relaciona con el suministro de *N*-alquinil-2-alquiltio-2- alquilamidas(ariloxi y heteroariloxi sustituidas) y sus sulfinil y sulfonil derivados para uso principalmente como fungicidas de plantas.

De este modo, de acuerdo con la presente invención se provee un compuesto de fórmula general (1):



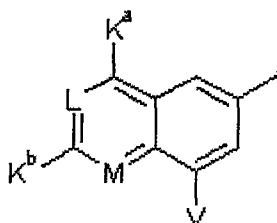
en la cual Ar es un grupo de fórmula (A):



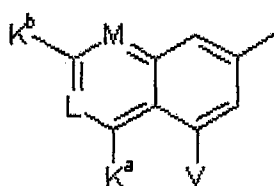
en la cual A¹, A² y A³ son independientemente H, halógeno, alquilo C₁₋₄ (por ejemplo metilo), haloalquilo C₁₋₄ (por ejemplo trifluormetilo), alquenilo C₂₋₄, haloalquenilo C₂₋₄, alquinilo C₂₋₄, haloalquinilo C₂₋₄, alcoxi C₁₋₄ (por ejemplo metoxi), haloalcoxi C₁₋₄ (por ejemplo trifluormetoxi), -S(O)_malquilo C₁₋₄ donde m es 0, 1 o 2 y el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo (particularmente fluor, por ejemplo metiltio, trifluormetilsulfonilo), -OSO₂alquilo C₁₋₄ donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo (particularmente fluor, por ejemplo trifluormetilsulfoniloxi), ciano, nitro, alcoxicarbonilo C₁₋₄, -CONR^mRⁿ, -COR^m, -NR^mCORⁿ,

$-\text{SO}_2\text{NR}^m\text{R}^n$ o $-\text{NR}^m\text{SO}_2\text{R}^1$ donde R^1 es alquilo C_{1-4} y R^m y R^n son independientemente H o alquilo C_{1-4} (por ejemplo $-\text{NHCOCH}_3$); o

Ar es un grupo de fórmula (B1) o (B2):



(B1)



(B2)

en las cuales L y M son independientemente N o CQ.

K^a y K^b son independientemente H o F;

V es H, halo (por ejemplo fluor, cloro, bromo, yodo), alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido con halo o alcoxi C_{1-4} , cicloalquilo C_{3-6} opcionalmente sustituido con halo o alcoxi C_{1-4} , alquenilo C_{2-4} opcionalmente sustituido con halo, alquinilo C_{2-4} opcionalmente sustituido con halo, alcoxi C_{1-6} opcionalmente sustituido con halo o alcoxi C_{1-4} , alqueniloxi C_{2-4} opcionalmente sustituido con halo (por ejemplo aliloxi), alquiniloxi C_{2-4} opcionalmente sustituido con halo (por ejemplo propargiloxi), ciano, nitro, alcóxicarbonilo C_{1-4} , $-\text{OSO}_2\text{R}^1$, $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^1$, $-\text{COR}^1$, $-\text{CONR}^m\text{R}^n$,

$-\text{SO}_2\text{NR}^m\text{R}^n$, $-\text{NR}^m\text{SO}_2\text{R}^1$, $-\text{CR}^1=\text{NR}^m$, $-\text{NR}^m\text{R}^n$, $-\text{NR}^m\text{COR}^1$, $-\text{NR}^m\text{CO}_2\text{R}^1$ donde m es 0, 1 o 2, R^1 es alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido con halógeno y R^m y R^n son independientemente H o C_{1-6} alquilo o, en el caso de $-\text{CONR}^m\text{R}^n$ o

$-\text{SO}_2\text{NR}^m\text{R}^n$, pueden unirse para formar un anillo de 5 o 6 miembros que contienen un solo átomo de nitrógeno, átomos de carbono saturados y opcionalmente un único átomo de oxígeno;

Q es H, halo, alquilo C_{1-8} , cicloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-8} , alquinilo C_{2-8} , alcoxi C_{1-8} , alquiltio C_{1-8} , haloalquilo C_{1-8} , haloalcoxi C_{1-8} , haloalquiltio C_{1-8} , nitro, amino, mono- o di-alquilamino C_{1-6} , mono- o dialquenilamino C_{2-6} , mono- o dialquinilamino C_{2-6} , formilamino, alquil- C_{1-4} (formil)amino, alquilcarbonilamino C_{1-4} , alcóxicarbonilamino C_{1-4} , alquilo C_{1-4} (alquilcarbonilo C_{1-4})amino, ciano, formilo, alquilcarbonilo C_{1-4} , alcóxicarbonilo C_{1-4} , aminocarbonilo, mono- o dialquilaminocarbonilo C_{1-4} , carboxi, alquilcarboniloxi C_{1-4} , arilalquil- C_{1-4} -carboniloxi, alquilsulfinilo C_{1-4} , alquilsulfonilo C_{1-4} o alquilsulfoniloxi C_{1-4} , haloalquilsulfinilo C_{1-4} , haloalquilsulfonilo C_{1-4} , $-\text{SO}_2\text{NR}^m\text{R}^n$, $-\text{NR}^m\text{SO}_2\text{R}^1$, donde R^1 es alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido con halógeno y R^m y R^n son independientemente H o alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido con halógeno o, en el caso de

214
94

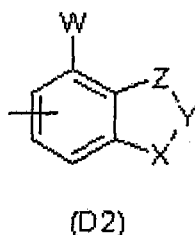
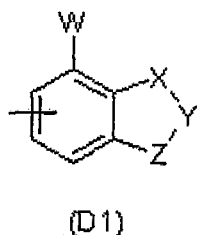
$-\text{SO}_2\text{NR}^m\text{R}^n$, puede unirse para formar un anillo de 5 o 6 miembros que contiene un solo átomo de nitrógeno, átomos de carbono saturados y opcionalmente un único átomo de oxígeno; o

Ar es un grupo de fórmula (C):



en la cual A^4 y A^5 son independientemente H, halo, alquilo C_{1-8} , cicloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-8} , alquinilo C_{2-8} , alcoxi C_{1-8} , alquiltio C_{1-8} , nitro, amino, mono- o di-alquilamino C_{1-6} , mono- o di-alquenilamino C_{2-6} mono- o di-alquinilamino C_{2-6} , formilamino, alquil- C_{1-4} (formil)amino, alquilcarbonilamino C_{1-4} , alquilo C_{1-4} (alquilcarbonilo C_{1-4})amino, ciano, formilo, alquilcarbonilo C_{1-4} , alcoxicarbonilo C_{1-4} , aminocarbonilo, mono- o di-alquilaminocarbonilo- C_{1-4} , carboxi, alquilcarboniloxi C_{1-4} , aril alquilcarboniloxi C_{1-4} , alquilsulfinilo C_{1-4} , C_{1-4} alquilsulfonilo, alquilsulfoniloxi C_{1-4} , arilo, heteroarilo, ariloxi, ariltio, heteroariloxi o heteroariltio donde cualquiera de los grupos o restos anteriores alquilo, cicloalquilo, alquenilo, alquinilo, arilo o heteroarilo están opcionalmente sustituidos; o

Ar es un grupo unido a la posición 5 o 6 de fórmula (D1) o (D2):



en la cual W es H, halo, alquilo C_{1-4} , alcoxi C_{1-4} , alquiltio C_{1-4} , alquilsulfinilo C_{1-4} , alquilsulfonilo C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , haloalquiltio C_{1-4} , haloalquilsulfinilo C_{1-4} , haloalquilsulfonilo C_{1-4} , ciano o nitro,

X es N, NH o N-alquilo C_{1-4} ,

Y es CR, N, NH, N-alquilo C_{1-4} , O o S,

Z es CR, N, NH, N-alquilo C_{1-4} , O o S,

R es H, halo, alquilo C_{1-4} , alcoxi C_{1-4} , alquiltio C_{1-4} , alquilsulfinilo C_{1-4} , alquilsulfonilo C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} o haloalcoxi C_{1-4} , haloalquiltio C_{1-4} , haloalquilsulfinilo C_{1-4} , halo alquilsulfonilo C_{1-4} o mono- o di-alquilamino C_{1-4} ,

14

los enlaces que unen X, Y, Z y el anillo bencénico fusionado son enlaces dobles o simples apropiados a las valencias de X, Y y Z, siempre que sólo uno de Y y Z pueda ser O o S, que sólo uno de Y y Z pueda ser CH o CR y que sólo uno de X, Y y Z pueda ser NH o N-alquilo C₁₋₄;

R¹ es metilo o etilo;

R² es H, alquilo C₁₋₄, alcoximetilo C₁₋₄ o benciloximetilo en el cual el anillo del resto bencilo está opcionalmente sustituido con alcoxi C₁₋₄;

R³ y R⁴ son independientemente H, alquilo C₁₋₃, alqueno C₂₋₃ o alquino C₂₋₃ siempre que ambos no sean H y que cuando ambos son diferentes a H la totalidad combinada de sus átomos de carbono no excede 4, o

R³ y R⁴ se unen con el átomo de carbono al cual están unidos para formar un anillo carbocíclico de 3 o 4 miembros que contiene opcionalmente un átomo de O, S o N y está opcionalmente sustituido con halo o alquilo C₁₋₄;

R⁵ es H, alquilo C₁₋₄ o cicloalquilo C₃₋₆ en el cual el grupo alquilo o cicloalquilo está opcionalmente sustituido con halo, hidroxilo, alcoxi C₁₋₆, ciano, alquilcarbonilo C₁₋₄, aminocarbonilo o mono- o di-alquilaminocarbonilo C₁₋₄,

-S(O)_palquiloC₁₋₆ donde p es 0, 1 o 2, triazolilo (por ejemplo 1,2,4-triazol-1-ilo), pirazolilo, imidazolilo, tri-alquilC₁₋₄sililo, fenoxi opcionalmente sustituido, tienilo opcionalmente sustituido, benciloxi opcionalmente sustituido o tienilmetoxi opcionalmente sustituido, o

R⁵ es fenilo opcionalmente sustituido, tienilo opcionalmente sustituido o bencilo opcionalmente sustituido,

en el cual los anillos o restos fenilo y tienilo opcionalmente sustituidos de los valores de R₅ están opcionalmente sustituidos con uno, dos o tres sustituyentes seleccionados de halo, hidroxilo, mercapto, alquilo C₁₋₄, alqueno C₂₋₄, alquino C₂₋₄, alcoxi C₁₋₄, alquenilo C₂₋₄, alquino C₂₋₄, halo alquiloC₁₋₄, halo alcoxi C₁₋₄, -S(O)_malquilo C₁₋₄ en la cual m es 0, 1 o 2 y el alquilo está opcionalmente sustituido con halo, hidroxialquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄ alquilo C₁₋₄, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquilo C₃₋₆ alquilo C₁₋₄, fenoxi, benciloxi, benzoilo, ciano, isociano, tiocianato, isotiocianato, nitro, -NR^pR^q, -NHCOR^p, -NHCONR^pR^q, -CONR^pR^q, -SO₂NR^pR^q, -NR^pSO₂R^o, -SO₂R^o, -OSO₂R^o, -COR^p, -CR^p=NR^q o -N=CR^pR^q, donde R^o es alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, alquiltio C₁₋₄, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquilo C₃₋₆ alquilo C₁₋₄, fenilo o bencilo, estando los grupos fenilo y bencilo opcionalmente sustituidos con halógeno, alquilo C₁₋₄ o alcoxi C₁₋₄ y R^p y R^q son independientemente hidrógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo

C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, halo alcoxi C₁₋₄, alquiltio C₁₋₄, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquilo C₃₋₆ alquilo C₁₋₄, fenilo o bencilo, estando los grupos fenilo y bencilo opcionalmente sustituidos con halógeno, alquilo C₁₋₄ o alcoxi C₁₋₄; y

n es 0, 1 o 2.

