



Organizacion y
Digitalizacion CSA Ltda

QP



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

PCT

DELEGATURA PROPIEDAD INDUSTRIAL

División de Nuevas Creaciones

DELEGATURA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
INVENTARIO

01-42237

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION PCT

21. EXPEDIENTE No. _____

54. TÍTULO DERIVADO DE HALOALQUILSULFONANI-
LIDA O SAL DEL MISMO, HERBICIDA QUE COMPREN-
DE EL DERIVADO COMO INGREDIENTE ACTIVO Y
USO DEL HERBICIDA.

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL _____

71. SOLICITANTE NIHON NOHYAKU CO., LTD.

DOMICILIO TOKIO, JAPON

74. APODERADO GERMAN CUBILLOS MENDOZA

22. BOGOTÁ, D. C., _____



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-042237- -00000-0000

Fecha: 2009-04-27 15:23:30 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 148

FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTES

PCT

ENTRADA EN FASE NACIONAL

SOLICITUD DE:

1

☒ Patente de Invención☐ Patente de Modelo de Utilidad☒ Capítulo I☐ Capítulo II

2

SOLICITANTE

Nombre: **NIHON NOHYAKU CO., LTD.**
Dirección: **2-5, Nihonbashi 1-chome, Chuo-ku,**
Tokio, Japón
Nacionalidad o Domicilio: **Tokio, Japón**
Lugar de Constitución: **JAPÓN**

Teléfono:

Fax:

E- mail:

IDENTIFICACIÓN

☐ C.C.☐ NIT☐ C.E.☐ Otro

Cual

Número

3

REPRESENTANTE O APODERADO

Nombre: **GERMAN CUBILLOS MENDOZA**
Dirección: **Calle 17 No. 8 - 49 Torre A,**
Oficina 408 Bogotá, Colombia
Teléfono: **2432835** Fax: **2848489**

E- mail: **nannetti@col.net.co**

IDENTIFICACIÓN

☒ C.C.☐ NIT☐ C.E.☐ Otro

Cual

Número

19.397.479

TP

38.422

G.S.J.

4

INVENTOR (ES)

(72)

Nombre:

ANEXO A

Dirección:

ANEXO B

Nacionalidad o Domicilio:

ANEXO C

5

PCT (86)

Solicitud Internacional No. **PCT /JP2007/072256**Fecha **2007-11-16**Publicación internacional No. **WO2008/059948**Fecha **2008-05-22**

6

Título (54)

DERIVADO DE HALOALQUILSULFONANILIDA O SAL DEL
MISMO, HERBICIDA QUE COMPRENDE EL DERIVADO COMO INGRE-
DIENTE ACTIVO Y USO DEL HERBICIDA.

7

Clasificación internacional (51)

A01N 47/04 ; 93/12 A01P 13/00

8

Prioridad

☒ SI ☐ NO

(33) País de Origen

JAPÓN

(32) Fecha

2006-11-17

(31) Número de Solicitud

2006-312140

9

Comprobante de pago No.

09 - 27,173

Fecha

2009-04-08

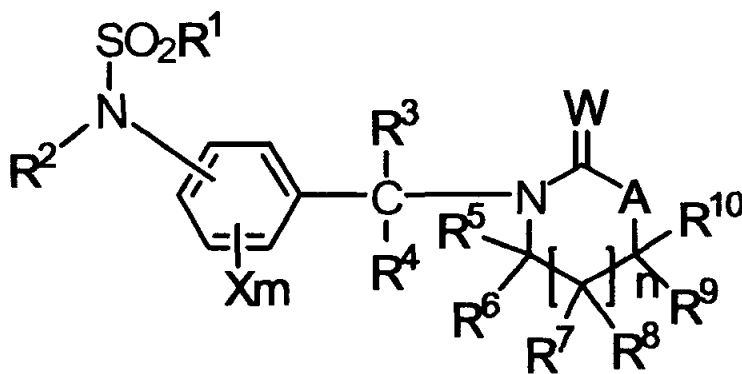
Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página

10 Anexos

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud.
- ☒ Documento que acredite 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.
- ☒ 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 de examen preliminar internacional efectuado por la IPEA
- ☐ De ser el caso, copia del 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 depósito del material biológico
- ☒ Arte final 12x12.
- ☐ 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 **Reporte de Búsqueda Internacional y su traducción al castellano.**

1

FIGURA CARACTERISTICA:



12

Solicito la concesión de la patente

NOMBRE GERMANA CUBILLOS MENDOZA

FIRMA 

C.C. 19.397.479

TP 38.422 C.S.J.

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página

ANEXO A
NOMBRE DE LOS INVENTORES

Inventor (es)

- 1. Tomokazu HINO**
- 2. Yasuko YAMADA**
- 3. Toshihiko SHIGENARI**
- 4. Koki MAMETSUKA**

ANEXO B
DIRECCION DE LOS INVENTORES

1. 345, Oyamadacho, Kawachinagano-shi, Osaka, Japón.
2. 345, Oyamadacho, Kawachinagano-shi, Osaka, Japón.
3. 345, Oyamadacho, Kawachinagano-shi, Osaka, Japón.
4. 345, Oyamadacho, Kawachinagano-shi, Osaka, Japón.

ANEXO C
DOMICILIO DE LOS INVENTORES

1. Osaka, Japón.
2. Osaka, Japón.
3. Osaka, Japón.
4. Osaka, Japón.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 27,173
FECHA : ABRIL 8 DE 2009



***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
FERNANDO NANNETTI	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	10626932	08/04/2009	552,000.00

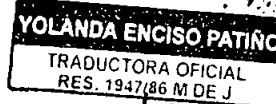
***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	540,000.00
		TOTAL :	\$ 540,000.00

SON: QUINIENTOS CUARENTA MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____



TRADUCCIÓN OFICIAL 08-04-02 DE UN DOCUMENTO ESCRITO
ORIGINALMENTE EN INGLÉS Y LEGALIZADO EN TOKIO, JAPÓN,
POR EL MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES BAJO
APOSTILLE No. 0009201 DEL 28 DE MARZO DE 2008

DECLARACIÓN

Yo, Miwako Ueda, c/o SHIMIZU & DAIGO, ABOGADOS DE PATENTES Y
MARCAS, con oficinas en 1-3-8, Nihonbashi-honcho, Chuo-ku, Tokio, mediante el
presente manifiesto:

QUE he preparado el texto en inglés que se anexa, el que es traducción fiel
del documento en japonés que igualmente se anexa:

QUE conozco bien ambos idiomas, el inglés y el japonés; y

QUE realmente considero que esta traducción es fiel y completa a mi leal
saber y entender.

Se expide a los 28 días de Marzo de 2008

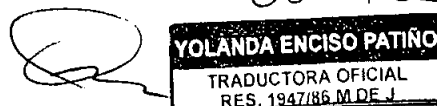
(Firmado) Miwaki Ueda
c/o SHIMIZU & DAIGO - ABOGADOS
DE PATENTES Y MARCAS

SUSCRITO EN MI PRESENCIA

(Firmado) Yukio Goto (hay sello)
Notario

(Hay Sello del Notario, Adjunto a la Oficina de Asuntos
Legales de Tokio)





214

Anexo:

(Traducción Parcial)

Certificado del Historial de la Compañía

2-5 Nihonbashi 1-chome, Chuo-ku, Tokio, Japón
NIHON NOHYAKY CO., LTD.
Compañía No. 0199-01-034985

Nombre de la Compañía: NIHON NOHYAKU CO., LTD.
Domicilio principal: 2-5 Nihonbashi 1-chome, Chuo-ku, Tokio, Japón
Notificaciones al Público: La publicación se hace por medios electrónicos en
<http://www.nichino.co.jp/info/kuokoku/>
Sin embargo, en caso de que la publicación no pueda hacerse por medios electrónicos debido a circunstancias accidentales o de cualquier manera inevitables, la publicación se hará en el Nihon Keizai Shibun emitido en Tokio.
Modificado: Diciembre 20, 2006.
Registrado: Diciembre 28, 2006
Fecha de Constitución: Febrero 10 de 1926

Objeto social:

1. La fabricación, comercialización y venta de los siguientes productos:
 - 1.1. Productos químicos para uso en agricultura, preparaciones farmacéuticas, farmacéuticos derivados de la farmacopea, farmacéuticos para uso veterinario y medicinas para animales y plantas marinos.
 - 1.2. Productos químicos para uso industrial
 - 1.3. Fertilizantes, alimentos para animales y sus aditivos
 - 1.4. Materiales, instalaciones, maquinaria y equipos agrícolas
 - 1.5. Productos de resina sintética excluyendo las utilizadas para equipos por la Ley de Higiene Alimentaria y contenedores y juguetes alimenticios
 - 1.6. Materiales utilizados para la construcción de jardines, Ingeniería civil y otros trabajos de construcción
 - 1.7. Materiales para construcción y reparaciones y para la limpieza de edificaciones y de sus instalaciones
 - 1.8. Equipos para la eliminación de desperdicios, drenajes y alcantarillado
2. Trabajos de control de plagas utilizando los productos mencionados en 1.1



3. Minería, refinación, procesamiento y venta de productos de minería
4. Contratación, planeación, construcción y control de jardines, obras civiles de construcción
5. Construcción y reparación y limpieza de edificios y trabajos de ingeniería relacionada con sus instalaciones y similares, y venta de know-how y la dirección administrativa de los mismos.
6. Contratación de vigilantes y seguridad
7. Suministro de trabajadores
8. Arrendamiento, intermediación y negocios de finca raíz
9. Administración de instalaciones deportivas y restaurantes
10. Negocios de certificación de análisis ambiental y consultoría para la conservación del medio ambiente
11. Bodegaje
12. Todas las demás actividades relacionadas con las anteriores.

Modificado en Diciembre 20 de 2006
Registrado en Diciembre 28 de 2006

Número de acciones por unidad: 1.000 acciones
Capital autorizado: 199.529.000 acciones
Modificado en Mayo 7 de 2001 Registrado en Mayo 17 de 2001
Capital emitido: 70.026.782 acciones
Modificado en Mayo 7 de 2001 Registrado en Mayo 17 de 2001
Valor del Capital: ¥10.939.725.250

Aspectos relacionados con los directivos:

Directivos: Shukichi Ohuchi y 10 personas más

Representante Legal:

Shukichi Ohuchi, con domicilio en 17-5, Higashi-nippori 5-chome, Arakawa-ku, Tokio

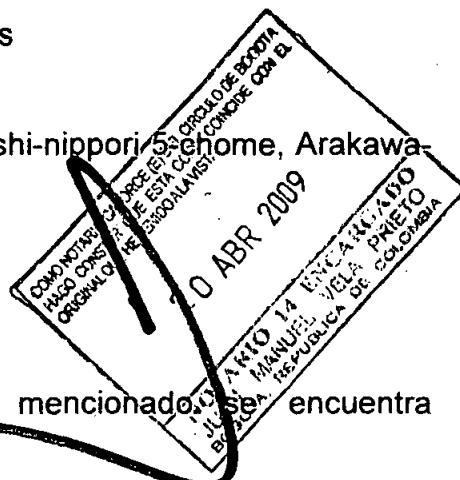
Audidores: Akira Iida y 3 personas más

(Aspectos varios – se omite la traducción)

Este documento certifica que todo lo arriba mencionado se encuentra efectivamente registrado en el Registro Mercantil

Febrero 20 de 2008
Kazuhiro Sahitoh, Registrador (Sello Oficial)
Oficina de Asuntos Legales de Tokio

Anexo: Texto en idioma japonés)



APOSTILLE

(Convención de La Haya del 5 de Octubre de 1961)

1. País: JAPÓN

Este documento público

2. ha sido suscrito por YUKIO GOTO

3. en su calidad de Notario de la Oficina de Asuntos Legales de Tokio

4. lleva el sello de YUKIO GOTO, Notario

Certificado

5. en Tokio

6. Marzo 28, 2008

7. por el Ministerio de Relaciones Exteriores

8. 078No. 009201

9. Sello:

10. Firma

(Facsímil)

Kazutoyo OYABE

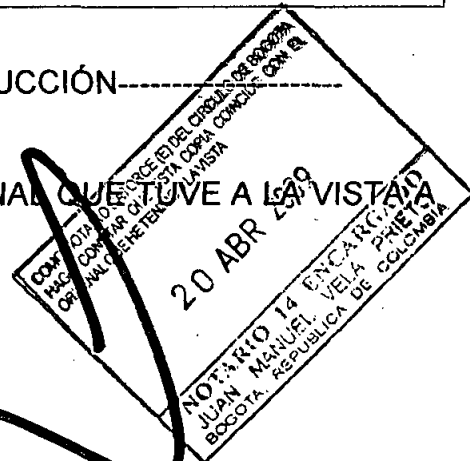
Por el Ministro de Relaciones Exteriores

Sello del Ministerio de
Relaciones Exteriores
Japón

-----HASTA AQUÍ LA TRADUCCIÓN-----

ES TRADUCCIÓN FIEL Y COMPLETA DEL ORIGINAL QUE TUVE A LA VISTA
LOS 10 DÍAS DE ABRIL DE 2008.

Yolanda Enciso Patiño
YOLANDA ENCISO PATIÑO
Traductora Oficial – Resolución 1947/86 MinJusticia



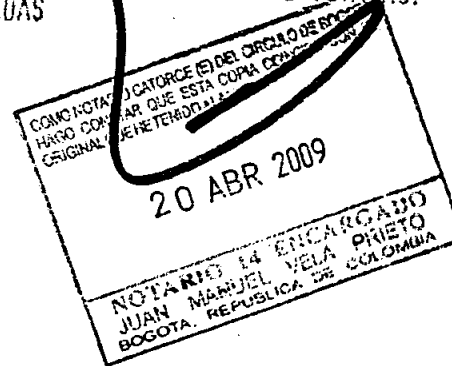
MINISTERIO DE
RELACIONES
EXTERIORES

NO ASUME
RESPONSABILIDAD
DEL TEXTO

012770
Yolande Enciso
CUYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DE EMPLERA
LAS FUNCIONES INDICADAS

2008 APR 11 P 10:30

me
JEFE DE LEGALIZACIONES
BOGOTÁ D.C.



DECLARATION

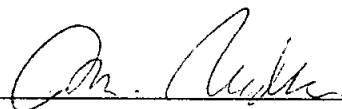
I, Miwako Ueda c/o SHIMIZU & DAIGO
PATENT AND TRADEMARK ATTORNEYS of 1-3-8, Nihonbashi-honcho;
Chuo-ku, Tokyo; hereby declare:

THAT I have prepared the English text attached hereto which is a
true translation of Japanese document which is also attached hereto;

THAT I am thoroughly familiar with both the English and Japanese
languages; and

THAT I verily believe that this translation is complete and correct to
the best of my knowledge.

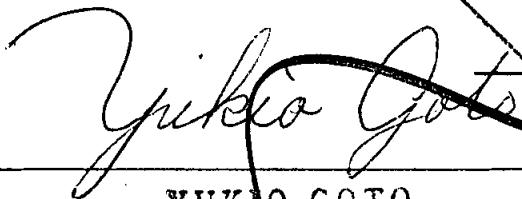
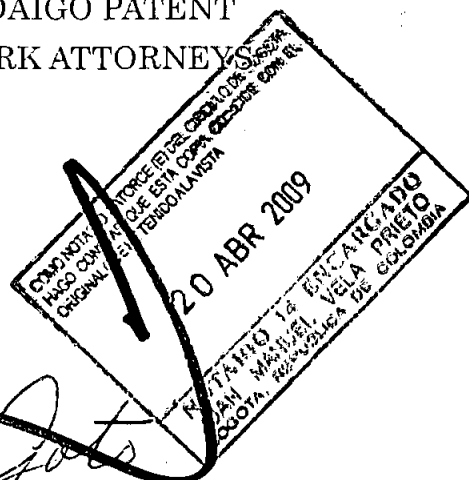
dated this 28th day of March, 2008



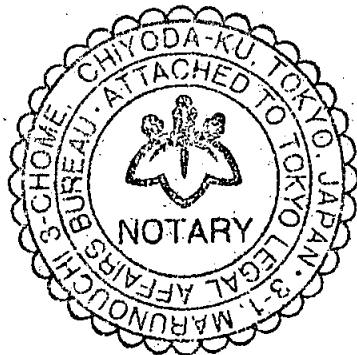
Miwako Ueda
c/o SHIMIZU & DAIGO PATENT
AND TRADEMARK ATTORNEYS

SIGNED BEFORE ME

MAR. 28. 2008



YUKIO GOTO
NOTARY



(Partial Translation)

Certificate of Company's all Histories

2-5, Nihonbashi 1-chome, Chuo-ku, Tokyo, Japan

NIHON NOHYAKU CO., LTD.

Company No. 0199-01-034985

Company Name: NIHON NOHYAKU CO., LTD.

Principal Office: 2-5, Nihonbashi 1-chome, Chuo-ku, Tokyo, Japan

Public Notification: Publication is made on an electronic publication

<http://www.nichino.co.jp/info/koukoku/>

However, in case it can not be made on the electronic publication by the accident and other unavoidable circumstances, the publication is made on The Nihon Keizai Shinbun issued in Tokyo.

Changed: December 20, 2006 Recorded: December 28, 2006

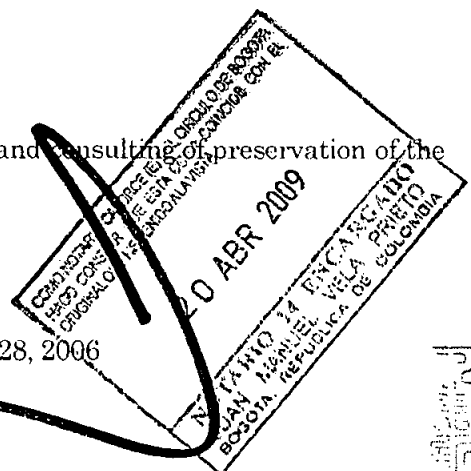
Foundation Date: February 10, 1926

Object of Company:

1. Manufacture, trade and sale of following goods:

- ① Chemical products for agricultural use, pharmaceutical preparations, pharmaceuticals out of pharmacopoeia, pharmaceuticals for veterinary use and medicines for marine animals and plants.
- ② Chemical products for industrial use.
- ③ Manures, feedstuffs for animals and additives therefore.
- ④ Agricultural materials, installations, machines and apparatus.
- ⑤ Synthetic resin goods excluding for apparatus for the Food Hygiene Act and the food container and toys.
- ⑥ Materials relating to construction of garden, civil engineering and other construction works.
- ⑦ Materials for building and repairs and cleaning of buildings and facilities attached thereto.
- ⑧ Waste, drainage and sewage disposal apparatus.
2. Pest control works using products mentioned above ①.
3. Mining, refining, processing and selling of mining products.
4. Contracting, planning, constructing and controlling of gardens, civil constructive works.
5. Building and repairs and cleaning of buildings and facilities attached engineering and other thereto and sale of know-how and management direction relating thereto.
6. Contracting of guard and security.
7. Business of sending of the laborer.
8. Lease, intermediation and dealing of real estate.
9. Management of sporting facilities and restaurant.
10. Business of certification for environmental weighing and consulting of preservation of the environment.
11. Warehousing.
12. Any other works relating to aforementioned items.

Changed on December 20, 2006 Recorded on December 28, 2006



Stock numbers for a unit: 1,000 stocks
Authorized Capital: 199,529,000 stocks
Changed on May 7, 2001 Recorded on May 17, 2001
Issued Stocks: 70,026,782 stocks
Changed on May 7, 2001 Recorded on May 17, 2001
Value of Capital: ¥10,939,725,250.

Items concerning officers:

Directors: Shukichi Ohuchi and 10 others

Representative Directors:

Shukichi Ohuchi of 17-5, Higashi-nippori 5-chome, Arakawa-ku, Tokyo.

Auditors: Akira Iida and 3 others

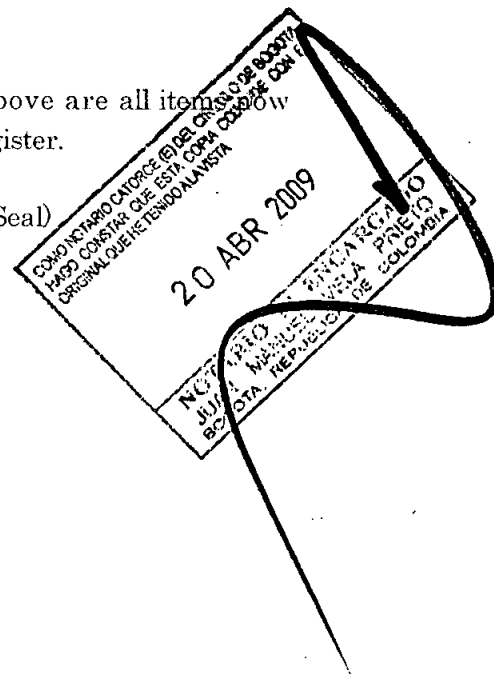
(Miscellaneous items - translation omitted)

This is the certificate to certify that the above are all items
effectively recorded in the Commercial Register.

February 20, 2008

Kazuhiro Saitoh, Registrar (Official Seal)

Tokyo Legal Affairs Bureau



現在事項全部証明書

東京都中央区日本橋一丁目2番5号
日本農薬株式会社
会社法人等番号 0199-01-034985

商号	日本農薬株式会社	
本店	東京都中央区日本橋一丁目2番5号	
公告をする方法	電子公告とする。 http://www.nichino.co.jp/info/koukoku/ ただし、事故その他やむを得ない事由によって電子公告による公告をすることができない場合は、東京都において発行する日本経済新聞に掲載する。	平成18年12月20日変更
		平成18年12月28日登記
会社成立の年月日	大正15年2月10日	
目的	(1) 次の物品の製造業、輸出入業、販売業 - イ 農薬、医薬品、医薬部外品、動物用医薬品及び水産動植物用薬剤 - ロ 工業薬品 - ハ 肥料、飼料及び飼料添加物 - ニ 農業資材、農業施設及び農業用機械器具 - ホ 食品衛生法上の器具及び容器包装等の食品用途並びに玩具を除く合成樹脂製品 - ヘ 造園、土木、その他各種建設工事の関連資材 - ト 建物及びそれに附随する設備等の保安機器、営繕・清掃資材 - チ 廃棄物、排水、污水处理装置 (2) 前号イの薬剤を使用する防除業 (3) 鉱産物の採掘、製錬、加工、販売 (4) 造園、土木、建築、その他各種建設工事の請負、設計、施工、監理 (5) 建物及びそれに附随する設備等の営繕及び清掃の請負並びにこれに関するノウハウの販売、経営指導 (6) 警備及び保安業の請負 (7) 労働者派遣事業 (8) 不動産の賃貸、仲介、売買 (9) スポーツ施設の経営 (10) 環境計量証明業並びに環境保全に関するコンサルティング業 (11) 倉庫業 (12) 前各号に附帯関連する一切の事業	
単元株式数	1000株	
発行可能株式総数	1億9952万9000株	平成18年12月20日変更 平成18年12月28日登記
		平成13年 5月 7日変更 平成13年 5月17日登記

東京都中央区日本橋一丁目2番5号

日本農薬株式会社

会社法人等番号 0199-01-034985

発行済株式の総数 並びに種類及び数	発行済株式の総数 7002万6782株	平成13年 5月 7日変更
		平成13年 5月17日登記
株券を発行する旨 の定め	当会社の株式については、株券を発行する	平成17年法律第87号第1 36条の規定により平成18 年 5月 1日登記
資本金の額	金109億3972万5250円	
株主名簿管理人の 氏名又は名称及び 住所並びに営業所	東京都港区芝三丁目3番1号 中央三井信託銀行株式会社 東京都港区芝三丁目3番1号 中央三井信託銀行株式会社本店	平成12年12月 4日変更 平成12年12月 8日登記
役員に関する事項	取締役 大内 脩 吉	平成19年12月18日重任 平成19年12月27日登記
	取締役 相見 正 篤	平成19年12月18日重任 平成19年12月27日登記
	取締役 桔 梗 巖 三	平成19年12月18日重任 平成19年12月27日登記
	取締役 濱 口 洋	平成19年12月18日重任 平成19年12月27日登記
	取締役 神 山 洋 一	平成19年12月18日重任 平成19年12月27日登記
	取締役 廣 瀬 薫	平成19年12月18日重任 平成19年12月27日登記
	取締役 伊 藤 利 信	平成19年12月18日重任 平成19年12月27日登記
	取締役 今 埜 隆 寛	平成19年12月18日重任 平成19年12月27日登記

整理番号 ウ117334

* 下線のあるものは抹消事項であることを示す。

2 / 4

東京都中央区日本橋一丁目2番5号
日本農薬株式会社
会社法人等番号 0199-01-034985

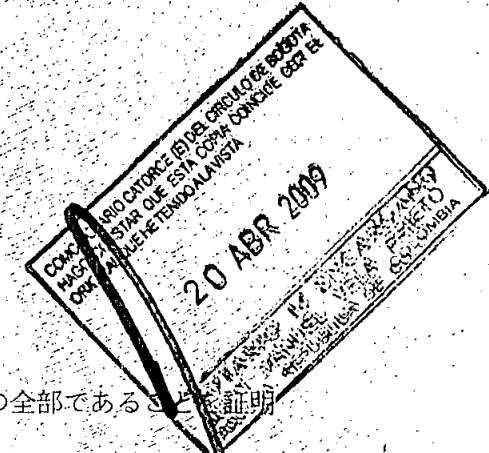
	取締役 間 野 耕 市	平成19年12月18日重任 平成19年12月27日登記
	取締役 中 嶋 宏 元 (社外取締役)	平成19年12月18日重任 平成19年12月27日登記
	取締役 友 井 洋 介	平成19年12月18日就任 平成19年12月27日登記
	東京都荒川区東日暮里五丁目17番5号 代表取締役 大 内 脩 吉	平成19年12月18日重任 平成19年12月27日登記
	監査役 飯 田 明 (社外監査役)	平成19年12月18日重任 平成19年12月27日登記
	監査役 田 中 學 (社外監査役)	平成17年12月21日就任 平成17年12月28日登記 平成18年9月5日社外 監査役の登記
	監査役 卜 部 貞 男	平成18年12月20日就任 平成18年12月28日登記
	会計監査人 協 和 監 査 法 人	平成19年12月18日重任 平成19年12月27日登記
社外取締役等の会 社に対する責任の 制限に関する規定	当会社は、社外取締役との間で、当該社外取締役の会社法第423条第1 項の損害賠償につき、善意でかつ重大な過失がないときは、法令で定める額 を限度として責任を負担する契約を締結することができる。 当会社は、社外監査役との間で、当該社外監査役の会社法第423条第1 項の損害賠償につき、善意でかつ重大な過失がないときは、法令で定める額 を限度として責任を負担する契約を締結することができる。 平成18年12月20日設定 平成18年12月28日登記	
取締役会設置会社 に関する事項	取締役会設置会社	平成17年法律第87号第1 36条の規定により平成18 年5月1日登記

東京都中央区日本橋一丁目2番5号
日本農薬株式会社
会社法人等番号 0199-04-034985

監査役設置会社に関する事項	監査役設置会社	平成17年法律第87号第136条の規定により平成18年5月1日登記
監査役会設置会社に関する事項	監査役会設置会社	平成18年9月5日登記
会計監査人設置会社に関する事項	会計監査人設置会社	平成18年9月5日登記