A fin de evitar dudas, el enlace simple no unido que se muestra en los grupos de las fórmulas (A), (B1), (B2), (C), (D1) y (D2) indica el punto de unión del grupo Ar en el compuesto de fórmula (1) al resto de la molécula. En el caso del enlace flotante no unido del grupo de la fórmula (D1) y (D2), el grupo (D1) o (D2) está unido a sus posiciones 5 o 6.

Los compuestos de la invención contienen al menos un átomo de carbono asimétrico (y al menos dos cuando R³ y R⁴ son diferentes) y pueden existir como enantiómeros (o como pares de diastereoisómeros) o como mezclas de los mismos. Además, cuando n es 1, los compuestos de la invención son sulfóxidos, que pueden existir en dos formas enantioméricas, y el carbono adyacente puede existir además en dos formas enantioméricas. Por lo tanto, los compuestos de fórmula general (I) existen como racematos, diastereoisómeros o simples enantiómeros, y la invención incluye todos los isómeros posibles o mezclas de isómeros en todas las proporciones. Se espera que para cualquier compuesto dado, un isómero puede ser más activo que otro desde el punto de vista fungicida.

Salvo que se especifique lo contrario, los grupos alquilo y los restos alquilo de alcoxi, alquiltio, etc., contienen adecuadamente de 1 a 6, típicamente de 1 a 4, átomos de carbono en la forma de cadenas rectas o ramificadas. Ejemplos son metilo, etilo, n- e iso-propilo y n-, sec-, iso- y ter-butilo. Cuando los restos alquilo contienen 5 o 6 átomos de carbono, son ejemplos n-pentilo y n-hexilo. Ejemplos de sustituyentes opcionales adecuados de grupos y restos alquilo incluyen halo, hidroxi, alcoxi C₁₋₄ y alcoxi C₁₋₄-alcoxi C₁₋₄, arilo opcionalmente sustituido y heteroarilo opcionalmente sustituido. Cuando el sustituyente opcional es halo, el grupo o resto haloalquilo es típicamente triclorometilo o trifluormetilo.

Salvo que se especifique lo contrario, los restos alquenilo y alquinilo contienen además de 2 a 6, típicamente de 2 a 4, átomos de carbono en la forma de cadenas rectas o ramificadas. Ejemplos son alilo, etinilo o propargilo. Sustituyentes opcionales incluyen halo.

Halo incluye fluor, cloro, bromo y yodo. Más comúnmente es fluor, cloro o bromo y usualmente fluor o cloro.

Arilo es usualmente fenilo pero además incluye naftilo, antrilo y fenantrilo.

12 ~~817~~
12

Heteroarilo es típicamente un anillo aromático de 5 o 6 miembros que contiene uno o más heteroátomos O, N o S, que pueden estar fusionados a uno o más anillos aromáticos o heteroaromáticos, tal como un anillo bencénico. Ejemplos son grupos tienilo, furilo, pirrolilo, isoxazolilo, oxazolilo, tiazolilo, oxadiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, isotiazolilo, tetrazolilo, tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, triazinilo, benzofurilo, benzo-tienilo, dibenzofurilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, benzoimidazolilo, indolilo, quinolinilo y quinoxalinilo y, siempre que sea apropiado, y sus sales. Cualquiera de los valores arilo o heteroarilo están opcionalmente sustituidos. Salvo que se especifique lo contrario, los sustituyentes que pueden estar presentes incluyen uno o más de los siguientes: halo, hidroxilo, mercapto, alquilo C₁₋₈ (especialmente metilo y etilo), alquenilo C₂₋₆ (especialmente alilo), alquinilo C₂₋₆ (especialmente propargilo), alcoxi C₁₋₈ (especialmente metoxi), alqueniloxi C₂₋₆ (especialmente aliloxi), alquiniloxi C₂₋₆ (especialmente propargiloxi), haloalquilo C₁₋₈ (especialmente trifluormetilo), haloalcoxi C₁₋₈ (especialmente trifluormetoxi), alquiltio C₁₋₈ (especialmente metiltio), hidroxialquilo C₁₋₈, alcoxi C₁₋₄ alquilo C₁₋₄ alcoxi C₁₋₄, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquilo C₃₋₆ alquilo C₁₋₄, arilo opcionalmente sustituido (especialmente fenilo opcionalmente sustituido), heteroarilo opcionalmente sustituido (especialmente piridilo o pirimidinilo opcionalmente sustituido), ariloxi opcionalmente sustituido (especialmente fenoxi opcionalmente sustituido), heteroariloxi opcionalmente sustituido (especialmente piridiloxi o pirimidiniloxi opcionalmente sustituido), ariltio opcionalmente sustituido (especialmente feniltio opcionalmente sustituido), heteroariltio opcionalmente sustituido (especialmente piridiltio o pirimidiniltio opcionalmente sustituido), opcionalmente sustituido arilalquilo C₁₋₄ (especialmente bencilo opcionalmente sustituido, fenetilo opcionalmente sustituido y fenilo *n*-propilo opcionalmente sustituido) en el cual el resto alquilo está opcionalmente sustituido con hidroxilo, heteroarilalquilo C₁₋₄ opcionalmente sustituido (especialmente piridil- o pirimidinil- alquilo C₁₋₄ opcionalmente sustituido), arilalquenilo C₂₋₄ opcionalmente sustituido (especialmente feniletlenilo opcionalmente sustituido), heteroarilalquenilo C₂₋₄ opcionalmente sustituido (especialmente piridiletlenilo o pirimidiniletlenilo opcionalmente sustituido), arilalcoxi C₁₋₄ opcionalmente sustituido (especialmente benciloxi y fenetiloxi opcionalmente sustituido), heteroarilalcoxi C₁₋₄ opcionalmente sustituido (especialmente piridil- o pirimidinil- alcoxi) C₁₋₄ opcionalmente sustituido, ariloxialquilo C₁₋₄ opcionalmente sustituido (especialmente fenoximetilo), heteroariloxialquilo C₁₋₄ opcionalmente sustituido (especialmente piridiloxi o pirimidiniloxi alquilo

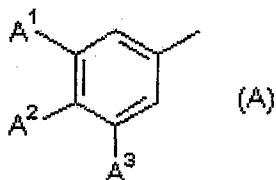
17

B ~~R18~~
B

C₁₋₄ opcionalmente sustituido), aril)alquiltio C₁₋₄ opcionalmente sustituido (especialmente benciltio y feniltio opcionalmente sustituido), heteroarilalquiltio C₁₋₄ opcionalmente sustituido (especialmente piridil o pirimidinil- alquiltio C₁₋₄ opcionalmente sustituido), ariltioalquilo C₁₋₄ opcionalmente sustituido (especialmente feniltiometo), heteroariltioalquilo C₁₋₄ opcionalmente sustituido (especialmente piridiltio- o pirimidiniltioalquilo C₁₋₄ opcionalmente sustituido), aciloxi, incluyendo alcaniloxi C₁₋₄ (especialmente acetiloxi) y benzoiloxi, ciano, isociano, tiocianato, isotiocianato, nitro, NR^sR^t, -NHCOR^s, -NHCONR^sR^t, -CONR^sR^t, -COOR^s, -SO₂R^r, -OSO₂R^r, -COR^s, -CR^s=NR^t o -N=CR^sR^t en el cual R^r es alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, alquiltio C₁₋₄, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquilo C₃₋₆ alquilo C₁₋₄, fenilo o bencilo, estando los grupos fenilo y bencilo opcionalmente sustituidos con halógeno, alquilo C₁₋₄ o alcoxi C₁₋₄ y R^s y R^t son independientemente hidrógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, alquiltio C₁₋₄, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquilo C₃₋₆ alquilo C₁₋₄, fenilo o bencilo, estando los grupos fenilo y bencilo opcionalmente sustituidos con halógeno, alquilo C₁₋₄ o alcoxi C₁₋₄.

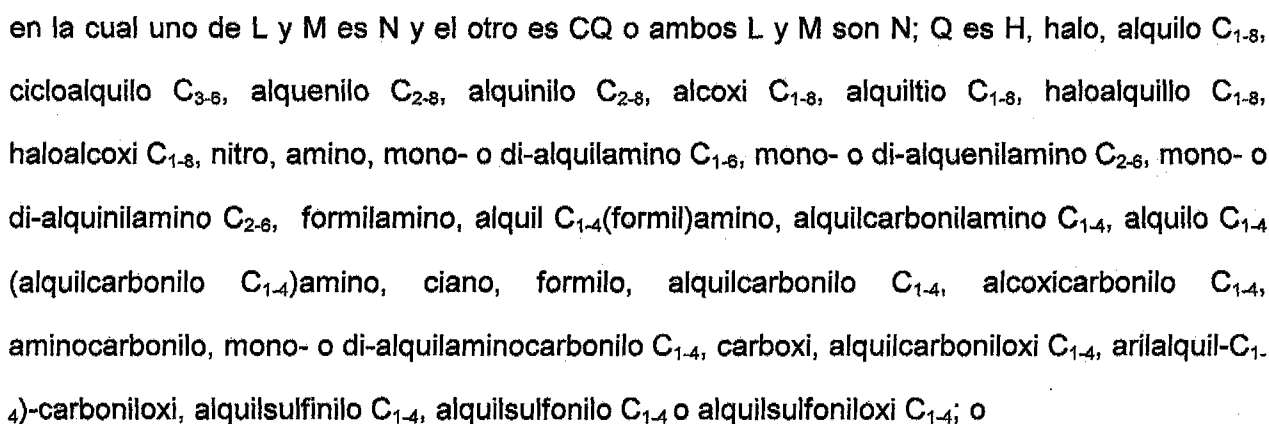
Los sustituyentes que pueden estar presentes en los anillos arilo o heteoarilo de cualquiera de los sustituyentes anteriores incluyen uno o más de los siguientes: halo, hidroxil, mercapto, alquilo C₁₋₄, alqueno C₂₋₄, alquino C₂₋₄, alcoxi C₁₋₄, alquenoiloxi C₂₋₄, alquinoiloxi C₂₋₄, halo alquilo, C₁₋₄ haloalcoxi C₁₋₄, alquiltio C₁₋₄, haloalquiltio C₁₋₄, hidroxialquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄ alquilo C₁₋₄, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquilo C₃₋₆ alquilo C₁₋₄, alcanoiloxi, fenoxi, benciloxi, benzoiloxi, ciano, isociano, tiocianato, isotiocianato, nitro, -NR^sR^t, -NHCOR^s, -NHCONR^sR^t, -CONR^sR^t, -COOR^s, -SO₂R^r, -OSO₂R^r, -COR^s, -CR^s=NR^t o -N=CR^sR^t, en los cuales R^r, R^s y R^t tienen el significado dado anteriormente. Los sustituyentes A¹, A² y A³ en el anillo fenilo del grupo de la fórmula (A) pueden proveer un anillo fenilo sustituido en las posiciones 3-, 3, 5- o 3, 4, 5-.