これは登記簿に記録されている現に効力を有する事項の全部であることを証明した書面である。

平成20年2月20日
東京法務局
登記官



斎藤和博



上田美和子は、当職の面前で、添付書面に自ら署名した。以下余

3

って、これを認証する。

平成20年 3 月 28 日、本公証人役場において

東京都千代田区丸の内三丁目3番1号

東京法務局所属

公 証 人
Notary

五島幸雄

YUKIO GOTO

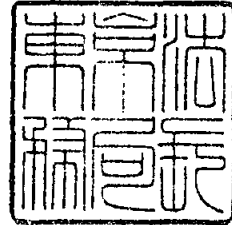
証 明

上記署名は、東京法務局所属公証人の署名に相違ないものであり、かつ、その押印は、
実のものであることを証明する。

平成20年 3 月 28 日

東京法務局長

五十嵐 義 治



APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Country: JAPAN

This public document

2. has been signed by YUKIO GOTO

3. acting in the capacity of Notary of the Tokyo Legal Affairs Bureau

4. bears the seal/stamp of YUKIO GOTO, Notary
Certified

5. at Tokyo

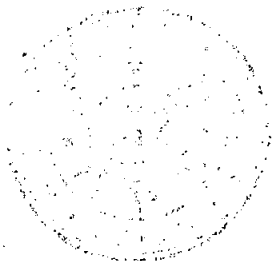
6. MAR. 28

7. by the Ministry of Foreign Affairs

8. 08- No 009201

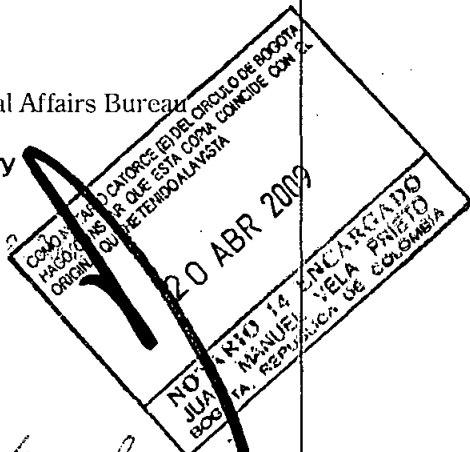
9. Seal/stamp:

10. Signature



Kazutoyo OYABE

For the Minister for Foreign Affairs



115

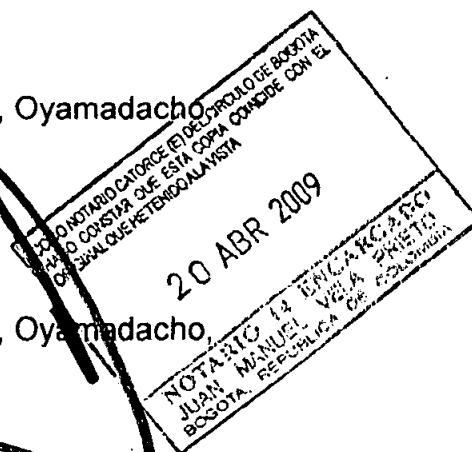
TRADUCCIÓN OFICIAL 09-04-02 DE LOS APARTES EN INGLÉS DE
UN DOCUMENTO LEGALIZADO EN TOKIO, JAPÓN, POR EL
MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES BAJO APOSTILLE No.
002964 DEL 6 DE ABRIL DE 2009

PODER ESPECIAL y CESIÓN, en versión bilingüe inglés-español, otorgado al Dr.
GERMAN ALONSO CUBILLOS MENDOZA por Yoishi KOHYAMA, Presidente de
NIHON NOHYAKU CO., LTD, y por Tomokazu HINO, Yasuko YAMADA, Toshihiko
SHIGENARI y Koki MAMETSUKA

(Anexo)

Anexo (A)

- 1) Tomokazu HINO,
ciudadano japonés,
c/o Nihon Nohyaku Co., Ltd., Research Center, 345, Oyamadacho,
Kawachinagano-shi, Osaka, Japón
- 1) Yasuko YAMADA,
ciudadano japonés,
c/o Nihon Nohyaku Co., Ltd., Research Center, 345, Oyamadacho,
Kawachinagano-shi, Osaka, Japón
- 1) Toshihiko SHIGENARI,
ciudadano japonés,
c/o Nihon Nohyaku Co., Ltd., Research Center, 345, Oyamadacho,
Kawachinagano-shi, Osaka, Japón
- 1) Koki MAMETSUKA,
ciudadano japonés,
c/o Nihon Nohyaku Co., Ltd., Research Center, 345, Oyamadacho,
Kawachinagano-shi, Osaka, Japón



09-04-02
2/5

(Anexo – hoja de firmas)

Anexo B

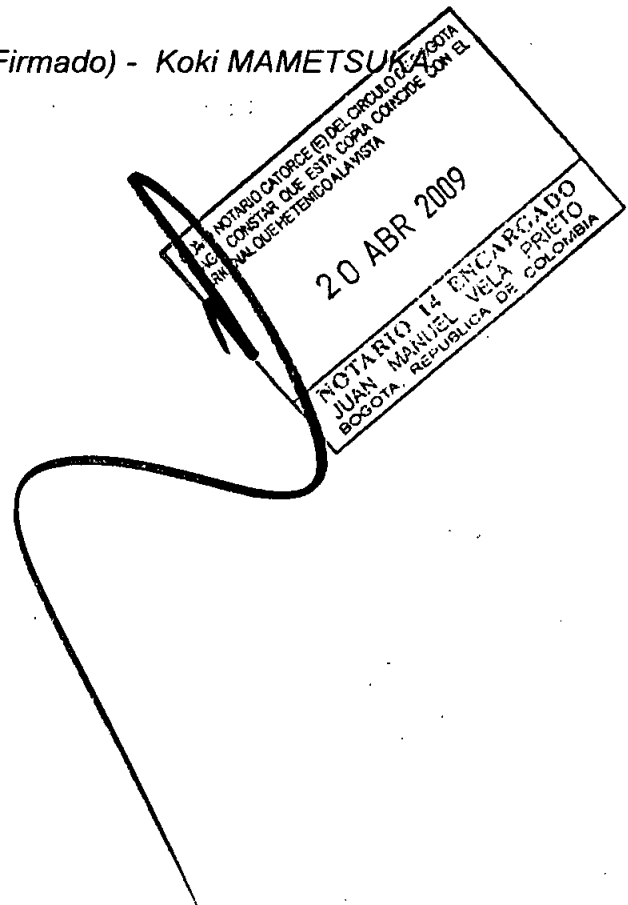
Lugar: Kawachinagano, Japón
Fecha: Abril 3 de 2009

(Firmado) - Tomokazu HINO

(Firmado) - Yasuko YAMADA

(Firmado)- Toshihiko SHIGENARI

(Firmado) - Koki MAMETSUKI



(Anexo)

CERTIFICACIÓN NOTARIAL

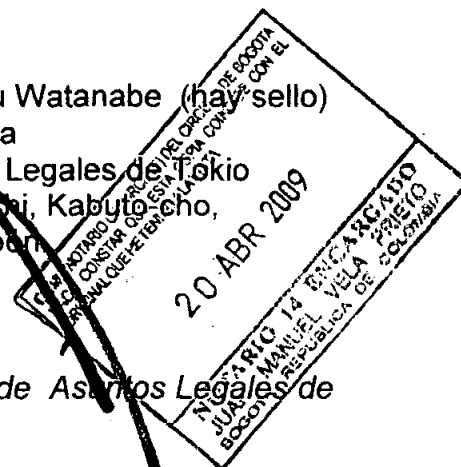
Registro No. 496 de 2009

Mediante el presente certifico que Katsuhisa MEREN, apoderado de Yohichi KOHYAMA, Presidente de NIHON NOHYAKU CO., LTD., y quien está facultado para suscribir el documento anexo en representación de la mencionada sociedad, organizada y existente de conformidad con las leyes de Japón, con domicilio en 2-5, Nihonbashi 1-chome, Chuo-ku, Tokio, Japón, manifestó en mi presencia que el citado Yohichi KOHYAMA acepta haber firmado el documento anexo.

Se expide a 6 de Abril de 2009

(Firmado) Masakazu Watanabe (hay sello)
Notario, adjunto a la
Oficina de Asuntos Legales de Tokio
No. 1-10, Nihombashi, Kabuto-cho,
Chuo-ku, Tokio, Japón

(Hay Sello Notarial de la Oficina de Asuntos Legales de Tokio)



09-04-2009 021
YOLANDA ENCISO PATIÑO
TRADUCTORA OFICIAL
RES. 1947/86 M DE J
315

(Anexo)

Registro No. 496 de 2009

CERTIFICACIÓN NOTARIAL

Mediante el presente certifico que Katsuhisa MEREN, apoderado de Tomokazu HINO, Yasuko YAMADA, Toshihiko SHIGENARI y Koki MAMETSUKA

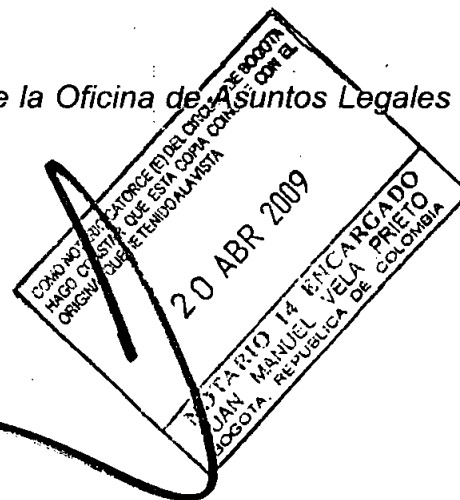
Manifestó en mi presencia que los citados Tomokazu HINO, Yasuko YAMADA, Toshihiko SHIGENARI y Koki MAMETSUKA suscribieron el documento anexo y que sus firmas son auténticas.

Se expide a 6 de abril de 2009

(Firmado) Masakazu Watanabe (hay sello)
Notario, adjunto a la
Oficina de Asuntos Legales de Tokio
No. 1-10, Nihombashi, Kabuto-cho,
Chuo-ku, Tokio, Japón.

(Hay Sello Notarial de la Oficina de Asuntos Legales de Tokio)

(Sigue: Texto en idioma japonés)



APOSTILLE

(Convención de La Haya del 5 de Octubre de 1961)

1. País: JAPÓN

Este documento público

2. ha sido suscrito por **Masakazu Watanabe**

3. en su calidad de Notario de la Oficina de Asuntos Legales de Tokio

4. lleva el sello de **Masakazu Watanabe, Notario**

Certificado

5. en Tokio

6. Abril 6, 2009

7. por el Ministerio de Relaciones Exteriores

8. 09-No.02964

9. Sello:

10. Firma

(Facsimil)

Kazutoyo OYABE

Por el Ministro de Relaciones Exteriores

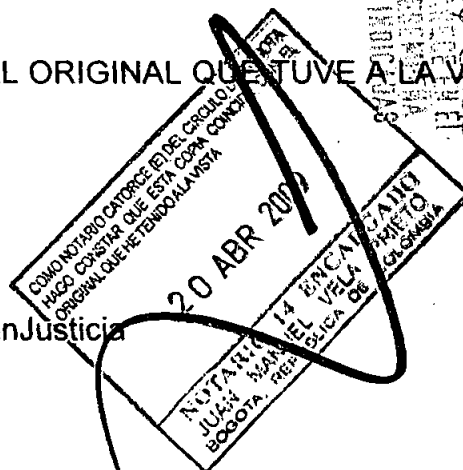
Sello del Ministerio de
Relaciones Exteriores
JapónMINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES
BOGOTÁ D.C.
2009 ABR 17 A 8:56
JEFE DE LEGALIZACIONESMINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORESNO SE ASUME
RESPONSABILIDAD
DEL TEXTO

-----HASTA AQUÍ LA TRADUCCIÓN-----

ES TRADUCCIÓN FIEL Y COMPLETA DEL ORIGINAL QUE TUVE A LA VISTA A
LOS 15 DÍAS DE ABRIL DE 2009.

YOLANDA ENCISO PATIÑO

Traductora Oficial – Resolución 1947/86 MinJusticia



CONFIRMED POWER OF ATTORNEY - ASSIGNMENT, FOR ARGENTINA, BOLIVIA, CHILE, COLOMBIA, COSTA RICA, CUBA, GUATEMALA, HONDURAS, MEXICO, NICARAGUA, PANAMA, PARAGUAY, PERU, SALVADOR, URUGUAY AND VENEZUELA.

INSTRUCTIONS: THIS DOCUMENT SHOULD BE USED WHEN IT IS DESIRED THAT THE LETTERS PATENT ISSUE IN THE NAME OF AN ASSIGNEE, AND IT MUST BE EXECUTED BY BOTH PARTIES. BOTH SIGNATURES SHOULD BE ATTESTED BY A NOTARY PUBLIC AND THE DOCUMENT SUBSEQUENTLY LEGALIZED BY A CONSUL OF THE COUNTRY WHERE THE APPLICATION IS TO BE FILED.