De particular interés son los compuestos en los cuales Ar es un grupo de fórmula (A):



en la cual A¹, A² y A³ son independientemente H, halógeno, alquilo C₁₋₄ (por ejemplo metilo), haloalquilo C₁₋₄ (por ejemplo trifluorometilo), alqueno C₂₋₄, haloalqueno C₂₋₄, alquino C₂₋₄, haloalquino C₂₋₄, alcoxi C₁₋₄ (por ejemplo metoxi), haloalcoxi C₁₋₄ (por ejemplo trifluorometoxi), -S(O)_malquilo C₁₋₄ en la cual m es 0, 1 o 2 y el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con

Ar es un grupo de fórmula (B):



(C)

en la cual A⁴ y A⁵ son independientemente H, halo, alquilo C₁₋₈, cicloalquilo C₃₋₆, alquenilo C₂₋₈, alquinilo C₂₋₈, alcoxi C₁₋₈, alquiltio C₁₋₈, nitro, amino, mono- o di-alquilamino C₁₋₆, mono- o di-alquenilamino C₂₋₆, mono- o di-alquinilamino C₂₋₆, formilamino, alquil-C₁₋₄(formil)amino, alquilcarbonilamino C₁₋₄, alquilo C₁₋₄ (alquilcarbonilo C₁₋₄) amino, ciano, formilo, alquilcarbonilo C₁₋₄, alcoxycarbonilo C₁₋₄, aminocarbonilo, mono- o di-alquilaminocarbonilo C₁₋₄, carboxi, alquilcarboniloxi C₁₋₄, arilalquil-C₁₋₄carboniloxi, alquilsulfinilo C₁₋₄, alquilsulfonilo C₁₋₄, alquilsulfoniloxi C₁₋₄, arilo, heteroarilo, ariloxi, ariltio, heteroariloxi o heteroariltio en la cual cualquiera de los grupos o restos anteriores alquilo, cicloalquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, heteroarilo están opcionalmente sustituidos; o

(D1)

en la cual W es H, halo, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄ o haloalcoxi C₁₋₄,

224
15. 15

X es N, NH o N-alquilo C₁₋₄,

Y es CH, N, NH, O o S,

Z es CH, N, NH, N-alquilo C₁₋₄, O o S, y

los enlaces que unen X, Y, Z y el anillo bencénico fusionado son enlaces dobles o simples adecuados a las valencias de X, Y y Z, siempre que sólo uno de Y y Z puede ser O o S, que sólo uno de Y y Z puede ser CH y que sólo uno de X, Y y Z puede ser NH o N-alquilo C₁₋₄;

R¹ es metilo o etilo;

R² es H, alquilo C₁₋₄, alcoximetilo C₁₋₄ o benciloximetilo en el cual el anillo fenilo del resto bencilo está opcionalmente sustituido con C₁₋₄ alcoxi;

R³ y R⁴ son independientemente H, alquilo C₁₋₃, alquenilo C₂₋₃ o alquinilo C₂₋₃ siempre que ambos no sean H y que cuando ambos son diferentes a H la totalidad combinada de átomos de carbono no excede de 4, o

R³ y R⁴ se unen con el átomo de carbono al cual están unidos para formar un anillo carbocíclico de 3 o 4 miembros que contiene opcionalmente un átomo de O, S o N y está opcionalmente sustituido con halo o alquilo C₁₋₄;

R⁵ es H, alquilo C₁₋₄ o cicloalquilo C₃₋₆ en los cuales el grupo alquilo o cicloalquilo está opcionalmente sustituido con halo, hidroxilo, alcoxi C₁₋₆, ciano, alquilcarboniloxi C₁₋₄, aminocarboniloxi o mono- o di-alquilaminocarboniloxi C₁₋₄, tri-alquilsililoxi C₁₋₄, fenoxi opcionalmente sustituido, tieniloxi opcionalmente sustituido, benciloxi opcionalmente sustituido o tienilmetoxi opcionalmente sustituido, o

R⁵ es fenilo opcionalmente sustituido, tienilo opcionalmente sustituido o bencilo opcionalmente sustituido,

en donde los anillos fenilo y tienilo opcionalmente sustituidos de los valores de R⁵ están opcionalmente sustituidos con uno, dos o tres sustituyentes seleccionados de halo, hidroxilo, mercapto, alquilo C₁₋₄, alquenilo C₂₋₄, alquinilo C₂₋₄, alcoxi C₁₋₄, alqueniloxi C₂₋₄, alquiniloxi C₂₋₄, haloalquilo C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, alquiltio C₁₋₄, haloalquiltio C₁₋₄, hidroxialquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, alquilo C₁₋₄, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, alquilo C₁₋₄, fenoxi, benciloxi, benzoiloxi, ciano, isociano, tiocianato, isotiocianato, nitro, -NR^pR^q, -NHCOR^p, -NHCONR^pR^q, -CONR^pR^q, -SO₂R^p, -OSO₂R^p, -COR^p, -CR^p=NR^q o -N=CR^pR^q, en los cuales R^p y R^q son independientemente hidrógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, alquiltio

Cuando Ar es un grupo de fórmula (A), típicamente A¹, A² y A³ son todos cloro o metilo, o A¹ y A³ son ambos cloro, bromo o fluor y A² es H o metilo, o A¹ y A³ son ambos metilo o metoxi y A² es H, cloro, bromo o alquiltio, o A¹ es metoxi, A² es H y A³ es ciano u cloro, o A¹ es metilo, A² es H y A³ es etilo, o A¹ es cloro, bromo, trifluormetilo, trifluormetoxi o acetilo y ambos A² y A³ son H, o ambos A¹ y A³ son H y A² es cloro o bromo, o A¹ es metilo, A² es alquiltio y A³ es H.

De especial interés son, cuando Ar es un grupo de fórmula (A), los casos donde A¹, A² y A³ son todos cloro o metilo, o A¹ y A³ son ambos cloro o bromo y A² es H o metilo, o A¹ y A³ son ambos metilo o metoxi y A² es H, cloro, bromo o alquiltio, o A¹ es metoxi, A² es H y A³ es ciano u cloro, o A¹ es metilo, A² es H y A³ es etilo, o A¹ es cloro, bromo o trifluormetilo y ambos A² y A³ son H.

De particular interés cuando Ar es un grupo de fórmula (B1) o (B2) son los compuestos donde M es N y L es CQ (quinolinas) y aquellos compuestos donde L y M son ambos N (quinazolininas). Además son de interés los compuestos donde L es N y M es CQ (isoquinolinas) y los compuestos donde L y M son ambos CQ (naftilos). Q es típicamente H o halo, por ejemplo, bromo.

De especial interés cuando Ar es un grupo de fórmula (B) son los compuestos donde M es N y L es CQ (quinolinas) y los compuestos donde L y M son ambos N (quinazolinas). Además de especial interés son los compuestos donde L es N y M es CQ (isoquinolinas). Q es típicamente H o halo, por ejemplo, bromo.

Cuando Ar es un grupo piridina de fórmula (C) la cadena lateral de la amida del ácido alcanoico en el compuesto de fórmula general (1) puede estar unida al anillo de piridina en la posición 2, 3 o 4. Preferentemente, se une en la posición 3 o 4 y más preferentemente en la posición 3. Típicamente, en el grupo de fórmula (C), A⁴ es H y A⁵ es halo, alquilo C₁₋₄, ciclopropilo, alquenilo C₂₋₄, alquinilo C₂₋₄, alcoxi C₁₋₄, alquiltio C₁₋₄, nitro, amino, mono- o di-alquilamino C₁₋₄, formilamino, alquil-C₁₋₄(formil)amino, alquilcarbonilamino C₁₋₄, alquilo C₁₋₄ (alquilcarbonilo C₁₋₄)amino, ciano, formilo, alquilcarbonilo C₁₋₄, alcoxicarbonilo C₁₋₄, aminocarbonilo, mono- o di-alquilaminocarbonilo C₁₋₄, carboxi, alquilcarboniloxi C₁₋₄, feniloalquil-

carboniloxi C_{1-4} , alquilsulfinilo C_{1-4} , alquilsulfonilo C_{1-4} , alquilsulfoniloxi C_{1-4} , fenilo, heteroarilo, fenoxi, feniltio, heteroariloxi o heteroariltio en la cual cualquiera de los grupos o restos anteriores alquilo, cicloalquilo, alquenilo o alquinilo están opcionalmente sustituidos con halo, hidroxi o alcoxi C_{1-4} y cualquiera de los grupos o restos anteriores fenilo o heteroarilo están opcionalmente sustituidos con halo, alquilo C_{1-4} , alcoxi C_{1-4} , nitro o ciano y heteroarilo es furilo, tienilo, piridilo o pirimidinilo. Un ejemplo de alquilcarbonilamino C_{1-4} es metilcarbonilamino y un ejemplo de alquilsulfoniloxi C_{1-4} sustituido es trifluormetilosulfoniloxi.

De particular interés cuando Ar es un grupo de fórmula (D1) o (D2) son los grupos, enlazados en la posición como se muestra, de la fórmula:



en la cual W es H, halo, alquilo C_{1-4} , alcoxi C_{1-4} , alquiltio C_{1-4} , alquilsulfinilo C_{1-4} , alquilsulfonilo C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , haloalquiltio C_{1-4} , haloalquilsulfinilo C_{1-4} , haloalquilsulfonilo C_{1-4} , ciano o nitro, y

(1) X es N, Y es CR, Z es O, S, NH o N-alquilo C_{1-4} , y R es H, halo, alquilo C_{1-4} , alcoxi C_{1-4} , alquiltio C_{1-4} , alquilsulfinilo C_{1-4} , alquilsulfonilo C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} o haloalcoxi C_{1-4} , haloalquiltio C_{1-4} , haloalquilsulfinilo C_{1-4} , haloalquilsulfonilo C_{1-4} o mono- o di-alquilamino C_{1-4} , siendo el enlace X-Y un enlace doble mientras que el enlace Y-Z y los enlaces que unen X y Z al anillo bencénico son enlaces simples; o

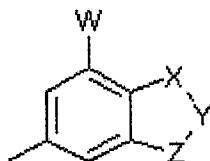
(2) X e Y son N y Z es O, S, NH o N-alquilo C_{1-4} , siendo el enlace X-Y un enlace doble mientras que el enlace Y-Z y los enlaces que unen X y Z al anillo bencénico son enlaces simples;

(3) X es N, Y es O, S, NH o N-alquilo C_{1-4} , Z es CR, y R es H, halo, alquilo C_{1-4} , alcoxi C_{1-4} , alquiltio C_{1-4} , alquilsulfinilo C_{1-4} , alquilsulfonilo C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} o haloalcoxi C_{1-4} , haloalquiltio C_{1-4} , haloalquilsulfinilo C_{1-4} , haloalquilsulfonilo C_{1-4} o mono- o di-alquilamino C_{1-4} , siendo los enlaces X-Y y Y-Z enlaces simples mientras que los enlaces que unen X y Z al anillo bencénico son enlaces dobles; o

(4) X es NH o N-alquilo C_{1-4} , Y es N, Z es CR, y R es H, halo, alquilo C_{1-4} , alcoxi C_{1-4} , alquiltio C_{1-4} , alquilsulfinilo C_{1-4} , alquilsulfonilo C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} o haloalcoxi C_{1-4} , haloalquiltio C_{1-4} , haloalquilsulfinilo C_{1-4} , haloalquilsulfonilo C_{1-4} o mono- o di-alquilamino C_{1-4} , siendo el enlace Y-Z

un enlace doble mientras que el enlace Y-Z y los enlaces que unen X y Z al anillo bencénico son enlaces simples.

De especial interés cuando Ar es un grupo de fórmula (D1) es el grupo unido en la posición que se muestra, de fórmula



en la cual W es H, halo, alquilo C_{1-4} , alcoxi C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} o haloalcoxi C_{1-4} ; y

(1) X es N, Y es CH, Z es O, S, NH o N- C_{1-4} alquilo, siendo el enlace X-Y un enlace doble mientras que el enlace Y-Z y los enlaces que unen X y Z al anillo bencénico son enlaces simples; o

(2) X e Y son N y Z es O, S, NH o N-alquilo C_{1-4} , siendo el enlace X-Y un enlace doble mientras que el enlace Y-Z y los enlaces que unen X y Z al anillo bencénico son enlaces simples; o

(3) X es N, Y es O, S o NH y Z es CH, siendo los enlaces X-Y y Y-Z enlaces simples mientras que los enlaces que unen X y Z al anillo bencénico son enlaces dobles; o

(4) X es NH, N-alquilo C_{1-4} , Y es N, Z es CH, siendo el enlace Y-Z un enlace doble mientras que el enlace Y-Z y los enlaces que unen X y Z al anillo bencénico son enlaces simples.

Ejemplos del grupo de las fórmulas (D1) y (D2) son 5- y 6-benzotiazolilo que porta opcionalmente un sustituyente en 2-C, 5- y 6-(2,1-benzoisotiazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en 3-C, 5- y 6-benzoxazolilo que porta opcionalmente un sustituyente en 2-C, 5- y 6-(2,1-benzisoxazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en 3-C, 5- y 6-(1H-benzoimidazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en 2-C y que porta opcionalmente un sustituyente en N-alquilo C_{1-4} , 5- y 6-(1H-indazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en 3-C y que porta opcionalmente un sustituyente en N-alquilo C_{1-4} , 5- y 6-(2H-indazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en 3-C y que porta opcionalmente un sustituyente en N-alquilo C_{1-4} , 5- y 6-(1,2,3-benzotriazolilo), 5- y 6-(1,2,3-benzoxadiazolilo), 5- y 6-(1H-benzotriazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en N-alquilo C_{1-4} , 5-(2H-benzotriazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en N-alquilo C_{1-4} , 5-(2,1,3-benzotriazolilo) y 5-(2,1,3-benzoxadiazolilo), donde cualquiera de los sustituyentes opcionales anteriores se seleccionan de halo, alquilo C_{1-4} , alcoxi C_{1-4} , alquiltio C_{1-4} , alquilsulfinilo C_{1-4} , alquilsulfonilo C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} o haloalcoxi C_{1-4} , haloalquiltio C_{1-4} , haloalquilsulfinilo C_{1-4} , haloalquilsulfonilo C_{1-4} o mono- o di-alquilamino- C_{1-4} .

De particular interés son los compuestos cuando Ar es un grupo de fórmula (D1) en la cual (D1) se selecciona del grupo integrado por 5- y 6-benzotiazolilo, 5- y 6-(2,1-benzoisotiazolilo), 5- y 6-benzoxazolilo, 5- y 6-(2,1-benzoisoxazolilo), 5- y 6-(1H-benzoimidazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en N-alquilo C₁₋₄, 5- y 6-(1H-indazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en N-alquilo C₁₋₄, 5- y 6-(2H-indazolilo), 5- y 6-(1,2,3-benzotiadiazolilo), 5- y 6-(1,2,3-benzoxadiazolilo), 5- y 6-(1H-benzotriazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en N-alquilo C₁₋₄, 5-(2H-benzotriazolilo), 5-(2,1,3-benzotiadiazolilo) y 5-(2,1,3-benzoxadiazolilo).

De mayor interés cuando Ar es un grupo de fórmula (D1) o (D2) son compuestos en los cuales el grupo de fórmula (D1) o (D2) es 5- o 6-benzotiazolilo que porta opcionalmente un sustituyente en C-2, 5-(2,1-benzoisotiazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en 3-C, 6-benzoxazolilo que porta opcionalmente un sustituyente en C-2, 5-(2,1-benzoisoxazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en 3-C, 6-(1H-benzoimidazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en C-2 y que porta opcionalmente un sustituyente en N-alquilo C₁₋₄, 5-(1H-indazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en 3-C y que porta opcionalmente un sustituyente en N-alquilo C₁₋₄, 6-(1,2,3-benzotiadiazolilo) o 6-(1,2,3-benzoxadiazolilo), donde cualquiera de los sustituyentes opcionales anteriores se seleccionan de halo, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, alquiltio C₁₋₄, alquilsulfinilo C₁₋₄, alquilsulfonilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄ o haloalcoxi C₁₋₄, haloalquiltio C₁₋₄, haloalquilsulfinilo C₁₋₄, haloalquilsulfonilo C₁₋₄ o mono- o di-alquilamino C₁₋₄.

Aún de mayor interés cuando Ar es un grupo de la fórmula (D1) son los compuestos en los cuales (D1) es 5- o 6-benzotiazolilo, 5-(2,1-benzoisotiazolilo), 6-benzoxazolilo, 5-(2,1-benzisoxazolilo), 6-(1H-benzimidazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en N-alquilo C₁₋₄, 5-(1H-indazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en N-alquilo C₁₋₄, 6-(1,2,3-benzotiadiazolilo) o 6-(1,2,3-benzoxadiazolilo).

De especial interés son los compuestos en los cuales el grupo de las fórmulas (D1) o (D2) es 6-benzoxazolilo que porta opcionalmente un sustituyente en C-2 o 6-benzotiazolilo que porta opcionalmente un sustituyente en C-2, particularmente éste último, donde cualquiera de los sustituyentes opcionales anteriores se seleccionan de halo, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, alquiltio C₁₋₄, alquilsulfinilo C₁₋₄, alquilsulfonilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄ o haloalcoxi C₁₋₄, haloalquiltio C₁₋₄, haloalquilsulfinilo C₁₋₄, haloalquilsulfonilo C₁₋₄ o mono- o di-alquilamino C₁₋₄.

275
209

Aún de mayor interés son los compuestos en los cuales el grupo de la fórmula (D1) es 6-benzoxazolilo o 6-benzotiazolilo, particularmente éste último.

R¹ es metilo o etilo.

Típicamente R² es H y al menos uno, pero preferentemente ambos de R³ y R⁴ son metilo. Cuando uno de R³ y R⁴ es H, el otro puede ser metilo, etilo o *n*- o *iso*-propilo. Cuando uno de R³ y R⁴ es metilo, el otro puede ser H o etilo pero además preferentemente es metilo. R² también contiene alcóximetilo C₁₋₄ y bencilóximetilo en el cual el anillo de fenilo del grupo bencilo opcionalmente transporta un sustituyente alcoxi, por ejemplo un sustituyente metoxi. Tales valores de R² proveen compuestos de fórmula (1) que se cree son compuestos pro-pesticidas.

Típicamente R⁵ es H o metilo, preferentemente metilo. Sin embargo, además de particular interés son los compuestos en los cuales R⁵ es hidroximetilo, metoximetilo, 1-metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo, 3-cloro-*n*-propilo, fenilo, *p*-fluor-fenilo, *m*-acetil-fenilo, 2-tienilo, 3-tienilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo, especialmente donde R⁵ es hidroximetilo, metoximetilo, 1-metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo.

En un aspecto la invención provee un compuesto de fórmula general (1) en la cual Ar es como se definió anteriormente; R¹ es metilo o etilo; R² es H; R³ y R⁴ son ambos metilo; R⁵ es H, metilo, hidroximetilo, metoximetilo, 1-metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo, 3-cloro-*n*-propilo, fenilo, *p*-fluor-fenilo, *m*-acetil-fenilo, 2-tienilo, 3-tienilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo, especialmente donde R⁵ es H, metilo, hidroximetilo, metoximetilo, 1-metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo; y *n* es 0, 1 o 2, típicamente 0. Preferentemente R⁵ es metilo o metoximetilo.

En otro aspecto la invención provee un compuesto de fórmula general (1) en la cual Ar es un grupo de fórmula (A) en la cual A¹, A² y A³ son todos cloro o metilo, o A¹ y A³ son ambos cloro, bromo o fluor y A² es H o metilo, o A¹ y A³ son ambos metilo o metoxi y A² es H, cloro, bromo o alquiltio, o A¹ es metoxi, A² es H y A³ es ciano u cloro, o A¹ es metilo, A² es H y A³ es etilo, o A¹ es cloro, bromo, trifluormetilo, trifluormetoxi o acetilo y ambos A² y A³ son H, o ambos A¹ y A³ son H y A² es cloro o bromo, o A¹ es metilo, A² es alquiltio y A³ es H; R¹ es metilo o etilo; R² es H; R³ y R⁴ son ambos metilo; R⁵ es H, metilo, hidroximetilo, metoximetilo, 1-metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo, 3-cloro-*n*-propilo, fenilo, 4-fluor-fenilo, 3-acetil-fenilo, tien-2-ilo, tien-3-ilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo, especialmente donde R⁵ es H, metilo, hidroximetilo, metoximetilo, 1-

25

21 23 878

metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo; y *n* es 0, 1 o 2, típicamente 0. Preferentemente R^5 es metilo o metoximetilo.

Aún en otro aspecto la invención provee un compuesto de fórmula general (1) en la cual Ar es un grupo de fórmula (A) en la cual A^1 , A^2 y A^3 son todos cloro o metilo, o A^1 y A^3 son ambos cloro o bromo, particularmente cloro, y A^2 es H o metilo, o A^1 y A^3 son ambos metilo o metoxi y A^2 es H, cloro, bromo o alquiltio, o A^1 es metoxi, A^2 es H y A^3 es ciano u cloro, o A^1 es metilo, A^2 es H y A^3 es etilo, o A^1 es cloro, bromo o trifluormetilo y ambos A^2 y A^3 son H; R^1 es metilo o etilo; R^2 es H; R^3 y R^4 son ambos metilo; R^5 es H, metilo, hidroximetilo, metoximetilo, 1-metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo, 3-cloro-*n*-propilo, fenilo, 4-fluor-fenilo, 3-acetil-fenilo, tien-2-ilo, tien-3-ilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo, especialmente donde R^5 es H, metilo, hidroximetilo, metoximetilo, 1-metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo; y *n* es 0, 1 o 2, típicamente 0. Preferentemente R^5 es metilo o metoximetilo.

En aún otro aspecto la invención provee un compuesto de fórmula general (1) en la cual Ar es un grupo de fórmula (B1) o (B2) en la cual L y M son independientemente N o CQ; Q es hidrógeno o halo (por ejemplo bromo); R_1 es metilo o etilo; R_2 es H; R_3 y R_4 son ambos metilo; R_5 es H, metilo, hidroximetilo, metoximetilo, 1-metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo, 3-cloro-*n*-propilo, fenilo, 4-fluor-fenilo, 3-acetil-fenilo, tien-2-ilo, tien-3-ilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo, especialmente donde R^5 es H, metilo, hidroximetilo, metoximetilo, 1-metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo; y *n* es 0, 1 o 2, típicamente 0. Preferentemente R_5 es metilo o metoximetilo.

En aún otro aspecto la invención provee un compuesto de fórmula general (1) en la cual Ar es un grupo de fórmula (B) en la cual uno de L y M es N y el otro es CQ, o ambos de L y M son N; Q es hidrógeno o halo (por ejemplo bromo); R_1 es metilo o etilo; R_2 es H; R_3 y R_4 son ambos metilo; R_5 es H, metilo, hidroximetilo, metoximetilo, 1-metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo, 3-cloro-*n*-propilo, fenilo, 4-fluor-fenilo, 3-acetil-fenilo, tien-2-ilo, tien-3-ilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo, especialmente donde R^5 es H, metilo, hidroximetilo, metoximetilo, 1-metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo; y *n* es 0, 1 o 2, típicamente 0. Preferentemente R_5 es metilo o metoximetilo.