INSERT HERE
FULL NAME AND
ADDRESS OF
INVENTOR

TITLE OF
INVENTION

NAME AND
ADDRESS OF
ASSIGNEE

AMOUNT OF
CONSIDERATION
IF ANY

PLACE AND DATE
OF EXECUTION

Power with Assignment

(PATENTS)

The undersigned _____
Please see the Attached Sheet [A].

hereby appoints Dr. German Alonso Cubillos
Mendoza, of Calle 17 No. 8-49, Of. 408
Bogota, Colombia

as attorneys with special and sufficient powers to
apply for and obtain from the competent National
offices and authorities of COLOMBIA

Letters Patent for
HALOALKYLSULFONANILIDE DERIVATIVE
OR SALT THEREOF, HERBICIDE
COMPRISING THE DERIVATIVE AS ACTIVE
INGREDIENT, AND USE OF THE HERBICIDE

to be issued in the name of _____
NIHON NOHYAKU CO., LTD.,
a corporation organized under the laws
of Japan, of 2-5, Nihonbashi 1-chome,
Chuo-ku, Tokyo, Japan,

to whom assignment has been made of all right
and title to the said invention for the territory of
COLOMBIA aforesaid,

without any restriction whatsoever, the considera-
tion for the said assignment being the sum of _____

receipt whereof is hereby acknowledged. The as-
signee also signs these presents in token of accept-
ance of the said assignment and hereby authorizes
the said attorneys to take all necessary steps be-
fore the said offices and authorities for the purpose
above stated; to make petitions, declarations and
claims; to draw and sign specifications, amend-
ments and appeals; to pay all fees and instalments
and to make all payments required by law and
withdraw the same if necessary; to receive all do-
cuments and securities giving proper receipts there-
for; to desist and to receive; to fulfill all other
requisites and, finally, to use all means which said
attorneys shall deem proper for the safeguard of
the interests of the constituent, who hereby ratifies
and confirms all and whatsoever the said attorneys
shall lawfully do by virtue of these presents, with
full powers of substitution and revocation.

Given and signed at _____

Dated this 3rd day of April, 2009

SIGNATURE(S) OF ASSIGNOR(S)

Please see the Attached Sheet [B].

SIGNATURE(S) OF ASSIGNEE(S)

Date: April 3, 2009

Place: Tokyo, Japan

NIHON NOHYAKU CO., LTD.

Y. Kohyama
Yohichi KOHYAMA
President
Presidente

Power with Cession

(PATENTES)

El abajo firmado _____
Por favor ver la hoja adjunta (A).

nombra por el presente a Dr. German Alonso
Cubillos Mendoza, de Calle 17 No.
8 - 49, Of. 408 Bogotá, Colombia.

como apoderados con poder especial suficiente para
solicitar y obtener de las oficinas y autoridades
nacionales COLOMBIA

patente de invención por
DERIVADO DE HALOALQUILSULFONANILIDA
O SAL DEL MISMO, HERBICIDA QUE COM-
PRENDE EL DERIVADO COMO INGREDIENTE
ACTIVO Y USO DEL HERBICIDA.

cuyo título deberá extenderse a nombre de _____
NIHON NOHYAKU CO., LTD.
una corporación organizada bajo
las leyes de Japón, de 2-5, Nihonbashi
1-chome, Chuo-ku, Tokio, Japón.

a quien ha cedido todos sus derechos a la invención
arriba citada en cuanto se refiere al territorio de
COLOMBIA

_____ sin res-
tricción de ninguna clase, mediante el precio de _____

que declara haber recibido. El cesionario firma
también el presente en prueba de aceptación de la
cesión y autoriza a los expresados apoderados para
dar ante dichas oficinas y autoridades todos los
pasos necesarios al objeto indicado; elevar solicitud-
es, declaraciones y reclamos; formular y firmar
descripciones, enmiendas y apelaciones; pagar to-
dos los impuestos y cuotas y efectuar toda clase de
pagos determinados por la ley y retirar los mismos
si fuera necesario; recibir todos los documentos y
valores dando el descargo respectivo; desistir y
percibir; llenar cualesquier otros requisitos y to-
mar, en fin, todas las medidas que creyeran condu-
centes al resguardo de los intereses del mandante,
el que ratifica y confirma por el presente todo
cuanto hicieren legalmente dichos apoderados en
virtud del presente poder, con plena facultad de
sustitución y revocación.

Dado y firmado en _____

2001. Abril 3, 2009.

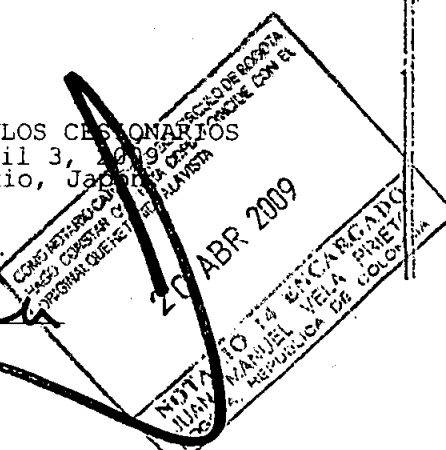
FIRMAS DE LOS CEDENTES

Por favor ver la hoja adjunta (B).

FIRMAS DE LOS CESIONARIOS

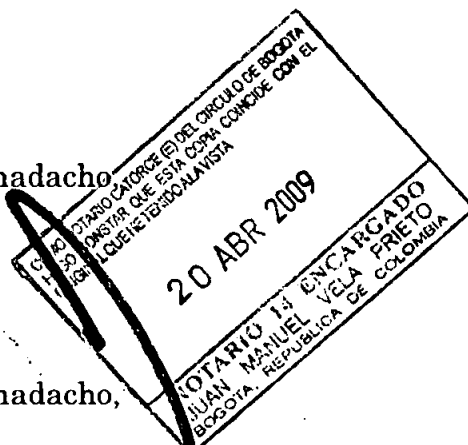
Fecha: Abril 3, 2009

Lugar: Tokio, Japón



ATTACHED SHEET [A]

1. Tomokazu HINO,
a national of Japan,
c/o Nihon Nohyaku Co., Ltd., Research Center, 345, Oyamadacho,
Kawachinagano-shi, Osaka, Japan
2. Yasuko YAMADA,
a national of Japan,
c/o Nihon Nohyaku Co., Ltd., Research Center, 345, Oyamadacho,
Kawachinagano-shi, Osaka, Japan
3. Toshihiko SHIGENARI,
a national of Japan,
c/o Nihon Nohyaku Co., Ltd., Research Center, 345, Oyamadacho,
Kawachinagano-shi, Osaka, Japan
4. Koki MAMETSUKA,
a national of Japan,
c/o Nihon Nohyaku Co., Ltd., Research Center, 345, Oyamadacho,
Kawachinagano-shi, Osaka, Japan



ATTACHED SHEET [B]

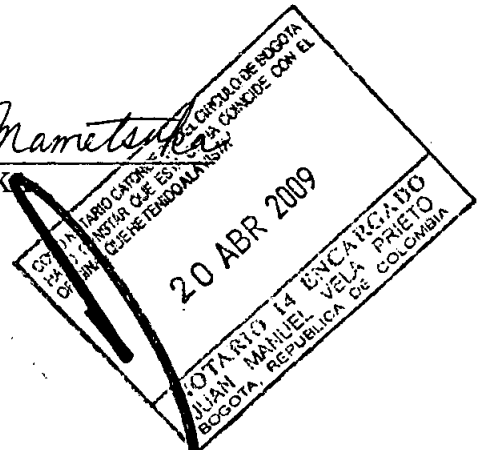
Place: Kawachinagano, Japan
Date: April 3, 2009

Tomokazu Hino
Tomokazu HINO

Yasuko Yamada
Yasuko YAMADA

Toshihiko Shigenari
Toshihiko SHIGENARI

Koki Mametsuki
Koki MAMETSUKI



39

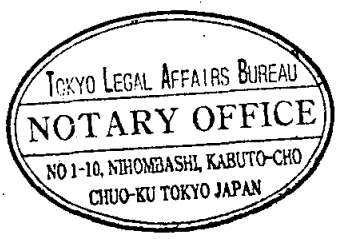
027

Registration No. 496 of 2009

NOTARIAL CERTIFICATE

This is to certify that Katsuhisa MEREN an attorney-in-fact of Yohichi KOHYAMA who is President of NIHON NOHYAKU CO., LTD. and who is authorized to sign to the attached document on behalf of the said company organized and existing according to the laws of Japan, located at 2-5, Nihonbashi 1-chome, Chuo-ku, Tokyo, Japan, has stated in my very presence that said Yohichi KOHYAMA acknowledges himself to have sign to the said document.

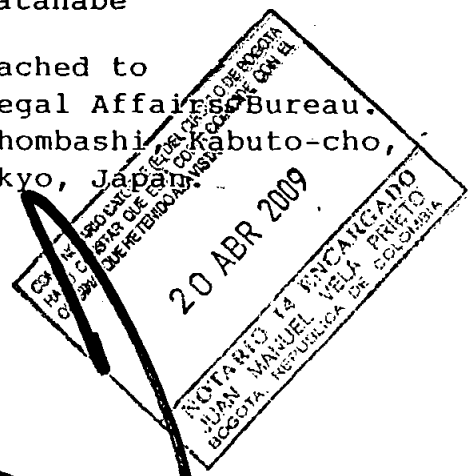
Dated this 6th day of April, 2009.



Masakazu Watanabe
Masakazu Watanabe



Notary, attached to
The Tokyo Legal Affairs Bureau.
No.1-10, Nihombashi, Kabuto-cho,
Chuo-ku, Tokyo, Japan



Registration No. 496 of 2009

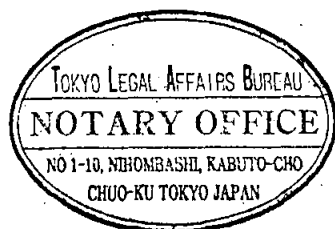
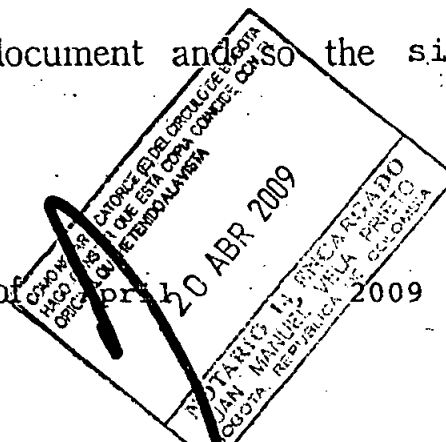
NOTARIAL CERTIFICATE

This is to certify that Katsuhisa MEREN
an attorney-in-fact of Tomokazu HINO, Yasuko YAMADA,
Toshihiko SHIGENARI and Koki MAMETSUKA

declared in my very presence that said Tomokazu HINO,
Yasuko YAMADA, Toshihiko SHIGENARI and Koki MAMETSUKA

had signed to the attached document and so the signatures
were true and genuine.

Dated this 6th day of



Masakazu Watanabe

Masakazu Watanabe

Notary, attached to
The Tokyo Legal Affairs Bureau.
No. 1-10, Nihombashi, Kabuto-cho,
Chuo-ku, Tokyo, Japan.



認

証

029

日本国法律に従い設立され日本国東京都中央区日本橋 1 丁目 2 番 5 号に所在する日本農薬株式会社の代表取締役であり、添付の書類に署名する権限を付与されている神山洋一、日野智和、山田康子、重成俊彦及び豆塚弘毅は、別添文書における署名が自己のものに相違ない旨、それぞれ代理人目連勝久を通じ、本公証人に対し自認した。

よって、これを認証する。

平成 21 年 4 月 6 日、本公証人役場において

東京都中央区日本橋兜町 1 番 10 号

東京法務局 所 属

公 証 人

Notary

浪 部

Masakazu Watanabe



証

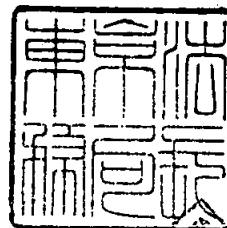
明

上記署名は、東京法務局所属公証人の署名に相違ないものであり、かつ、その押印は、真実のものであることを証明する。

平成 21 年 4 月 6 日

東京法務局長

五十嵐義治



APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Country: JAPAN

This public document

2. has been signed by Masakazu Watanabe

3. acting in the capacity of Notary of the Tokyo Legal Affairs Bureau

4. bears the seal/stamp of Masakazu Watanabe, Notary

Certified

5. at Tokyo

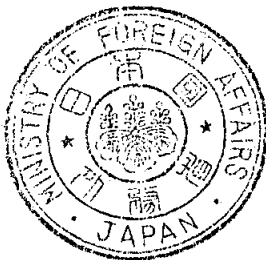
6. April 6, 2009

7. by the Ministry of Foreign Affairs

8. 09- N^o 002964

9. Seal/stamp:

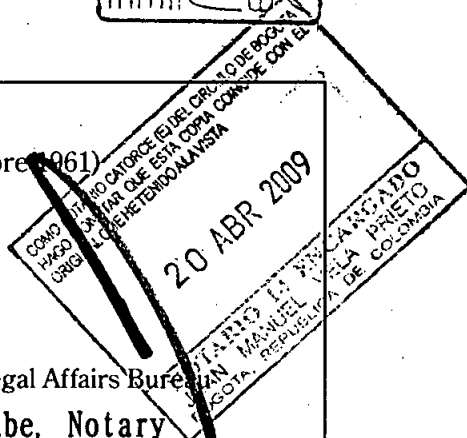
10. Signature



K. Oyabe

Kazutoyo OYABE

For the Minister for Foreign Affairs



DESCRIPCIÓN

DERIVADO DE HALOALQUILOSULFONANILIDA O SAL DEL MISMO,
HERBICIDA QUE COMPRENDE EL DERIVADO COMO INGREDIENTE
ACTIVO, Y USO DEL HERBICIDA

5

CAMPO TÉCNICO

La presente invención se refiere a un derivado
novedoso de haloalquilosulfonanilida o una sal del mismo,
un herbicida que comprende el mismo como ingrediente activo
10 y un método de uso del mismo.

ANTECEDENTES DE LA TÉCNICA

Convencionalmente se ha conocido que un compuesto que
tenga un esqueleto en el que un derivado de
haloalquilosulfonanilida y un heterociclo estén enlazados
15 por medio de un espaciador como un grupo alquileo en un
átomo de nitrógeno en el heterociclo es útil como herbicida
(Por ejemplo, hacer referencia a JP-A-2004-107322 o JP-A-
2006-265240). Sin embargo, aún no se conocen los derivados
de haloalquilosulfonanilida enlazados a un anillo de 6 a 7
20 miembros, de que se trata la presente invención, y la
actividad herbicida del mismo.

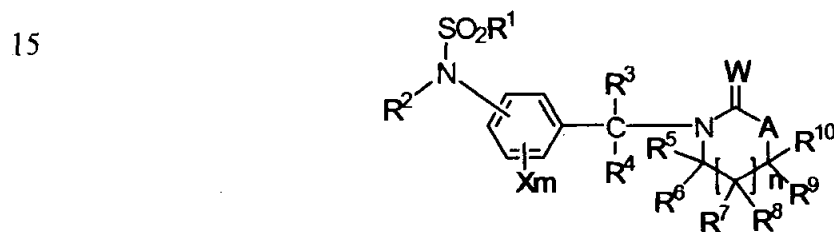
DESCRIPCIÓN DE LA INVENCION

Como se dijo arriba, se sabe que un cierto derivado de
haloalquilosulfonanilida es útil como herbicida pero
25 características tales como efecto herbicida, amplia
aplicabilidad para una serie de especies de maleza
incluidas malezas difíciles de controlar, efecto residual,
excelente selectividad cosecha-maleza no son suficientes, y
se ha exigido la creación de una composición herbicida que
30 tenga características más excelentes. Por lo tanto, un
objeto de la presente invención es proveer un compuesto que
sea útil como herbicida y que tenga tanto un efecto
herbicida extraordinario como características como
excelente selectividad cosecha-maleza.

35 Los presentes inventores han realizado extensivos
estudios sobre la síntesis de un derivado que tenga una

estructura de sulfonanilida y la bioactividad del mismo con el fin de desarrollar un herbicida novedoso y como resultado, han encontrado que derivados novedosos de haloalquilosulfonanilida representados por la fórmula general (I) de la presente invención, son útiles como herbicidas que tienen un efecto herbicida extraordinario, amplia aplicabilidad para una serie de especies de maleza, incluidas malezas difíciles de controlar, efecto residual y excelente selectividad cosecha-maleza y que son particularmente útiles como herbicidas del arroz y de este modo completan la presente invención.

Es decir, la presente invención se refiere a un derivado de haloalquilosulfonanilida representado por la fórmula general (I):



en donde R¹ representa un grupo halo-alquilo (C₁-C₈);
 20 R² representa un átomo de hidrógeno; un grupo alcoxycarbonilo (C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo alquilocarbonilo (C₁-C₁₈); un grupo halo-alquilocarbonilo (C₁-C₆); un grupo fenilocarbonilo; un grupo fenilocarbonilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, los cuales
 25 pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo alcoxycarbonilo (C₁-C₁₈); un grupo alquenciloxycarbonilo (C₂-C₁₈); un grupo alquenciloxycarbonilo (C₂-C₁₈); un grupo halo-alcoxycarbonilo(C₁-C₆); un grupo alcoxi(C₁-C₆)
 30 alcoxycarbonilo (C₁-C₆); un grupo alquiltio(C₁-C₆)alcoxycarbonilo (C₁-C₆); un grupo alquilosulfinilo(C₁-C₆)alcoxycarbonilo (C₁-C₆); un grupo alquilosulfonilo(C₁-C₆)alcoxycarbonilo(C₁-C₆); un grupo fenoxycarbonilo ; un grupo fenoxycarbonilo sustituido que tiene de 1 a 5
 35 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo fenoxi-alquilocarbonilo(C₁-C₆); un grupo fenoxi-

alquilocarbonilo (C_1-C_6) sustituido que tiene de 1 a 5
sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes,
seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo
benciloxicarbonilo; un grupo benciloxicarbonilo sustituido
5 que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos
o diferentes, seleccionado de Y según se define a
continuación; un grupo alquiltiocarbonilo(C_1-C_6); un grupo
alquilosulfonilo(C_1-C_6); un grupo halo-alquilosulfonilo(C_1-
 C_6); un grupo fenilosulfonilo; un grupo fenilosulfonilo
10 sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser
los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define
a continuación; un grupo alquilo(C_1-C_6); un grupo
alquenilo(C_2-C_6); un grupo alquinilo(C_2-C_6); un grupo
fenilo-alquilo(C_1-C_6); un grupo fenilo-alquilo(C_1-C_6)
15 sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo,
que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y
según se define a continuación; un grupo fenilocarbonilo-
alquilo (C_1-C_6); un grupo fenilocarbonilo-alquilo(C_1-C_6)
sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo,
20 que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y
según se define a continuación; un grupo alcoxi(C_1-
 C_6)alquilo(C_1-C_6); un grupo alcoxi(C_1-C_6)alcoxi(C_1-
 C_6)alquilo(C_1-C_6); un grupo tri-alquilosilil(C_1-C_6)alcoxi(C_1-
 C_6)alquilo(C_1-C_6) que puede ser el mismo o diferente; un
25 grupo fenilo-alcoxi(C_1-C_6)alquilo(C_1-C_6); un grupo fenilo-
alcoxi(C_1-C_6)alquilo(C_1-C_6) sustituido que tiene de 1 a 5
sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o
diferentes, seleccionado de Y según se define a
continuación; un grupo alquilocarboniloxi(C_1-C_6)alquilo(C_1-
30 C_6); un grupo fenilocarboniloxi-alquilo(C_1-C_6); un grupo
fenilocarbonilo oxi-alquilo(C_1-C_6) sustituido en el anillo,
que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y
según se define a continuación; un grupo fenilocarbonilo
oxi-alcoxi(C_1-C_6)alquilo(C_1-C_6); un grupo fenilocarbonilo
35 oxi-alcoxi(C_1-C_6)alquilo(C_1-C_6) sustituido que tiene de 1 a
5 sustituyentes en el anillo, seleccionado de Y según se
define a continuación; un grupo alcoxicarboniloxi(C_1-
 C_6)alquilo(C_1-C_6); un grupo mono-alquiloaminocarboniloxi(C_1-
 C_6)alquilo(C_1-C_6); un grupo di-alquiloaminocarboniloxi(C_1-

- C₆)alquilo(C₁-C₆) que pueden ser los mismos o diferentes y pueden enlazarse entre sí para formar un anillo de 5 a 8 miembros; un grupo feniloaminocarboniloxi-alquilo(C₁-C₆); un grupo feniloaminocarbonilo oxi-alquilo (C₁-C₆) sustituido
- 5 que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo N-alquilo(C₁-C₆)-N-feniloamino-carboniloxi-alquilo(C₁-C₆); un N-alquilo(C₁-C₆)-N-fenilo aminocarboniloxi-alquilo(C₁-C₆) sustituido que
- 10 tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo feniltio-alquilo(C₁-C₆); un grupo feniltio-alquilo(C₁-C₆) sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o
- 15 diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo fenilosulfonilo-alquilo(C₁-C₆); un grupo fenilosulfonilo-alquilo(C₁-C₆) sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a
- 20 continuación; un grupo fenilo-alquiltio(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo fenilo-alquiltio (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆) sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo fenilo-
- 25 alquilosulfonilo(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo fenilo-alquilosulfonilo(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆) sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo alquiltio(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un
- 30 grupo halo-alquiltio(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo tiocianato-alquilo(C₁-C₆); un grupo alquilo(C₁-C₆) heterocíclico, en donde el heterociclo representa piridina, piridina-N-óxido, pirimidina, pirazina, triazina, furano, tetrahidrofurano, tiofeno, tetrahidrotiofeno,
- 35 tetrahidropirano, tetrahidrotiopirano, oxazol, isoxazol, oxadiazol, tiazol, isotiazol, tiadiazol, imidazol, triazol, pirazol, pirrol, pirrolidina, ftalimida o 2,3-dihidro-1,2-benzotiazol-3-ona 1,1-dioxida; o un grupo alquilo(C₁-C₆) heterocíclico sustituido que tiene de 1 a 4 sustituyentes

en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación, en donde el heterociclo es el mismo que arriba;

5 R^3 y R^4 , que pueden ser el mismo o diferentes, cada uno representa un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo(C_1-C_6); un grupo cicloalquilo(C_3-C_6); un grupo alcoxi(C_1-C_6); un átomo de halógeno o un grupo cianó, y R^3 y R^4 pueden estar enlazados entre sí para formar un anillo de 3 a 7 miembros;

10 R^5 y R^6 , que pueden ser el mismo o diferentes, cada uno representa un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo(C_1-C_6); un grupo cicloalquilo(C_3-C_6); un grupo alcoxi(C_1-C_6); un átomo de halógeno; o un grupo ciano;

15 R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} , que pueden ser el mismo o diferentes, cada uno representa un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; un grupo alquilo(C_1-C_6); un grupo cicloalquilo(C_3-C_6); un grupo alcoxi(C_1-C_6); un grupo halo-alquilo(C_1-C_6); un grupo alcoxi(C_1-C_6)alquilo(C_1-C_6); un grupo alquilocarboniloxi (C_1-C_6)alquilo(C_1-C_6); un grupo mono-alquiloamino(C_1-C_6) alquilo(C_1-C_6); un grupo di-
20 alquiloamino(C_1-C_6) alquilo(C_1-C_6) que puede ser el mismo o diferente; un grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C_1-C_6)alquilo(C_1-C_6); un grupo di-alquiloaminocarbonilo(C_1-C_6)alquilo(C_1-C_6) que pueden ser los mismos o diferentes; un grupo fenilo-alquilo(C_1-C_6); un grupo fenilo-alquilo(C_1-C_6)
25 sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo fenoxi-alquilo(C_1-C_6); un grupo fenoxi-alquilo(C_1-C_6) sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a
30 continuación; un grupo fenilo; un grupo fenilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo alcoxicarbonilo(C_1-C_6); un
35 grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C_1-C_6); un grupo di-alquiloaminocarbonilo (C_1-C_6) que puede ser el mismo o diferente; un grupo hidroxilo; o un grupo ciano, y R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} pueden estar enlazados respectivamente a un

sustituyente adyacente para formar un anillo de 3 a 7 miembros por medio de un grupo alquileo(C₁-C₄) que pueden ser los mismos o diferentes y puede interrumpirse con uno o dos heteroátomos seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, o un átomo de nitrógeno; en donde el átomo de nitrógeno puede ser sustituido con un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo(C₁-C₆), un grupo alqueno(C₂-C₆), un grupo alquino(C₂-C₆) o un grupo ciclo-alquilo(C₃-C₆);

10 n representa 1 ó 2;

A representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

W representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

X puede ser el mismo o diferente y representa un átomo de halógeno; un grupo alquilo(C₁-C₆); un grupo alqueno(C₂-C₆); un grupo alquino(C₂-C₆); un grupo ciclo-alquilo (C₃-C₆); un grupo halo-alquilo (C₁-C₆); un grupo ciclohalo-alquilo(C₃-C₆); un grupo alcoxi(C₁-C₆); un grupo halo-alcoxi(C₁-C₆); un grupo alcoxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo halo-alcoxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo alquiltio(C₁-C₆); un grupo halo-alquiltio(C₁-C₆); un grupo alquiltio(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo halo-alquiltio(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo alquilosulfinilo(C₁-C₆); un grupo halo-alquilosulfinilo(C₁-C₆); un grupo alquilosulfonilo(C₁-C₆); un grupo halo-alquilosulfonilo(C₁-C₆); un grupo fenilo; un grupo fenilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo fenoxi; un grupo fenoxi sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo feniltio; un grupo feniltio sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo fenilosulfinilo; un grupo fenilosulfinilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de de Y según se define a continuación; un grupo fenilosulfonilo; un grupo fenilosulfonilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos

o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo alquilocarbonilo(C_1-C_6), un grupo halo-alquilocarbonilo(C_1-C_6), un grupo fenilocarbonilo; un grupo fenilocarbonilo sustituido que tiene de 1 a 5

5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo alcoxicarbonilo(C_1-C_6); un grupo carboxilo; un grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C_1-C_6); un grupo di-alquiloaminocarbonilo(C_1-C_6) que puede ser el mismo o diferente; un

10 grupo feniloaminocarbonilo; un grupo feniloaminocarbonilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo fenilo-alquiloaminocarbonilo(C_1-C_6); un grupo fenilo-

15 alquiloaminocarbonilo(C_1-C_6); sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo hidroxilo o un grupo ciano; y m representa un entero de 0 a 4, y X puede tomarse junto con

20 un átomo de carbono adyacente en el anillo de benceno para formar un anillo de 5 o 6 miembros por medio de un grupo alquilenilo(C_1-C_4) que pueden ser los mismos o diferentes y puede interrumpirse con uno o dos heteroátomos seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, o

25 un átomo de nitrógeno el cual puede ser sustituido con un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo(C_1-C_6), un grupo alquenilo(C_2-C_6), un grupo alquinilo(C_2-C_6) o un grupo ciclo-alquilo(C_3-C_6);

Y, que puede ser el mismo o diferente, representa de 1

30 a 5 sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno; un grupo nitro; un grupo alquilo(C_1-C_6); un grupo alquenilo(C_2-C_6); un grupo alquinilo(C_2-C_6); un grupo ciclo-alquilo(C_3-C_6); un grupo halo-alquilo(C_1-C_6); un grupo ciclohalo-alquilo(C_3-C_6); un grupo alcoxi(C_1-C_6); un grupo halo-

35 alcoxi(C_1-C_6); un grupo ciano-alcoxi(C_1-C_6); un grupo alcoxi(C_1-C_6)alcoxi(C_1-C_6); un grupo alquiltio(C_1-C_6); un grupo halo-alquiltio(C_1-C_6); un grupo alquilosulfinilo(C_1-C_6); un grupo halo-alquilosulfinilo(C_1-C_6); un grupo

alquilosulfonilo(C₁-C₆); un grupo halo-alquilosulfonilo(C₁-C₆); un grupo fenilo; un grupo fenilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de un átomo de halógeno, un grupo