En otro aspecto, la invención provee un compuesto de fórmula general (I) en la cual Ar es un grupo de fórmula (C) en la cual A^4 es H; y A^5 es halo, alquilo C_{1-4} , ciclopropilo, alquenilo C_{2-4} , alquinilo C_{2-4} , alcoxi C_{1-4} , alquiltio C_{1-4} , nitro, amino, mono- o di-alquilamino C_{1-4} ,

24-29
229

formilamino, alquil-C₁₋₄(formil)amino, alquilcarbonilamino C₁₋₄, alquilo C₁₋₄ (alquilcarbonilo C₁₋₄)amino, ciano, formilo, alquilcarbonilo C₁₋₄, alcóxicarbonilo C₁₋₄, aminocarbonilo, mono- o di-alquilaminocarbonilo C₁₋₄, carboxi, alquilcarbonilo C₁₋₄, fenilalquilcarbonilo C₁₋₄, alquilsulfonilo C₁₋₄, alquilsulfonilo C₁₋₄, alquilsulfonilo C₁₋₄, fenilo, heteroarilo, fenoxi, feniltio, heteroariloxi o heteroariltio, en la cual cualquiera de los grupos o restos anteriores alquilo, cicloalquilo, alqueno o alquino, que A⁵ puede ser, están opcionalmente sustituidos con halo, hidroxilo o alcóxi C₁₋₄; cualquiera de los grupos o restos anteriores fenilo o heteroarilo, que A⁵ puede ser, están opcionalmente sustituidos con halo, alquilo C₁₋₄, alcóxi C₁₋₄, nitró o ciano; heteroarilo es furilo, tienilo, piridilo o pirimidinilo; R¹ es metilo o etilo; R² es H; R³ y R⁴ son ambos metilo; R₅ es H, metilo, hidroximetilo, metoximetilo, 1-metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo, 3-cloro-*n*-propilo, fenilo, 4-fluor-fenilo, 3-acetil-fenilo, tien-2-ilo, tien-3-ilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo, especialmente donde R⁵ es H, metilo, hidroximetilo, metoximetilo, 1-metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo; y *n* es 0, 1 o 2, típicamente 0. Preferentemente R₅ es metilo o metoximetilo. Otra preferencia es que la cadena lateral de la amida del ácido alcanoico esté unida al anillo de piridina del grupo de fórmula (C) en la posición 3.

Aún en otro aspecto la invención provee un compuesto de fórmula general (1) en la cual Ar es un grupo de fórmula (C) en la cual A⁴ es H, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄ o CN; A⁵ es H, halo, alquilo C₁₋₄ o haloalquilo C₁₋₄; R¹ es metilo o etilo; R² es H; R³ y R⁴ son ambos metilo; R₅ es H, metilo, hidroximetilo, metoximetilo, 1-metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo, 3-cloro-*n*-propilo, fenilo, 4-fluor-fenilo, 3-acetil-fenilo, tien-2-ilo, tien-3-ilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo, especialmente donde R⁵ es H, metilo, hidroximetilo, metoximetilo, 1-metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo, preferentemente metilo o metoximetilo; *n* es 0, 1 o 2, típicamente 0; y la cadena lateral de la amida del ácido alcanoico está unida al anillo de piridina en la posición 3.

Aún en otro aspecto la invención provee un compuesto de fórmula general (1) en la cual Ar es un grupo de fórmula (C) en la cual A⁴ es H, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄ o CN; A⁵ es H, halo, alquilo C₁₋₄ o haloalquilo C₁₋₄; R¹ es metilo o etilo; R² es H; R³ y R⁴ son ambos metilo; R₅ es H, metilo, hidroximetilo, metoximetilo, 1-metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo, 3-cloro-*n*-propilo, fenilo, 4-fluor-fenilo, 3-acetil-fenilo, tien-2-ilo, tien-3-ilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo, especialmente donde R⁵ es H, metilo, hidroximetilo, metoximetilo, 1-metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo, preferentemente metilo o metoximetilo; *n* es 0, 1 o 2,

29

23
25
230

típicamente 0; y la cadena lateral de la amida del ácido alcanoico está unida al anillo de piridina en la posición 4.

Aún en otro aspecto la invención provee un compuesto de fórmula general (1) en la cual Ar es 5- o 6-benzotiazolilo que porta opcionalmente un sustituyente en C-2, 5-(2,1-bencisotiazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en 3-C, 6-benzoxazolilo que porta opcionalmente un sustituyente en C-2, 5-(2,1-bencisoxazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en 3-C, 6-(1*H*-bencimidazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en C-2 y que porta opcionalmente un sustituyente en N-alquilo C₁₋₄, 5-(1*H*-indazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en 3-C y que porta opcionalmente un sustituyente en N-alquilo C₁₋₄, 6-(1,2,3-benzotiadiazolilo) o 6-(1,2,3-benzoxadiazolilo), en la cual cualquiera de los sustituyentes opcionales anteriores se seleccionan de halo, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, alquiltio C₁₋₄, alquilsulfinilo C₁₋₄, alquilsulfonilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄ o haloalcoxi C₁₋₄, haloalquiltio C₁₋₄, haloalquilsulfinilo C₁₋₄, haloalquilsulfonilo C₁₋₄ o mono- o di-alquilamino C₁₋₄; R₁ es metilo o etilo, R₂ es H; R₃ y R₄ son ambos metilo; y R₅ es H, metilo, hidroximetilo, metoximetilo, 1-metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo, 3-cloro-*n*-propilo, fenilo, 4-fluor-fenilo, 3-acetil-fenilo, tien-2-ilo, tien-3-ilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo, especialmente donde R⁵ es H, metilo, hidroximetilo, metoximetilo, 1-metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo. Preferentemente R₅ es metilo o metoximetilo.

Aún en otro aspecto la invención provee un compuesto de fórmula general (1) en la cual Ar es 5- o 6-benzotiazolilo, 5-(2,1-benzoisotiazolilo), 6-benz-oxazolilo, 5-(2,1-benzoisoxazolilo), 6-(1*H*-benzoimidazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en N-C₁₋₄ alquilo, 5-(1*H*-indazolilo) que porta opcionalmente un sustituyente en N-alquilo C₁₋₄, 6-(1,2,3-benzotiadiazolilo) o 6-(1,2,3-benzoxadiazolilo); R₁ es metilo o etilo, R₂ es H; R₃ y R₄ son ambos metilo; y R₅ es H, metilo, hidroximetilo, metoximetilo, 1-metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo, 3-cloro-*n*-propilo, fenilo, 4-fluor-fenilo, 3-acetil-fenilo, tien-2-ilo, tien-3-ilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo, especialmente donde R⁵ es H, metilo, hidroximetilo, metoximetilo, 1-metoxietilo, 3-ciano-*n*-propilo y *ter*-butildimetilsililoximetilo. Preferentemente R₅ es metilo o metoximetilo.

Compuestos que forman parte de la invención se ilustran en las Tablas 1 a 129 a continuación. Los datos de caracterización se presentan en la Tabla 130 después de los Ejemplos.

24
26-231
26

Tabla 1

Los compuestos de la Tabla 1 son de fórmula general (1) en la cual Ar es un grupo de fórmula (A), n es 0, R¹ es metilo, R² es H, R³ y R⁴ son ambos metilo, R⁵ es metilo y A¹, A² y A³ tienen los valores dados en la tabla.

Compuesto No	A ¹	A ²	A ³
1	Cl	Cl	CN
2	Cl	Cl	Cl
3	CH ₃	CH ₃	CH ₃
4	Cl	H	Cl
5	Cl	CH ₃	Cl
6	Br	H	Br
7	Br	CH ₃	Br
8	CH ₃	H	CH ₃
9	CH ₃	Cl	CH ₃
10	CH ₃	Br	CH ₃
11	CH ₃	CH ₃ S	CH ₃
12	CH ₃ O	H	CH ₃ O
13	CH ₃ O	Cl	CH ₃ O
14	CH ₃ O	Br	CH ₃ O
15	CH ₃ O	CH ₃ S	CH ₃ O
16	CH ₃ O	H	CN
17	CH ₃ O	H	Cl
18	CH ₃	H	C ₂ H ₅
19	Cl	H	H
20	Br	H	H
21	CF ₃	H	H
22	H	Cl	H
23	H	Br	H
24	H	F	H
25	H	CN	H

31

27 272
2527

Compuesto No	A ¹	A ²	A ³
26	H	CF ₃ O	H
27	H	CH ₃ S	H
28	H	HC=C-	H
29	H	CH ₂ =CH-	H
30	H	CH ₃ O	H
31	H	COCH ₃	H
32	H	CF ₃	H
33	F	H	H
34	CN	H	H
35	CH ₃	H	H
36	CH ₃ CO	H	H
37	CH ₃ O	H	H
38	CF ₃ O	H	H
39	CH ₃ S	H	H
40	HC=C-	H	H
41	H ₂ C=CH-	H	H
42	F	H	F
43	F	H	Cl
44	F	H	Br
45	F	H	CH ₃ O
46	F	H	CH ₃ CO
47	F	H	CN
48	F	H	CH ₃
49	F	H	CF ₃ O
50	F	H	CF ₃
51	F	H	CH ₃ S
52	F	H	COOCH ₃
53	Cl	H	Br
54	Cl	H	CH ₃ CO
55	Cl	H	CH ₃

20 233
298

Compuesto No	A ¹	A ²	A ³
56	Cl	H	CN
57	Cl	H	CF ₃ O
58	Cl	H	CF ₃
59	Cl	H	CH ₃ S
60	Cl	H	COOCH ₃
61	Cl	H	CON(CH ₃) ₂
62	Cl	H	NHCOOCH ₃
63	Cl	H	OSO ₂ CH ₃
64	Cl	H	HC=C-
65	Cl	H	CH ₂ =CH-
66	Br	H	CH ₃
67	Br	H	CN
68	CN	H	CN
69	CN	H	CH ₃
70	CN	H	CF ₃ O
71	CF ₃ O	H	CF ₃ O
72	CF ₃	H	CF ₃
73	CH ₃	H	CH ₃ O
74	F	F	H
75	F	Cl	H
76	F	Br	H
77	F	CH ₃ O	H
78	F	CN	H
79	F	CH ₃	H
80	Cl	Cl	H
81	Cl	F	H
82	Cl	Br	H
83	Cl	CN	H
84	Cl	CH ₃	H
85	Cl	CH ₃ O	H

~~9034~~
2926

Compuesto No	A ¹	A ²	A ³
86	Cl	CF ₃ O	H
87	Cl	CH ₃ S	H
88	Cl	CH ₃ SO ₂ O	H
89	Cl	CH ₃ CO	H
90	CN	F	H
91	CN	Cl	H
92	CN	CH ₃ O	H
93	CH ₃ O	CH ₃ O	H
94	CH ₃ O	Cl	H
95	CH ₃ O	CN	H
96	CH ₃ CO	Cl	H
97	CF ₃ O	Cl	H
98	CF ₃ O	CN	H
99	CH ₃ S	Cl	H
100	CH ₃ S	F	H
101	CH ₃ S	CH ₃	H
102	CH ₃ SO ₂ O	Cl	H
103	Cl	Cl	F
104	Cl	Cl	Br
105	Cl	Cl	CH ₃ O
106	Cl	Cl	CH ₃ CO
107	Cl	Cl	CH ₃ S
108	Cl	F	Cl
109	Cl	CH ₃ O	Cl
110	Cl	CF ₃ O	Cl
111	Cl	CH ₃ SO	Cl
112	Cl	CH ₃ SO ₂	Cl
113	Cl	OSO ₂ CH ₃	Cl
114	Cl	CH ₃ CO	Cl
115	Cl	CO ₂ CH ₃	Cl

30 035
29
30

Compuesto No	A ¹	A ²	A ³
116	Cl	CON(CH ₃) ₂	Cl
117	Cl	HC=C-	Cl
118	Cl	CH ₂ =CH-	Cl
119	Cl	NHCO ₂ CH ₃	Cl
120	F	F	F
121	F	F	CN
122	F	F	CH ₃
123	F	F	CH ₃ O
124	F	CH ₃ O	F
125	F	CF ₃ O	F
126	F	CH ₃ SO	F
127	F	CH ₃ SO ₂	F
128	F	OSO ₂ CH ₃	F
129	F	CH ₃ CO	F
130	F	CO ₂ CH ₃	F
131	CH ₃ O	CH ₃ O	CH ₃ O
132	CH ₃ O	CH ₃ O	Cl
133	CH ₃ O	CH ₃ O	CH ₃
134	Cl	CN	Cl
135	CH ₃	CH ₃ S	H
136	C ₆ H ₅ O	H	H

Tabla 2

La Tabla 2 consta de 136 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (A), n es 0, R¹ es etilo, R² es hidrógeno, R³ y R⁴ son ambos metilo, R⁵ es metilo y A¹, A² y A³ tienen los valores mencionados en la Tabla 1. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 2 es el mismo que el Compuesto 1 de la Tabla 1 salvo que en el Compuesto 1 de la Tabla 2 R¹ es etilo en lugar de metilo. De manera similar, los compuestos 2 a 136 de la Tabla 2 son los mismos que los compuestos 2 a 136 de la Tabla 1, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 2 R¹ es etilo en lugar de metilo.

35

31 R36
28 31

Tabla 3

La tabla 3 consta de 136 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (A), n es 0, R¹ es metilo, R² es hidrógeno, R³ y R⁴ son ambos metilo, R⁵ es H y A¹, A² y A³ tienen los valores mencionados en la Tabla 1. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 3 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 3 R⁵ es H en lugar de metilo. De manera similar, los compuestos 2 a 136 de la Tabla 3 son los mismos que los compuestos 2 a 136 de la Tabla 1, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 3 R⁵ es H en lugar de metilo.

Tabla 4

La Tabla 4 consta de 136 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (A), n es 0, R¹ es etilo, R² es hidrógeno, R³ y R⁴ son ambos metilo, R⁵ es H y A¹, A² y A³ tienen los valores mencionados en la Tabla 1. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 4 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 2 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 4 R⁵ es H en lugar de metilo. De manera similar, los compuestos 2 a 136 de la Tabla 4 son los mismos que los compuestos 2 a 136 de la Tabla 2, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 4 R⁵ es H en lugar de metilo.

Tabla 5

La Tabla 5 consta de 136 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (A), n es 0, R¹ es metilo, R² es hidrógeno, R³ y R⁴ son ambos metilo, R⁵ es hidroximetilo y A¹, A² y A³ tienen los valores mencionados en la Tabla 1. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 5 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 5 R⁵ es hidroximetilo en lugar de metilo. De manera similar, los compuestos 2 a 136 de la Tabla 5 son los mismos que los compuestos 2 a 136 de la Tabla 1, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 5 R⁵ es hidroximetilo en lugar de metilo.

Tabla 6

La Tabla 6 consta de 136 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (A), n es 0, R¹ es etilo, R² es hidrógeno, R³ y R⁴ son ambos metilo, R⁵ es hidroximetilo y A¹, A² y A³ tienen los valores mencionados en la Tabla 1. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 6 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 2 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 6 R⁵ es hidroximetilo en lugar de metilo. De manera similar, los

32 R3F
29
32

compuestos 2 a 136 de la Tabla 6 son los mismos que los compuestos 2 a 136 de la Tabla 2, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 6 R^5 es hidroximetilo en lugar de metilo.

Tabla 7

La Tabla 7 consta de 136 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (A), n es 0, R^1 es metilo, R^2 es hidrógeno, R^3 y R^4 son ambos metilo, R^5 es metoximetilo y A^1 , A^2 y A^3 tienen los valores mencionados en la Tabla 1. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 7 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 7 R^5 es metoximetilo en lugar de metilo. De manera similar, los compuestos 2 a 136 de la Tabla 7 son los mismos que los compuestos 2 a 136 de la Tabla 1, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 7 R^5 es metoximetilo en lugar de metilo.

Tabla 8

La Tabla 8 consta de 136 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (A), n es 0, R^1 es etilo, R^2 es hidrógeno, R^3 y R^4 son ambos metilo, R^5 es metoximetilo y A^1 , A^2 y A^3 tienen los valores mencionados en la Tabla 1. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 8 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 2 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 8 R^5 es metoximetilo en lugar de metilo. De manera similar, los compuestos 2 a 136 de la Tabla 8 son los mismos que los compuestos 2 a 136 de la Tabla 2, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 8 R^5 es metoximetilo en lugar de metilo.

Tabla 9

La Tabla 9 consta de 136 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (A), n es 0, R^1 es metilo, R^2 es hidrógeno, R^3 y R^4 son ambos metilo, R^5 es *ter*-butildimetilsililoximetilo y A^1 , A^2 y A^3 tienen los valores mencionados en la Tabla 1. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 9 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 9 R^5 es *ter*-butildimetilsililoximetilo en lugar de metilo. De manera similar, los compuestos 2 a 136 de la Tabla 9 son los mismos que los compuestos 2 a 136 de la Tabla 1, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 9 R^5 es *ter*-butildimetilsililoximetilo en lugar de metilo.

30 (238)
43 33

Tabla 10

La Tabla 10 consta de 136 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (A), n es 0, R¹ es etilo, R² es hidrógeno, R³ y R⁴ son ambos metilo, R⁵ es *ter*-butildimetilsililoximetilo y A¹, A² y A³ tienen los valores mencionados en la Tabla 1. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 10 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 2 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 10 R⁵ es *ter*-butildimetilsililoximetilo en lugar de metilo. De manera similar, los compuestos 2 a 136 de la Tabla 10 son los mismos que los compuestos 2 a 136 de la Tabla 2, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 10 R⁵ es *ter*-butildimetilsililoximetilo en lugar de metilo.

Tabla 11

La Tabla 11 consta de 136 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (A), n es 0, R¹ es metilo, R² es hidrógeno, R³ y R⁴ son ambos metilo, R⁵ es 1-metoxietilo y A¹, A² y A³ tienen los valores mencionados en la Tabla 1. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 11 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 11 R⁵ es 1-metoxietilo en lugar de metilo. De manera similar, los compuestos 2 a 136 de la Tabla 11 son los mismos que los compuestos 2 a 136 de la Tabla 1, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 11 R⁵ es 1-metoxietilo en lugar de metilo.

Tabla 12

La Tabla 12 consta de 136 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (A), n es 0, R¹ es etilo, R² es hidrógeno, R³ y R⁴ son ambos metilo, R⁵ es 1-metoxietilo y A¹, A² y A³ tienen los valores mencionados en la Tabla 1. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 12 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 2 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 12 R⁵ es 1-metoxietilo en lugar de metilo. De manera similar, los compuestos 2 a 136 de la Tabla 12 son los mismos que los compuestos 2 a 136 de la Tabla 2, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 12 R⁵ es 1-metoxietilo en lugar de metilo.

Tabla 13

La Tabla 13 consta de 136 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (A), n es 0, R¹ es metilo, R² es hidrógeno, R³ y R⁴ son ambos metilo, R⁵ es 3-cianopropilo y A¹, A² y A³ tienen los valores mencionados en la Tabla 1. De este modo el

38

31 (039)
34
34

compuesto 1 de la Tabla 12 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 2 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 12 R^5 es 1-metoxietilo en lugar de metilo. De manera similar, los compuestos 2 a 136 de la Tabla 12 son los mismos que los compuestos 2 a 136 de la Tabla 2, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 12 R^5 es 1-metoxietilo en lugar de metilo.

Tabla 14

Los compuestos de la Tabla 14 son de fórmula general (1) en la cual Ar es un grupo de fórmula (B1), M es N, L es CH, K^a , K^b y V son H, n es 0, R_1 es metilo, R_2 es H, R_3 y R_4 son ambos metilo y R_5 tiene los valores dados en la tabla.

Compuesto No.	R_5
1	H
2	CH ₃
3	C ₂ H ₅
4	<i>n</i> -C ₃ H ₇
5	<i>i</i> -C ₃ H ₇
6	<i>n</i> -C ₄ H ₉
7	<i>sec</i> -C ₄ H ₉
8	<i>iso</i> -C ₄ H ₉
9	<i>ter</i> -C ₄ H ₉
10	HOCH ₂
11	HOC ₂ H ₄
12	CH ₃ OCH ₂
13	CH ₃ OCH ₂ CH ₂
14	C ₂ H ₅ OCH ₂
15	CH ₃ (CH ₃ O)CH
16	<i>n</i> -C ₃ H ₇ OCH ₂
17	<i>n</i> -C ₃ H ₇ OC ₂ H ₄
18	<i>t</i> -C ₄ H ₉ OCH ₂
19	<i>t</i> -C ₄ H ₉ OC ₂ H ₄
20	NC-C ₂ H ₄

32 ~~35~~ 35

21	NC- <i>n</i> -C ₃ H ₆
22	NC- <i>n</i> -C ₄ H ₈
23	(CH ₃) ₂ C(CN)CH ₂
24	2-ciano-cicloprop-1-ilo
25	4-ciano-ciclohex-1-ilo
26	C ₆ H ₅ OCH ₂
27	C ₆ H ₅ OC ₂ H ₄
28	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ OCH ₂
29	4-F-C ₆ H ₄ OCH ₂
30	4-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
31	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
32	4-Br-C ₆ H ₄ OCH ₂
33	2-F-C ₆ H ₄ OCH ₂
34	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ OCH ₂
35	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
36	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ OCH ₂
37	4-CF ₃ O-C ₆ H ₅ OCH ₂
38	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
39	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
40	2-Br-C ₆ H ₄ OCH ₂
41	2-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
42	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃ OCH ₂
43	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ OCH ₂
44	3-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
45	tien-2-il-OCH ₂
46	tien-3-il-OCH ₂
47	C ₆ H ₅ CH ₂ OCH ₂
48	tien-2-il-CH ₂ OCH ₂
49	tien-3-il-CH ₂ OCH ₂
50	<i>ter</i> -C ₄ H ₉ (CH ₃) ₂ SiOCH ₂
51	<i>ter</i> -C ₄ H ₉ (CH ₃) ₂ SiOC ₂ H ₄

36 33

52	C_6H_5
53	$4-t-C_4H_9-C_6H_4$
54	$4-F-C_6H_4$
55	$4-Cl-C_6H_4$
56	$4-CH_3-C_6H_4$
57	$4-Br-C_6H_4$
58	$3CH_3CO-C_6H_4$
59	$3,4-Cl_2-C_6H_3$
60	$3-CF_3-C_6H_4$
61	$3,5-Cl_2-C_6H_3$
62	$4-CF_3O-C_6H_4$
63	$2-CF_3-C_6H_4$
64	$4-CF_3-C_6H_4$
65	$2-Br-C_6H_4$
66	$2-Cl-C_6H_4$
67	$2-CH_3-4-Cl-C_6H_3$
68	$2-CH_3-5-F-C_6H_3$
69	$3-Cl-C_6H_4$
70	tien-2-il
71	tien-3-il
72	$C_6H_5CH_2$
73	$4-t-C_4H_9-C_6H_4CH_2$
74	$4-F-C_6H_4CH_2$
75	$4-Cl-C_6H_4CH_2$
76	$4-CH_3-C_6H_4CH_2$
77	$4-Br-C_6H_4CH_2$
78	$2-F-C_6H_4CH_2$
79	$3,4-Cl_2-C_6H_3CH_2$
80	$3-CF_3-C_6H_4CH_2$
81	$3,5-Cl_2-C_6H_3CH_2$
82	$4-CF_3O-C_6H_5CH_2$

34 ~~R4D~~
27
37

83	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
84	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
85	2-Br-C ₆ H ₄ CH ₂
86	2-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
87	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃ CH ₂
88	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ CH ₂
89	3-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
90	Cl- <i>n</i> -C ₃ H ₆

Tabla 15

La Tabla 15 consta de 90 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (B1), M es N, L es CH, K^a, K^b y V son H, n es 0, R₁ es etilo, R₂ es hidrógeno, R₃ y R₄ son ambos metilo y R₅ tiene los valores mencionados en la Tabla 14. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 15 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 14 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 15 R₁ es etilo en lugar de metilo. De manera similar, los compuestos 2 a 90 de la Tabla 15 son los mismos que los compuestos 2 a 90 de la Tabla 14, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 15 R₁ es etilo en lugar de metilo.

Tabla 16

La Tabla 16 consta de 90 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (B1), L y M son ambos N, K^a, K^b y V son H, n es 0, R₁ es metilo, R₂ es hidrógeno, R₃ y R₄ son ambos metilo y R₅ tiene los valores mencionados en la Tabla 14. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 16 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 14 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 16 L es N en lugar de CH. De manera similar, los compuestos 2 a 90 de la Tabla 16 son los mismos que los compuestos 2 a 90 de la Tabla 14, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 16 L es N en lugar de CH.