5 alquilo(C₁-C₆), un grupo alquenilo(C₂-C₆), un grupo alquinilo(C₂-C₆), un grupo ciclo-alquilo(C₃-C₆), un grupo halo-alquilo(C₁-C₆), un grupo ciclohalo-alquilo(C₃-C₆), un grupo alcoxi(C₁-C₆), un grupo halo-alcoxi(C₁-C₆), un grupo alquiltio (C₁-C₆), un grupo halo-alquiltio(C₁-C₆), un grupo

10 alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo

15 alcoxycarbonilo(C₁-C₆), un grupo carboxilo, un grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆), un grupo di-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆) que puede ser el mismo o diferente, un grupo hidroxilo o un grupo ciano; un grupo heterocíclico que representa un grupo piridilo, un grupo piridin-N-óxido, un grupo pirimidinilo, un grupo

20 pirazinilo, un grupo triazinilo, un grupo furilo, un grupo tetrahidrofurilo, un grupo tienilo, un grupo tetrahidrotienilo, un grupo tetrahidropiranilo, un grupo tetrahidrotiopiranilo, un grupo oxazolilo, un grupo isooxazolilo, un grupo oxadiazolilo, un grupo tiazolilo, un

25 grupo isotiazolilo, un grupo tiadiazolilo, un grupo imidazolilo, un grupo triazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo pirrolilo o un grupo pirrolidinilo; un grupo heterocíclico sustituido según se define arriba, que tiene uno o más sustituyentes en el anillo, que pueden ser los

30 mismos o diferentes, seleccionado de un átomo de halógeno, un grupo alquilo(C₁-C₆), un grupo alquenilo(C₂-C₆), un grupo alquinilo(C₂-C₆) un grupo ciclo-alquilo(C₃-C₆), un grupo halo-alquilo(C₁-C₆), un grupo ciclohalo-alquilo(C₃-C₆), un grupo alcoxi(C₁-C₆), un grupo halo-alcoxi(C₁-C₆), un grupo

35 alquiltio(C₁-C₆), un grupo halo-alquiltio(C₁-C₆), un grupo alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo

- alcoxicarbonilo(C₁-C₆), un grupo carboxilo, un grupo mono-
alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆), un grupo di-
alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆) que puede ser el mismo o
diferente, un grupo hidroxilo o un grupo ciano; un grupo
- 5 fenoxi; un grupo fenoxi sustituido que tiene de 1 a 5
sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes,
seleccionado de un átomo de halógeno, un grupo alquilo(C₁-
C₆), un grupo alquenilo(C₂-C₆), un grupo alquinilo(C₂-C₆), un
grupo ciclo-alquilo(C₃-C₆), un grupo halo-alquilo(C₁-C₆), un
- 10 grupo ciclohalo-alquilo(C₃-C₆), un grupo alcoxi(C₁-C₆), un
grupo halo-alcoxi(C₁-C₆), un grupo alquiltio(C₁-C₆), un
grupo halo-alquiltio (C₁-C₆), un grupo alquilosulfinilo(C₁-
C₆), un grupo halo-alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo
alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfonilo(C₁-
- 15 C₆), un grupo alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo halo-
alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo alcoxicarbonilo, un grupo
carboxilo, un grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆), un
grupo di-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆) el cual puede ser el
mismo o diferente, un grupo hidroxilo o un grupo ciano; un
- 20 grupo feniltio; un grupo feniltio sustituido que tiene de 1
a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes,
seleccionado de un átomo de halógeno, un grupo alquilo(C₁-
C₆), un grupo alquenilo(C₂-C₆), un grupo alquinilo(C₂-C₆), un
grupo ciclo-alquilo(C₃-C₆), un grupo halo-alquilo(C₁-C₆), un
- 25 grupo ciclohalo-alquilo(C₃-C₆), un grupo alcoxi(C₃-C₆), un
grupo halo-alcoxi(C₁-C₆), un grupo alquiltio(C₁-C₆), un
grupo halo-alquiltio(C₁-C₆), un grupo alquilosulfinilo(C₁-
C₆), un grupo halo-alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo
alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfonilo(C₁-
- 30 C₆), un grupo alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo halo-
alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo alcoxicarbonilo(C₁-C₆), un
grupo carboxilo, un grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆),
un grupo di-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆) que puede ser el
mismo o diferente, un grupo hidroxilo o un grupo ciano(C₁-
- 35 C₆); un grupo fenilosulfinilo; un grupo fenilosulfinilo
sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser
los mismos o diferentes, seleccionado de un átomo de
halógeno, un grupo alquilo(C₁-C₆), un grupo alquenilo(C₂-
C₆), un grupo alquinilo(C₂-C₆), un grupo ciclo-alquilo(C₃-

- C₆), un grupo halo-alquilo(C₁-C₆), un grupo ciclohalo-alquilo(C₃-C₆), un grupo alcoxi(C₁-C₆), un grupo halo-alcoxi(C₁-C₆), un grupo alquiltio(C₁-C₆), un grupo halo-alquiltio(C₁-C₆), un grupo alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo
- 5 halo-alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo alcoxicarbonilo(C₁-C₆), un grupo carboxilo, un grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆), un grupo di-
- 10 alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆) el cual puede ser el mismo o diferente, un grupo hidroxilo o un grupo ciano; un grupo fenilosulfonilo; fenilosulfonilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de un átomo de halógeno, un grupo alquilo(C₁-
- 15 C₆), un grupo alquenilo(C₂-C₆), un grupo alquinilo(C₂-C₆), un grupo ciclo-alquilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilo(C₁-C₆), un grupo halo-cicloalquilo(C₃-C₆), un grupo alcoxi(C₁-C₆); un grupo halo-alcoxi(C₁-C₆); un grupo alquiltio(C₁-C₆), un grupo halo-alquiltio(C₁-C₆); un grupo alquilosulfinilo(C₁-
- 20 C₆), un grupo halo-alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo alcoxicarbonilo(C₁-C₆), un grupo carboxilo, un grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆),
- 25 un grupo di-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆) que puede ser el mismo o diferente, un grupo hidroxilo o un grupo ciano; un grupo alquilocarbonilo(C₁-C₆); un grupo halo-alquilocarbonilo(C₁-C₆); un grupo fenilocarbonilo; un grupo fenilocarbonilo sustituido que tiene de 1 a 5
- 30 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de un átomo de halógeno, un grupo alquilo(C₁-C₆), un grupo alquenilo(C₂-C₆), un grupo alquinilo(C₂-C₆), un grupo ciclo-alquilo(C₃-C₆), un grupo halo-alquilo(C₁-C₆), un grupo ciclohalo-alquilo(C₃-C₆), un grupo alcoxi(C₁-C₆), un
- 35 grupo halo-alcoxi(C₁-C₆), un grupo alquiltio(C₁-C₆), un grupo halo-alquiltio(C₁-C₆), un grupo alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo halo-

alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo alcoxicarbonilo(C₁-C₆), un grupo carboxilo, un grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆), un grupo di-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆) que puede ser el mismo o diferente, un grupo hidroxilo o un grupo ciano; un

5 grupo alcoxicarbonilo(C₁-C₆), un grupo carboxilo; un grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆), un grupo di-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆) que puede ser el mismo o diferente; un grupo feniloaminocarbonilo; un grupo feniloaminocarbonilo sustituido que tiene de 1 a 5

10 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de un átomo de halógeno, un grupo alquilo(C₁-C₆), un grupo alquenilo(C₂-C₆), un grupo alquinilo(C₂-C₆), un grupo ciclo-alquilo(C₃-C₆), un grupo halo-alquilo(C₁-C₆), un grupo ciclohalo-alquilo(C₃-C₆), un

15 grupo alcoxi(C₁-C₆), un grupo halo-alcoxi(C₁-C₆), un grupo alquiltio(C₁-C₆), un grupo halo-alquiltio(C₁-C₆), un grupo alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo alquilocarbonilo(C₁-C₆),

20 un grupo halo-alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo alcoxicarbonilo(C₁-C₆), un grupo carboxilo, un grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆), un grupo di-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆) que puede ser el mismo o diferente, un grupo hidroxilo o un grupo ciano; un grupo

25 fenilo-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆); un grupo fenilo-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆) sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de un átomo de halógeno, un grupo alquilo(C₁-C₆), un grupo alquenilo(C₂-C₆), un grupo

30 alquinilo(C₂-C₆), un grupo ciclo-alquilo(C₃-C₆), un grupo halo-alquilo(C₁-C₆), un grupo ciclohalo-alquilo(C₃-C₆), un grupo alcoxi(C₁-C₆), un grupo halo-alcoxi(C₁-C₆), un grupo alquiltio(C₁-C₆), un grupo halo-alquiltio(C₁-C₆), un grupo alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo halo-

35 alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo alcoxicarbonilo(C₁-C₆), un grupo carboxilo, un grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆), un grupo di-

alquiloaminocarbonilo(C_1-C_6) que puede ser el mismo o diferente, un grupo hidroxilo o un grupo ciano; un grupo hidroxilo o un grupo ciano, y Y puede tomarse junto con un átomo de carbono adyacente en el anillo de benceno para
5 formar un anillo de 5 ó 6 miembros por medio de un grupo alquilenilo(C_1-C_4) que puede ser el mismo o diferente y puede ser interrumpido con uno o dos heteroátomos seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, o un átomo de nitrógeno el cual puede ser sustituido con un átomo de
10 hidrógeno, un grupo alquilo(C_1-C_6), un grupo alquilenilo(C_2-C_6), un grupo alquiniilo(C_2-C_6) o un grupo ciclo-alquilo(C_3-C_6), o una sal del mismo, herbicidas que comprenden el mismo como un ingrediente activo y métodos para usar el mismo.

15 La presente invención provee un derivado de haloalquilosulfonanilida útil como un herbicida excelente en las características tales como amplia aplicabilidad para una serie de especies de maleza, incluidas malezas difíciles de controlar, durabilidad del efecto y excelente
20 selectividad cosecha-maleza, especialmente útil como herbicida del arroz.

MEJOR MODO PARA REALIZAR LA INVENCION

En la definición de la fórmula general (I), los derivados haloalquilosulfonanilida de la presente
25 invención, ejemplos de "átomo de halógeno" incluyen un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo o un átomo de flúor. Ejemplos de "grupo alquilenilo(C_1-C_4)" incluyen grupos alquilenilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono tales como un grupo metileno, un
30 grupo etileno, un grupo propileno, un grupo dimetilmetileno, un grupo tetrametileno, un grupo isobutileno, un grupo dimetiletileno y un grupo hexametileno, y ejemplos de "grupo alquilo(C_1-C_6)" incluyen grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6
35 átomos de carbono tales como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo normal, un grupo isopropilo, un grupo butilo normal, un grupo isobutilo, un grupo butilo secundario, un grupo t-butilo, un grupo pentilo normal, un

grupo neopentilo, un grupo hexilo normal. Ejemplos de "grupo halo-alquilo(C_1-C_6)" incluyen grupos alquilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono sustituidos con uno o más átomos de halógeno los cuales
5 pueden ser los mismos o diferentes, y por ejemplo, incluyen un grupo trifluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo perfluoroetilo, un grupo perfluoroisopropilo, un grupo clorometilo, un grupo bromometilo, un grupo 1-bromoetilo y un grupo 2,3-dibromopropilo. Ejemplos de "grupo
10 cicloalquilo(C_3-C_6)" incluyen grupos alquilo alicíclicos o grupos alquilo alicíclicos sustituidos con grupos alquilo que tienen de 3 a 6 átomos de carbono tales como un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo, un grupo 2-metilciclopropilo y un
15 grupo 2-metilciclopentilo.

Ejemplos de "grupo alcoxi(C_1-C_6)" incluyen grupos alcoxi lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono tales como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo propoxi normal, un grupo isopropoxi, un grupo butoxi
20 normal, un grupo butoxi secundario, un grupo botoxi terciario, un grupo pentiloxi normal, un grupo isopentiloxi, un grupo neopentiloxi, un grupo hexiloxi normal. Ejemplos de "grupo halo-alcoxi(C_1-C_6)" incluyen grupos alcoxi lineales o ramificados que tienen de 1 a 6
25 átomos de carbono sustituidos con 1 ó más átomos de halógeno que pueden ser los mismos o diferentes, y por ejemplo, incluyen un grupo difluorometoxi, un grupo trifluorometoxi o un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi. Ejemplos de "grupo alcoxycarbonilo(C_1-C_6)" incluyen grupos
30 alcoxycarbonilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono tales como un grupo metoxycarbonilo, un grupo etoxycarbonilo, un grupo propoxycarbonilo normal, un grupo isopropoxycarbonilo, un grupo butoxycarbonilo normal y un grupo butoxycarbonilo terciario. Ejemplos de "grupo
35 alquiltio(C_1-C_6)" incluyen grupos alquiltio lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono tales como un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo propiltio normal, un grupo isopropiltio, un grupo butiltio

normal, un grupo butiltio secundario, un grupo butiltio terciario, un grupo pentiltio normal, un grupo isopentiltio y un grupo hexiltio normal. Ejemplos de "grupo alquilosulfinilo(C_1-C_6)" incluyen grupos alquilosulfinilo

5 lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono tales como un grupo metilsulfinilo, un grupo etilsulfinilo, un grupo propilsulfinilo normal, un grupo isopropilsulfinilo, un grupo butilsulfinilo normal, un grupo butilsulfinilo secundario, un grupo butilsulfinilo terciario,

10 un grupo pentilsulfinilo normal, un grupo isopentilsulfinilo y un grupo hexilsulfinilo normal. Ejemplos de "grupo alquilosulfonilo(C_1-C_6)" incluyen grupos alquilosulfonilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono tales como un grupo metilsulfonilo, un

15 grupo etilsulfonilo, un grupo propilsulfonilo normal, un grupo isopropilsulfonilo, un grupo butilsulfonilo normal, un grupo butilsulfonilo secundario, un grupo butilsulfonilo terciario, un grupo pentilsulfonilo normal, isopentilsulfonilo y un grupo hexilsulfonilo normal. Ejemplos de "grupo alquilo(C_1-C_6)heterocíclico" incluyen grupos en los cuales un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono está enlazado a un heterociclo.

20

Ejemplos de "grupo heterociclo" incluyen piridina, piridina-N-óxido, pirimidina, pirazina, triazina, furano,

25 tetrahydrofurano, tiofeno, tetrahidrotiofeno, tetrahidropirano, tetrahidrotiopirano, oxazol, isoxazol, oxadiazol, tiazol, isotiazol, tiadiazol, imidazol, triazol, pirazol, pirrol, pirrolidina, ftalimida o 2,3-dihidro-1,2-benzotiazol-3-ona 1,1-dióxido. Ejemplos de "grupo

30 heterocíclico" incluyen un grupo piridilo, un grupo piridina-N-óxido, un grupo pirimidinilo, un grupo pirazinilo, un grupo triazinilo, un grupo furilo, un grupo tetrahydrofurilo, un grupo tienilo, un grupo tetrahidrotienilo, un grupo tetrahidropiranilo, un grupo tetrahidrotiopiranilo, un grupo oxazolilo, un grupo isooxazolilo, un grupo oxadiazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo tiadiazolilo, un grupo

35

imidazolilo, un grupo triazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo pirrolilo o un grupo pirrolidinilo.

Ejemplos de "grupo alquenilo(C_2-C_6)" incluyen grupos alquenilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono tales como un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo isopropenilo, un grupo 2-metilo-1-propenilo, un grupo 3-metilo-1-propenilo, un grupo 2-metilo-2-propenilo, un grupo 3-metilo-2-propenilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 1-pentenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 2-metilo-2-butenilo, un grupo 1-hexenilo y un grupo 2,3-dimetilo-2-butenilo. Ejemplos de "grupo alquenilo(C_2-C_{18})" incluyen un grupo 1-heptenilo, un grupo 1-octenilo, un grupo 1-nonenilo, un grupo 1-decenilo y un grupo heptadecenilo o un grupo octadecenilo en adición a los grupos alquenilo(C_2-C_6) anteriores.

Ejemplos de "grupo alquinilo(C_2-C_6)" incluyen grupos alquenilo lineales o ramificados que tienen de 1 a 6 átomos de carbono tales como un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 3-metilo-1-propinilo, un grupo 2-metilo-3-propinilo, un grupo 1-hexinilo, un grupo 2-hexinilo, un grupo 3-hexinilo, un grupo 4-hexinilo y un grupo 5-hexinilo. Ejemplos de "grupo alquinilo(C_2-C_{18})" incluyen un grupo 1-heptinilo, un grupo 1-octinilo, un grupo 1-nonililo, un grupo 1-decinilo y un grupo heptadecinilo o un grupo octadecinilo, en adición a los grupos alquinilo(C_2-C_6) anteriores.

La expresión " (C_1-C_6) ", " (C_3-C_6) " y " (C_1-C_{18}) " representa un rango de un número de átomos de carbono en varios sustituyentes. Además, la definición anterior puede mostrarse para grupos en los que estén enlazados los anteriores sustituyentes, y por ejemplo, en el caso de "grupo alcoxi(C_1-C_6)alquilo(C_1-C_6)" representado es un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono enlazados a un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono.

Ejemplos de sales de derivados de haloalquilosulfonanilida representados por la fórmula general (I) de la presente invención incluyen sales con metales alcalinos, tales como ión sodio y ión potasio y sales con metales térreos alcalinos tales como ión calcio. Las sales también pueden estar hidratadas.

Hay casos en que un derivado de haloalquilosulfonanilida representado por la fórmula general (I) de la presente invención tenga uno o más centros asimétricos en su fórmula estructural, y por ello puede haber dos o más clases de isómeros y diastereómeros ópticos. La presente invención abarca cada uno de los isómeros ópticos y todas las mezclas en que sean contenidas en una relación subjetiva o discrecional.

De los derivados de haloalquilosulfonanilida representados por la fórmula general (I) de la presente invención, se prefiere aquellos que tienen un grupo fluoroalquilo(C₁-C₆), más preferiblemente, un grupo trifluorometilo como R¹.

Preferiblemente, R² es un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo(C₁-C₆); un grupo alcoxicarbonilo(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo alquilocarbonilo(C₁-C₁₈); un grupo haloalquilocarbonilo(C₁-C₆); un grupo alcoxicarbonilo(C₁-C₁₈); un grupo halo-alcoxicarbonilo(C₁-C₆); un grupo alcoxi(C₁-C₈)alquilo(C₁-C₆); un grupo alcoxi(C₁-C₆)alcoxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo alquilocarboniloxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); o un grupo alcoxicarboniloxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); más preferiblemente, un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo(C₁-C₆); un grupo alcoxicarbonilo(C₁-C₁₈); un grupo halo-alcoxicarbonilo(C₁-C₆); un grupo alcoxi(C₁-C₈)alquilo(C₁-C₆) o un grupo alquilocarboniloxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆).

Como R³, R⁴, R⁵ y R⁶, se prefiere especialmente un átomo de hidrógeno.

Preferiblemente, R⁷ y R⁸, que pueden ser el mismo o diferente, cada uno representa un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; un grupo alquilo(C₁-C₆); un grupo

cicloalquilo(C₃-C₆); un grupo alcoxi(C₁-C₆); un grupo haloalquilo(C₁-C₆); o un grupo alcoxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); y más preferiblemente, un átomo de hidrógeno; o un grupo alquilo(C₁-C₆).

- 5 Preferiblemente, R⁹ y R¹⁰, que pueden ser el mismo o diferente, cada uno representa un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; un grupo alquilo(C₁-C₆); un grupo cicloalquilo(C₃-C₆); un grupo alcoxi(C₁-C₆); un grupo haloalquilo(C₁-C₆); un grupo alcoxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un
- 10 grupo fenilo-alquilo(C₁-C₆); un grupo fenilo-alquilo(C₁-C₆) sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de un átomo de halógeno, un grupo alquilo(C₁-C₆), un grupo haloalquilo(C₁-C₆), un grupo alcoxi(C₁-C₆) o un grupo haloalcoxi(C₁-C₆) en
- 15 el anillo; un grupo fenilo; un grupo fenilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de un átomo de halógeno, un grupo alquilo(C₁-C₆), un grupo haloalquilo(C₁-C₆), un grupo alcoxi(C₁-C₆) o un grupo haloalcoxi(C₁-C₆) en el anillo, y
- 20 en particular preferiblemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo(C₁-C₆), un grupo cicloalquilo(C₃-C₆), un grupo haloalquilo(C₁-C₆), un grupo fenilo, o un grupo fenilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de un átomo de
- 25 halógeno, un grupo alquilo(C₁-C₆) o un grupo alcoxi(C₁-C₆). El caso de que R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ respectivamente, se enlacen a un sustituyente adyacente para formar un anillo de 3 a 7 miembros por medio de un grupo alquileno(C₁-C₄) el cual puede ser el mismo o diferente y puede interrumpirse con
- 30 uno o dos heteroátomos seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, o un átomo de nitrógeno el cual puede sustituirse con un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo(C₁-C₆), un grupo alquenilo(C₂-C₆), un grupo alquinilo(C₁-C₆) o un grupo cicloalquilo(C₃-C₆) también es
- 35 una realización preferible y más preferible es el caso de que R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ respectivamente, se enlacen a un sustituyente adyacente para formar un anillo de 3 a 7 miembros por medio de un grupo alquileno(C₁-C₄).

Se prefiere especialmente que m sea 0 (X no está sustituido). Se prefiere especialmente que n sea 1. A y W son preferiblemente átomos de oxígeno.

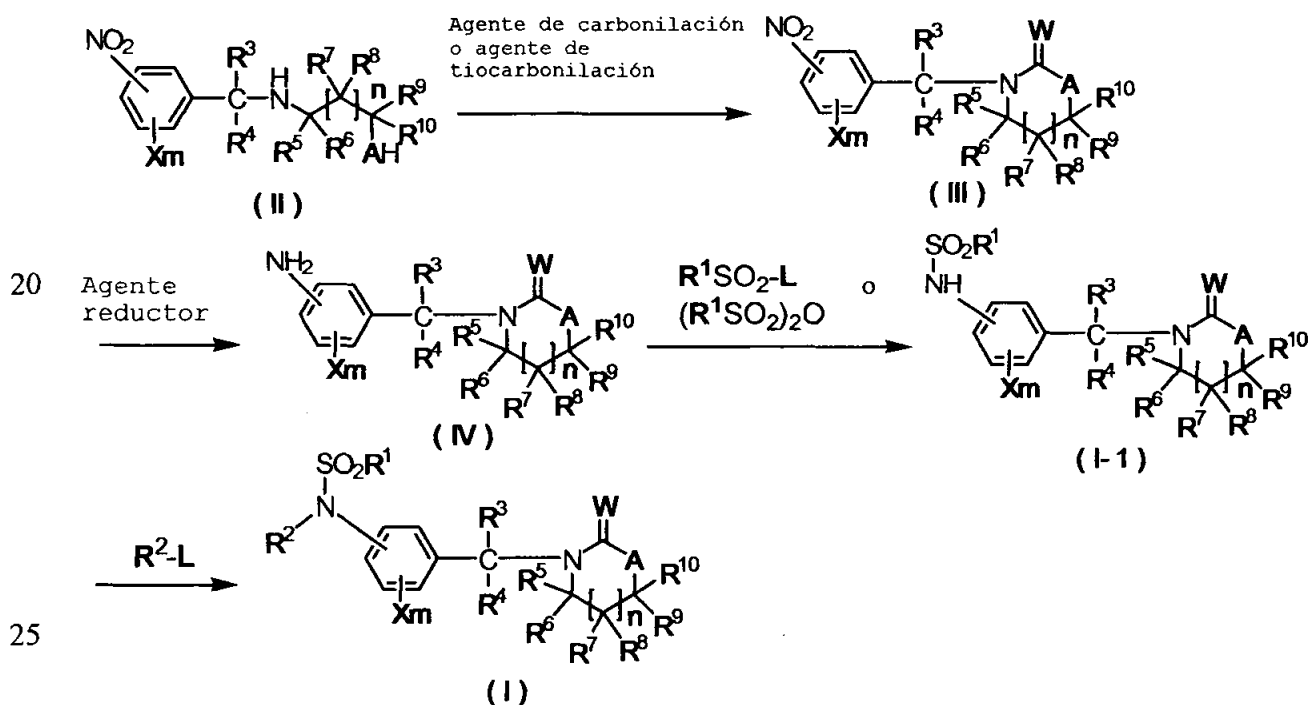
A continuación se muestran los métodos típicos de producción de los derivados de haloalquilosulfonanilida de la presente invención, pero la invención no se limita a estos métodos.

Método de producción 1

Los derivados de haloalquilosulfonanilida representados por la fórmula general (I) de la presente invención pueden producirse por el siguiente método de producción:

[Fórmula 2]

15



25

en donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , A, X, W, m y n son lo mismo que arriba, y L representa un grupo saliente tal como un átomo de halógeno.

30

El compuesto nitro representado por la fórmula general (II) puede convertirse en un compuesto nitro cíclico representado por la fórmula general (III) mediante una

reacción con un agente de carbonilación tal como fosgeno o un agente de tiocarbonilación tal como tiofosgeno en la presencia o en la ausencia de un solvente inerte. El compuesto, luego de aislarse o no aislarse, puede

5 convertirse en un derivado de anilina representado por la fórmula general (IV) reduciendo el grupo nitro y los derivados de haloalquilosulfonanilida representados por la fórmula general (I-1) (el caso de que R^2 es un átomo de hidrógeno en la fórmula general (I)) que son algunas clases

10 de los compuestos de la presente invención, pueden producirse por una reacción con un derivado de haloalquilosulfonilo representado por R^1SO_2-L o $(R^1SO_2)_2O$ luego de aislar o no aislar el derivado de anilina. Además, los derivados de haloalquilosulfonanilida representados por

15 la fórmula general (I) de la presente invención pueden producirse por una reacción con un compuesto representado por la fórmula general R^2-L luego de aislar o no aislar el derivado de haloalquilosulfonanilida representado por la fórmula general (I-1).

20 1-1) Fórmula general (II) $\rightarrow$ fórmula general (III)

Los solventes inertes que se pueden usar en esta reacción son cualquier solvente que no inhiban significativamente el progreso de esta reacción y ejemplos de ellos incluyen solventes inertes tales como éteres

25 lineales o cíclicos tales como dietil éter, tetrahidrofurano y dioxano, hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno, hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono, hidrocarburos aromáticos halogenados tales como

30 clorobenceno y diclorobenceno, y estos solventes inertes pueden usarse solos o como mezcla de dos o más clases. Ejemplos de agentes de carbonilación que se pueden usar en esta reacción incluyen fosgeno, difosgeno, trifosgeno, dietil carbonato y 1,1'-carbonilodiimidazol. Ejemplos de

35 agentes de tiocarbonilación que se pueden usar en esta reacción incluyen tiofosgeno y 1,1'-tiocarbonilodiimidazol. El agente de carbonilación o el agente de tiocarbonilación pueden usarse en una cantidad debidamente seleccionada

entre 0,3 y 10 veces mol para el compuesto nitro representado por la fórmula general (II). Las bases que se usan en esta reacción pueden ejemplificarse por ejemplo, por bases orgánicas que contengan nitrógeno, tales como trietilamina, diisopropiletilamina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno y piridina, bases inorgánicas tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de hidrógeno sódico, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidruro de sodio y sodio metálico, bases orgánicas tales como acetato de potasio y acetato de sodio, alcoholatos tales como etóxido de sodio y t-butoxido de potasio. La base puede usarse en una cantidad apropiadamente seleccionada entre 0,5 y 5 veces mol para el compuesto nitro representado por la fórmula general (II).