Tabla 17

La Tabla 17 consta de 90 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (B1), L y M son ambos N, K^a, K^b y V son H, n es 0, R₁ es etilo, R₂ es hidrógeno, R₃ y R₄ son ambos metilo y R₅ tiene los valores mencionados en la Tabla 14. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 17 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 15 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 17 L es N en lugar de CH. De manera similar, los compuestos 2 a 90

30 35 30

de la Tabla 17 son los mismos que los compuestos 2 a 90 de la Tabla 15, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 17 L es N en lugar de CH.

Tabla 18

La Tabla 18 consta de 90 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (B1), M es CH, L es N, K^a , K^b y V son H, n es 0, R_1 es metilo, R_2 es hidrógeno, R_3 y R_4 son ambos metilo y R_5 tiene los valores mencionados en la Tabla 14. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 18 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 14 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 18 L es N en lugar de CH y M es CH en lugar de N. De manera similar, los compuestos 2 a 90 de la Tabla 18 son los mismos que los compuestos 2 a 90 de la Tabla 14, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 18 L es N en lugar de CH y M es CH en lugar de N.

Tabla 19

La Tabla 19 consta de 90 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (B1), M es CH, L es N, K^a , K^b y V son H, n es 0, R_1 es etilo, R_2 es hidrógeno, R_3 y R_4 son ambos metilo y R_5 tiene los valores mencionados en la Tabla 14. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 19 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 15 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 19 L es N en lugar de CH y M es CH en lugar de N. De manera similar, los compuestos 2 a 90 de la Tabla 19 son los mismos que los compuestos 2 a 90 de la Tabla 15, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 19 L es N en lugar de CH y M es CH en lugar de N.

Tabla 20

La Tabla 20 consta de 90 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (B1), M es N, L es C-Br, K^a , K^b y V son H, n es 0, R_1 es metilo, R_2 es hidrógeno, R_3 y R_4 son ambos metilo y R_5 tiene los valores mencionados en la Tabla 14. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 20 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 14 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 20 L es C-Br en lugar de CH. De manera similar, los compuestos 2 a 90 de la Tabla 20 son los mismos que los compuestos 2 a 90 de la Tabla 14, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 20 L es C-Br en lugar de CH.

Tabla 21

La Tabla 21 consta de 90 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (B1), M es N, L es C-Br, K^a , K^b y V son H, n es 0, R_1 es etilo, R_2 es hidrógeno, R_3 y

34
36
38

R_4 son ambos metilo y R_5 tiene los valores mencionados en la Tabla 14. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 21 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 15 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 21 L es C-Br en lugar de CH. De manera similar, los compuestos 2 a 90 de la Tabla 21 son los mismos que los compuestos 2 a 90 de la Tabla 15, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 21 L es C-Br en lugar de CH.

Tabla 22

La Tabla 22 consta de 90 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (B1), M es N, L es C-F, K^a , K^b y V son H, n es 0, R_1 es metilo, R_2 es hidrógeno, R_3 y R_4 son ambos metilo y R_5 tiene los valores mencionados en la Tabla 14. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 22 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 14 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 22 L es C-F en lugar de CH. De manera similar, los compuestos 2 a 90 de la Tabla 22 son los mismos que los compuestos 2 a 90 de la Tabla 14, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 22 L es C-F en lugar de CH.

Tabla 23

La Tabla 23 consta de 90 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (B1), M es N, L es C-Cl, K^a , K^b y V son H, n es 0, R_1 es metilo, R_2 es hidrógeno, R_3 y R_4 son ambos metilo y R_5 tiene los valores mencionados en la Tabla 14. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 23 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 14 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 23 L es C-Cl en lugar de CH. De manera similar, los compuestos 2 a 90 de la Tabla 23 son los mismos que los compuestos 2 a 90 de la Tabla 14, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 23 L es C-Cl en lugar de CH.

Tabla 24

La Tabla 24 consta de 90 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (B1), M es N, L es CH, K^a y K^b son H, V es Br, n es 0, R_1 es metilo, R_2 es hidrógeno, R_3 y R_4 son ambos metilo y R_5 tiene los valores mencionados en la Tabla 14. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 24 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 14 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 24 V es Br en lugar de H. De manera similar, los compuestos 2 a 90 de la Tabla 24 son los mismos que los compuestos 2 a 90 de la Tabla 14, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 23 V es Br en lugar de H.

40
37 40

Tabla 25

La Tabla 25 consta de 90 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (B1), M es N, L es C-Br, K^a y K^b son H, V es Cl, n es 0, R_1 es metilo, R_2 es hidrógeno, R_3 y R_4 son ambos metilo y R_5 tiene los valores mencionados en la Tabla 14. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 25 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 21 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 25 V es Cl en lugar de H. De manera similar, los compuestos 2 a 90 de la Tabla 25 son los mismos que los compuestos 2 a 90 de la Tabla 21, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 25 V es Cl en lugar de H.

Tabla 26

La Tabla 26 consta de 90 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (B1), M es N, L es C-Br, K^a y K^b son H, V es Br, n es 0, R_1 es metilo, R_2 es hidrógeno, R_3 y R_4 son ambos metilo y R_5 tiene los valores mencionados en la Tabla 14. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 26 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 21 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 26 V es Br en lugar de H. De manera similar, los compuestos 2 a 90 de la Tabla 26 son los mismos que los compuestos 2 a 90 de la Tabla 21, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 26 V es Br en lugar de H.

Tabla 27

La Tabla 27 consta de 90 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (B2), M es N, L es CH, K^a , K^b y V son H, n es 0, R_1 es metilo, R_2 es hidrógeno, R_3 y R_4 son ambos metilo y R_5 tiene los valores mencionados en la Tabla 14. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 27 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 14 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 27 Ar es (B2) en lugar de (B1). De manera similar, los compuestos 2 a 90 de la Tabla 27 son los mismos que los compuestos 2 a 90 de la Tabla 14, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 27 Ar es (B2) en lugar de (B1).

Tabla 28

La Tabla 28 consta de 90 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (B1), M es CH, L es C-Br, K^a , K^b y V son H, n es 0, R_1 es metilo, R_2 es hidrógeno, R_3 y R_4 son ambos metilo y R_5 tiene los valores mencionados en la Tabla 14. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 28 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 20 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 28 M es CH en lugar de N. De manera similar, los compuestos 2 a 90

45

3841046
#

de la Tabla 28 son los mismos que los compuestos 2 a 90 de la Tabla 20, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 28 M es CH en lugar de N.

Tabla 29

La Tabla 29 consta de 90 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (B1), M es N, L es C-Cl, K^a, K^b y V son H, n es 0, R₁ es metilo, R₂ es etoximetilo, R₃ y R₄ son ambos metilo y R₅ tiene los valores mencionados en la Tabla 14. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 29 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 23 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 29 R₂ es etoximetilo en lugar de H. De manera similar, los compuestos 2 a 90 de la Tabla 29 son los mismos que los compuestos 2 a 90 de la Tabla 23, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 29 R₂ es etoximetilo en lugar de H.

Tabla 30

La Tabla 30 consta de 90 compuestos de fórmula general (1), en la cual Ar es un grupo de fórmula (B1), M es N, L es C-F, K^a, K^b y V son H, n es 0, R₁ es metilo, R₂ es benciloximetilo, R₃ y R₄ son ambos metilo y R₅ tiene los valores mencionados en la Tabla 14. De este modo el compuesto 1 de la Tabla 30 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 22 salvo que en el compuesto 1 de la Tabla 30 R₂ es benciloximetilo en lugar de H. De manera similar, los compuestos 2 a 90 de la Tabla 30 son los mismos que los compuestos 2 a 90 de la Tabla 22, respectivamente, salvo que en los compuestos de la Tabla 30 R₂ es benciloximetilo en lugar de H.

Tabla 31

Los compuestos de la Tabla 31 son de fórmula general (1) en la cual Ar es un grupo de fórmula (C), n es 0 y los valores de A⁴, A⁵, R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ se presentan en la Tabla. La cadena lateral de la amida del ácido alcanoico está unida a la posición 3 del anillo de piridina en el grupo de fórmula (C) (denominadas 3-piridinas).

39
42

Co. No	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
1	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
2	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
3	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
4	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
5	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
6	H	5-Cl	C ₂ H ₅	CH ₂ OC ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃
7	H	5-Cl	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H
8	H	5-Cl	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
9	6-CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
10	6-CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
11	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
12	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
13	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
14	H	5-CON(<i>i</i> -C ₃ H ₇) ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
15	H	5-CON(<i>i</i> -C ₃ H ₇) ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
16	H	5-CO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
17	H	5-CO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
18	H	5-CO ₂ H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
19	H	5-CO ₂ H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
20	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
21	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	ciclopropilo
22	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	ciclopropilo
23	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CF ₃
24	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CF ₃
25	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
26	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
27	H	5-Cl	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
28	H	5-Cl	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
29	H	5-Cl	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
30	H	5-Cl	CH ₃	CH ₂ OC ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H
31	H	5-Cl	CH ₃	CH ₂ OC ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃

40 43 48

Co. No	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
32	H	5-Cl	CH ₃₀	CH ₂ OC ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
33	H	5-Cl	C ₂ H ₅	CH ₂ OC ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H
34	H	5-Cl	C ₂ H ₅	CH ₂ OC ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
35	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H
36	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃
37	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H
38	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃
39	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	C ₂ H ₅
40	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	C ₂ H ₅
41	6-CH ₃	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
42	6-CH ₃	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
43	6-CH ₃	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
44	6-CH ₃	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
45	6-CH ₃	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
46	6-CH ₃	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
47	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇
48	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇
49	H	5-Br	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇
50	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇
51	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H
52	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
53	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H
54	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
55	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
56	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
57	6-Cl	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ OSi(CH ₃) ₂ (<i>t</i> -C ₄ H ₉)
58	6-Cl	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ OSi(CH ₃)

41 44 49

Co. No	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
							) ₂ (t-C ₄ H ₉)
59	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅	ciclopropilo
60	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅	ciclopropilo
61	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OSi(CH ₃) ₂ (t-C ₄ H ₉)
62	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OSi(CH ₃) ₂ (t-C ₄ H ₉)
63	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
64	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
65	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ OCH ₃
66	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ OCH ₃
67	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CF ₃	H
68	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CF ₃	CH ₃
69	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CF ₃	H
70	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CF ₃	CH ₃
71	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CF ₃	C ₂ H ₅
72	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CF ₃	C ₂ H ₅
73	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂		H
74	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂		CH ₃
75	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH ₂		H
76	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH ₂		CH ₃
77	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂		C ₂ H ₅
78	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH ₂		C ₂ H ₅
79	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂		ciclopropilo
80	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH ₂		ciclopropilo
81	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂		CH ₂ CF ₃
82	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH ₂		CH ₂ CF ₃
83	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂		CH ₂ OCH ₃
84	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂		ciclopropilo
85	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH ₂		ciclopropilo

49

42 ~~45~~
450
45

Co. No	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
86	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂		CH ₂ CF ₃
87	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH ₂		CH ₂ CF ₃
88	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂		CH ₂ OCH ₃
89	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH ₂		CH ₂ OCH ₃
90	H	5-Br	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
91	H	5-Br	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
92	H	5-Br	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
93	6-Cl	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
94	6-Cl	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
95	6-Cl	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
96	6-Cl	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
97	6-Cl	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
98	6-Cl	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
99	6-Cl	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
100	6-Cl	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃

43 46
46

Co. No.	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
101	4-SCH ₃	5-OC ₆ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
102	4-SCH ₃	5-OC ₆ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
103	4-SCH ₃	5-OC ₆ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
104	4-SCH ₃	5-OC ₆ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
105	4-SCH ₃	5-OC ₆ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
106	4-SCH ₃	5-OC ₆ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
107	H	5-CON(<i>i</i> -C ₃ H ₇) ₂	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
108	H	5-CON(<i>i</i> -C ₃ H ₇) ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
109	H	5-CON(<i>i</i> -C ₃ H ₇) ₂	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
110	H	5-CON(<i>i</i> -C ₃ H ₇) ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
111	H	5-CON(<i>i</i> -C ₃ H ₇) ₂	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
112	H	5-CO ₂ -CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
113	H	5-CO ₂ -CH ₂ C ₆ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
114	H	5-CO ₂ -	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃

44 ⁴⁷
457

Co. No.	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
		CH ₂ C ₆ H ₅					
115	H	5-CO ₂ - CH ₂ C ₆ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
116	H	5-CO ₂ - CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
117	H	5-CO ₂ - CH ₂ C ₆ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
118	H	5-CON(<i>i</i> - C ₃ H ₇) ₂	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H
119	H	5-CON(<i>i</i> - C ₃ H ₇) ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H
120	H	5-CON(<i>i</i> - C ₃ H ₇) ₂	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
121	H	5-CON(<i>i</i> - C ₃ H ₇) ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
122	H	5-CON(<i>i</i> - C ₃ H ₇) ₂	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
123	H	5-CON(<i>i</i> - C ₃ H ₇) ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
124	H	5-COCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
125	H	5-COCH ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
126	H	5-COCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃

Ω

45 ~~48~~
48

Co. No.	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
127	H	5-COCH ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
128	H	5-COCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
129	H	5-COCH ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
130	H	5-CN	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
131	H	5-CN	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
132	H	5-CN	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
133	H	5-CN	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
134	H	5-CN	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
135	H	5-CN	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
136	H	5-C≡CH	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
137	H	5-C≡CH	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
138	H	5-C≡CH	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
139	H	5-C≡CH	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
140	H	5-CH=CH ₂	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
141	H	5-CH=CH ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H

46254
46

Co. No.	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
142	H	5-CH=CH ₂	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
143	H	5-CH=CH ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
144	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OC ₂ H ₅
145	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OC ₂ H ₅
146	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH(OCH ₃)CH ₃
147	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH(OCH ₃)CH ₃
148	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₆ -CN
149	H	5-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₆ -Cl
150	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>i</i> -C ₃ H ₇
151	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₄ H ₉
152	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>sec</i> -C ₄ H ₉
153	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>iso</i> -C ₄ H ₉
154	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>ter</i> -C ₄ H ₉
155	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	HOCH ₂
156	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	HOC ₂ H ₄
157	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃ OCH ₂
158	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃ OCH ₂ CH ₂
159	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅ OCH ₂
160	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃ (CH ₃ O)CH

47 R55
50

Co. No.	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
161	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇ OCH ₂
162	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇ OC ₂ H ₄
163	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>t</i> -C ₄ H ₉ OCH ₂
164	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>t</i> -C ₄ H ₉ OC ₂ H ₄
165	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	NC-C ₂ H ₄
166	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	NC- <i>n</i> -C ₃ H ₆
167	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	NC- <i>n</i> -C ₄ H ₈
168	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	(CH ₃) ₂ C(CN)CH ₂
169	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-ciano-cicloprop-1-il
170	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-ciano-ciclohex-1-il
171	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ OCH ₂
172	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ OC ₂ H ₄
173	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ OCH ₂
174	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄ OCH ₂
175	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
176	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
177	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄ OCH ₂
178	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-F-C ₆ H ₄ OCH ₂
179	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ OCH ₂
180	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂

48 256
5/51

Co. No.	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
181	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ OCH ₂
182	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ O-C ₆ H ₅ OCH ₂
183	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
184	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
185	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄ OCH ₂
186	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
187	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl- C ₆ H ₃ OCH ₂
188	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ OCH ₂
189	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
190	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	tien-2-il-OCH ₂
191	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	tien-3-il-OCH ₂
192	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ CH ₂ OCH ₂
193	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	tien-2-il-CH ₂ OCH ₂
194	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	tien-3-il-CH ₂ OCH ₂
195	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	ter- C ₄ H ₉ (CH ₃) ₂ SiOCH ₂
196	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	ter- C ₄ H ₉ (CH ₃) ₂ SiOC ₂ H ₄
197	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅
198	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄

49 R57
82

Co. No.	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
199	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄
200	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄
201	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
202	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄
203	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3CH ₃ CO-C ₆ H ₄
204	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
205	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄
206	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
207	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ O-C ₆ H ₄
208	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄
209	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
210	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄
211	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄
212	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃
213	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃
214	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄
215	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	ten-2-il
216	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	ten-3-il
217	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ CH ₂
218	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-t-C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ CH ₂

57

50 258 38 53

Co. No.	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
219	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄ CH ₂
220	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
221	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
222	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄ CH ₂
223	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-F-C ₆ H ₄ CH ₂
224	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ CH ₂
225	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
226	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ CH ₂
227	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ O-C ₆ H ₅ CH ₂
228	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
229	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
230	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄ CH ₂
231	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
232	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃ CH ₂
233	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ CH ₂
234	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
235	H	5-Br	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	Cl- <i>n</i> -C ₃ H ₆
236	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>i</i> -C ₃ H ₇
237	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₄ H ₉
238	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>sec</i> -C ₄ H ₉
239	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>iso</i> -C ₄ H ₉
240	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>ter</i> -C ₄ H ₉

51 89
R59
54

Co. No.	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
241	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	HOCH ₂
242	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	HOC ₂ H ₄
243	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃ OCH ₂ CH ₂
244	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇ OCH ₂
245	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇ OC ₂ H ₄
246	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>t</i> -C ₄ H ₉ OCH ₂
247	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>t</i> -C ₄ H ₉ OC ₂ H ₄
248	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	NC-C ₂ H ₄
249	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	NC- <i>n</i> -C ₃ H ₆
250	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	NC- <i>n</i> -C ₄ H ₈
251	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	(CH ₃) ₂ C(CN)CH ₂
252	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-ciano-cicloprop-1- ilo
253	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-ciano-ciclohex-1-ilo
254	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ OCH ₂
255	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ OC ₂ H ₄
256	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ OCH ₂
257	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄ OCH ₂
258	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
259	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
260	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄ OCH ₂
261	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-F-C ₆ H ₄ OCH ₂

52 160 55

Co. No.	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
262	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ OCH ₂
263	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
264	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ OCH ₂
265	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ O-C ₆ H ₅ OCH ₂
266	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
267	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
268	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄ OCH ₂
269	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
270	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl- C ₆ H ₃ OCH ₂
271	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ OCH ₂
272	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
273	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	tien-2-il-OCH ₂
274	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	tien-3-il-OCH ₂
275	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ CH ₂ OCH ₂
276	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	tien-2-il-CH ₂ OCH ₂
277	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	tien-3-il-CH ₂ OCH ₂
278	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	ter- C ₄ H ₉ (CH ₃) ₂ SiOC ₂ H ₄
279	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅
280	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄
281	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄
282	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄

53 56
56

Co. No.	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
283	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
284	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄
285	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3CH ₃ CO-C ₆ H ₄
286	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
287	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄
288	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
289	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ O-C ₆ H ₄
290	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄
291	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
292	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄
293	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄
294	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃
295	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃
296	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄
297	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	ten-2-il
298	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	ten-3-il
299	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ CH ₂
300	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-t-C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ CH ₂
301	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄ CH ₂
302	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
303	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
304	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄ CH ₂

54
57

Co. No.	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
305	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-F-C ₆ H ₄ CH ₂
306	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ CH ₂
307	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
308	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ CH ₂
309	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ O-C ₆ H ₅ CH ₂
310	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
311	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
312	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄ CH ₂
313	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
314	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃ CH ₂
315	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ CH ₂
316	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
317	H	5-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	Cl- <i>n</i> -C ₃ H ₆

Tabla 32

Los compuestos de la Tabla 32 son de fórmula general (1) en la cual Ar es un grupo de la fórmula (C), n es 0 y los valores de A⁴, A⁵, R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ se presentan en la tabla. La cadena lateral de la amida del ácido alcanoico está unida a la posición 4 del anillo de piridina en el grupo de fórmula (C) (denominadas 4-piridinas).

58
55 R67
58

Compuesto No.	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
1	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
2	H	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
3	H	H	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
4	H	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
5	H	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
6	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
7	H	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
8	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
9	H	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
10	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
11	6-Cl	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
12	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃
13	6-Cl	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H
14	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H
15	6-Cl	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
16	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
17	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇
18	H	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇
19	H	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
20	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₆ -CN
21	H	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₆ -Cl
22	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CF ₃
23	H	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	ciclopropilo
24	6-Cl	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃

56-114
59

Compuesto No.	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
25	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₆ -CN
26	6-Cl	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₆ -Cl
27	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CF ₃
28	6-Cl	2-Cl	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	ciclopropilo
29	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇
30	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>i</i> -C ₃ H ₇
31	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₄ H ₉
32	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>sec</i> -C ₄ H ₉
33	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>iso</i> -C ₄ H ₉
34	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>ter</i> -C ₄ H ₉
35	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	HOCH ₂
36	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	HOC ₂ H ₄
37	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃ OCH ₂
38	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃ OCH ₂ CH ₂
39	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅ OCH ₂
40	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃ (CH ₃ O)CH
41	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇ OCH ₂
42	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₃ H ₇ OC ₂ H ₄
43	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>t</i> -C ₄ H ₉ OCH ₂
44	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>t</i> -C ₄ H ₉ OC ₂ H ₄
45	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	NC-C ₂ H ₄
46	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	NC- <i>n</i> -C ₄ H ₈
47	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	(CH ₃) ₂ C(CN)CH ₂
48	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-ciano-cicloprop-1-ilo

26560
5760

Compuesto No.	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
49	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-ciano-ciclohex-1-il
50	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ OCH ₂
51	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ OC ₂ H ₄
52	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ OCH ₂
53	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄ OCH ₂
54	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
55	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
56	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄ OCH ₂
57	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-F-C ₆ H ₄ OCH ₂
58	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ OCH ₂
59	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
60	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ OCH ₂
61	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ O-C ₆ H ₅ OCH ₂
62	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
63	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
64	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄ OCH ₂
65	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
66	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl- C ₆ H ₃ OCH ₂
67	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ OCH ₂
68	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
69	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	tien-2-il-OCH ₂
70	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	tien-3-il-OCH ₂
71	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅ CH ₂ OCH ₂
72	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	tien-2-il-CH ₂ OCH ₂

65

58 R66
AT 6T

Compuesto No.	A ⁴	A ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
73	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	ten-3-il-CH ₂ OCH ₂
74	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	ter- C ₄ H ₉ (CH ₃) ₂ SiOCH ₂
75	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	ter- C ₄ H ₉ (CH ₃) ₂ SiOC ₂ H ₄
76	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅
77	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4- <i>t</i> -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄
78	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄
79	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄
80	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
81	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄
82	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3CH ₃ CO-C ₆ H ₄
83	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
84	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄
85	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
86	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ O-C ₆ H ₄
87	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄
88	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
89	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄
90	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄
91	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃
92	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃
93	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄
94	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	ten-2-ilo
95	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	ten-3-ilo

99	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
100	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
101	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄ CH ₂
102	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-F-C ₆ H ₄ CH ₂
103	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ CH ₂
104	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
105	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ CH ₂
106	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ O-C ₆ H ₅ CH ₂
107	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
108	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂
109	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄ CH ₂
110	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
111	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃ CH ₂
112	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ CH ₂
113	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂
114	H	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	Cl- <i>n</i> -C ₃ H ₆
115	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>i</i> -C ₃ H ₇
116	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>n</i> -C ₄ H ₉
117	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>sec</i> -C ₄ H ₉
118	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>iso</i> -C ₄ H ₉
119	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	<i>ter</i> -C ₄ H ₉
120	6-Cl	2-Cl	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	HOCH ₂