La temperatura de reacción puede seleccionarse entre 0 y 150°C, y el tiempo de reacción puede variar dependiendo de la escala de la reacción, la temperatura de la reacción, etc., pero puede seleccionarse apropiadamente desde varios minutos hasta aproximadamente 48 horas. Una vez se complete la reacción, se aísla el compuesto objetivo de la mezcla de la reacción que contenga el compuesto por medio de un método ordinario, y el compuesto objetivo puede producirse purificando el compuesto por el método de recristalización, método de destilación, cromatografía de columna, etc. según se requiera. El compuesto objetivo también puede usarse en la siguiente reacción sin aislar el compuesto una vez se termine de hacer esta reacción.

1-2) Fórmula general (III) → fórmula general (IV)

Los solventes inertes que se pueden usar en esta reacción pueden ejemplificarse por ejemplo, por alcoholes tales como metanol y etanol, ésteres tales como tetrahidrofurano y dioxano y agua y estos solventes inertes pueden usarse solos o como una mezcla de dos o más clases. La solución acuosa del ácido a usarse como agente reductor que se muestra abajo también puede usarse como solvente inerte. Los agentes de reducción que se pueden usar en esta reacción pueden ejemplificarse por ejemplo, por metal-ácido, metal-sal, etc. y ejemplos de metal incluyen hierro,

estaño y zinc, ejemplos de ácido incluyen ácido mineral tal como ácido clorhídrico y ácido sulfúrico, ácidos orgánicos tal como ácido acético y ejemplos de sal incluyen cloruro de estaño y cloruro de amonio. Estos también pueden usarse en combinación. El agente reductor puede usarse para el metal en una cantidad apropiadamente seleccionada entre 1 y 10 veces mol y para el ácido y sal entre 0,05 y 10 veces mol para el compuesto de nitro cíclico representado por la fórmula general (III). La temperatura de reacción puede seleccionarse entre 0 y 150°C, y el tiempo de reacción puede variar dependiendo de la escala de reacción, la temperatura de reacción, etc., pero puede seleccionarse apropiadamente entre varios minutos y 48 horas. La reacción reductora también puede hacerse en presencia de un catalizador por medio de hidrogenación catalítica y ejemplos del catalizador incluyen paladio-carbono. Una vez se termine la reacción se aísla el compuesto objetivo de la mezcla de la reacción que contenga el compuesto por medio de un método ordinario, y el compuesto objetivo puede producirse purificando el compuesto por el método de recristalización, método de destilación, cromatografía de columna, etc. según se requiera. El compuesto objetivo también puede usarse en la siguiente reacción sin aislar el compuesto una vez se termine esta reacción.

1-3) Fórmula general (IV) → fórmula general (I-1)

Los solventes inertes que se pueden usar en esta reacción son solventes que no inhiban significativamente esta reacción y ejemplos de ellos incluyen solventes inertes tales como éteres lineales o cíclicos tales como dietil éter, tetrahidrofurano y dioxano, hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno, hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono, hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno, nitrilos tales como acetonitrilo, ésteres tales como acetato de etilo, amidas tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, dimetilsulfóxido, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona y agua, y estos solventes

inertes pueden usarse solos o como una mezcla de dos o más clases. Las bases que se usan en esta reacción pueden ejemplificarse por ejemplo, por bases orgánicas que contengan nitrógeno tales como trietilamina,

5 diisopropiletilamina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno y piridina, bases inorgánicas tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de hidrógeno de sodio, hidroxido de sodio, hidroxido de potasio, hidruro de sodio y sodio metálico, bases orgánicas tales como acetato de

10 sodio y acetato de potasio, alcoholatos tales como etóxido de sodio y potasio t-butóxido. La base puede usarse en una cantidad apropiadamente seleccionada entre 0,5 y 5 veces mol para el derivado de anilina representado por la fórmula general (IV). También pueden usarse catalizadores de

15 transferencia de fase con el propósito de acelerar la reacción en esta reacción. Los catalizadores de transferencia de fase que se usan en esta reacción pueden ejemplificarse, por ejemplo, por sales de amonio

20 cuaternario tales como bromuro de tetra-n-butilamonio, bromuro de benciltrietilamonio, y éteres corona como 18-corona-6. Puesto que esta reacción es una reacción equimolar, cada reactivo puede usarse en la misma mole pero algunos de los reactivos pueden usarse de manera excesiva. La temperatura de reacción puede hacerse entre -20°C hasta

25 la temperatura de reflujo del solvente inerte que se use, y el tiempo de reacción puede variar dependiendo de la escala de reacción, la temperatura de reacción, etc. Pero puede seleccionarse de manera apropiada entre varios minutos y 48 horas. Cuando se termine la reacción, se aísla el compuesto

30 objetivo de la mezcla de la reacción que contenga el compuesto por medio de un método ordinario, y el compuesto objetivo puede producirse purificando el compuesto por el método de recristalización, método de destilación, cromatografía de columna, etc. Según se requiera. El

35 compuesto objetivo también puede usarse en la siguiente reacción sin aislar el compuesto una vez se termine de hacer esta reacción.

1-4) Fórmula general (I-1) $\rightarrow$ fórmula general (I)

Esta reacción puede hacerse luego del paso 1-3).

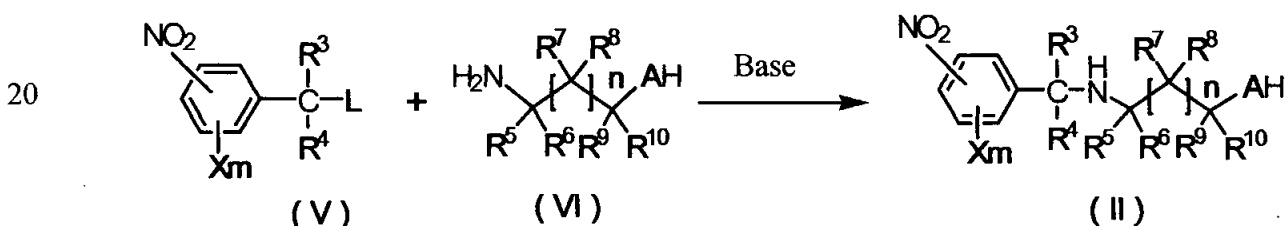
Cuando se termine la reacción, se aísla el compuesto objetivo de la mezcla de la reacción que contenga el compuesto por medio de un método ordinario, y el compuesto
5 objetivo puede producirse purificando el compuesto por el método de recristalización, método de destilación, cromatografía de columna, etc. según se requiera.

El material de inicio representado por la fórmula general (II) puede producirse siguiendo los métodos que se describen en documentos publicados (por ejemplo,
10 *TetrahedronLett.* 31, 4661 (1990), *Synth. Común.*, 24 (10), 1415 (1994), *Bull. Soc. Chim. Fr.*, 10,347 (1943)) y los métodos que se describen a continuación son método para producir los intermedios.

15

Método 1 para producir intermedios

[Fórmula 3]



(En la fórmula, R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , L, A, X, W, m
25 y n son lo mismo que arriba.

El compuesto nitro representado por la fórmula general (II) puede producirse mediante la reacción de un nitrobenzeno representado por la fórmula general (V) y una amina representada por la fórmula general (VI) en la
30 presencia o en la ausencia de una base y un solvente inerte.

Los solventes inertes que se usan en esta reacción son solventes que no inhiban significativamente el progreso de esta reacción y ejemplos de ellos incluyen solventes
35 inertes tales como éteres lineales o cíclicos tales como

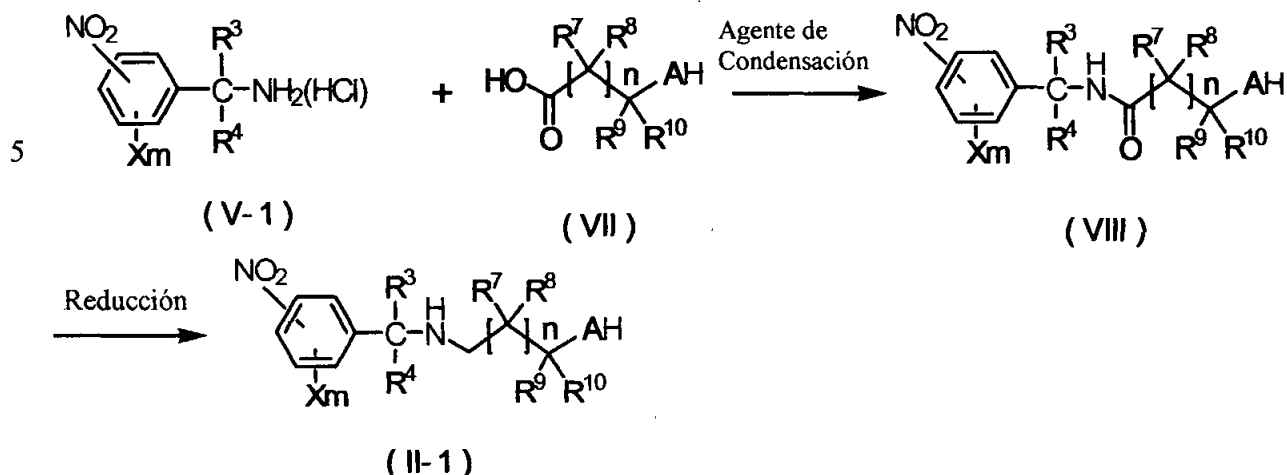
dietil éter, tetrahidrofurano y dioxano, hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno, amidas tales como dimetilformamida, N-metilacetamida, N-metilpirrolidón y hexametilfosforamida, hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono, hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno, y estos solventes inertes pueden usarse solos o como una mezcla de dos o más clases.

10 Las bases que se usan en esta reacción pueden ejemplificarse por ejemplo, por bases orgánicas que contengan nitrógeno tales como trietilamina, diisopropiletilamina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno y piridina, bases inorgánicas tales como carbonato de sodio, 15 carbonato de potasio, carbonato hidrógeno de sodio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidruro de sodio, sodio metálico, bases orgánicas tales como acetato de sodio y acetato de potasio, alcoholatos tales como etóxido de sodio y t-butoxido de potasio. La base puede usarse en una 20 cantidad seleccionada apropiadamente entre 0,5 y 5 veces mol para el nitrobenzén representado por la fórmula general (V). Debido a que esta reacción es una reacción equimolar, cada reactivo puede usarse en la misma mole pero algunos de los reactivos pueden usarse de manera excesiva.

25 La temperatura de reacción puede seleccionarse entre 0 y 150°C y el tiempo de reacción puede variar dependiendo de la escala de reacción, la temperatura de reacción, etc. pero puede seleccionarse de manera apropiada entre varios minutos y 48 horas. Cuando se termine la 30 reacción, se aísla el compuesto objetivo de la mezcla de la reacción que contenga el compuesto por medio de un método ordinario, y el compuesto objetivo puede producirse purificando el compuesto por el método de recristalización, método de destilación, cromatografía de columna, etc. según 35 se requiera. El compuesto objetivo también puede usarse en la siguiente reacción sin aislar el compuesto una vez se termine esta reacción.

Método 2 para producir intermedios

[Fórmula 4]



en donde R^3 , R^4 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , A, X, W, m y n son lo mismo que arriba.

El compuesto nitro representado por la fórmula general (II-1) puede producirse mediante la reacción de un

15 nitrobenzeno representado por la fórmula general (V-1) y un ácido carboxílico representado por la fórmula general (VII) en presencia de un agente de condensación y en la presencia o en la ausencia de una base y un solvente inerte para formar un derivado de amida representado por la fórmula

20 general (VIII) y reducir el derivado de amida luego de aislar o no aislar el derivado de amida.

2-1) Fórmula general (V-1) o fórmula general (VII) $\rightarrow$ fórmula general (VIII).

El agente de condensación para usar en esta reacción

25 puede ejemplificarse por ejemplo, por dietil fosforocianidato (DEPC), carbonilodiimidazol (CDI), 1,3-diciclohexilcarbodiimida (DCC), éster clorocarbónico, yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio y puede usarse en una cantidad seleccionada de manera apropiada del rango

30 equimolar hasta la cantidad en exceso para el nitrobenzeno o ácido carboxílico representado por la fórmula general (V-1) o la fórmula general (VII).

Las bases útiles en esta reacción incluyen bases inorgánicas o bases orgánicas y las bases inorgánicas

35 pueden ejemplificarse por ejemplo, por hidróxidos de átomos

de metal álcali, tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio, hidruros de metal álcali tales como hidruro de sodio e hidruro de potasio, sales de metal álcali de alcoholes tales como etóxido de sodio y t-butóxido de potasio, carbonatos tales como carbonato de sodio, 5 carbonato de potasio y carbonato hidrógeno de sodio, las bases orgánicas pueden ejemplificarse por ejemplo, por trietilamina, piridina y DBU, y pueden usarse en una cantidad seleccionada de manera apropiada entre la cantidad 10 equimolar hasta la cantidad en exceso para el nitrobenzeno o ácido carboxílico representado por la fórmula general (V-1) o la fórmula general (VII).

Los solventes inertes útiles en esta reacción son solventes que no inhiban el progreso de la reacción y 15 pueden ejemplificarse por ejemplo, por solventes inertes tales como hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno, hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono, hidrocarburos aromáticos halogenados tales como 20 clorobenceno y diclorobenceno, éteres lineales o cíclicos tales como dietil éter, dioxano y tetrahidrofurano, ésteres tales como acetato de etilo, amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida, dimetilsulfoxido, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, acetona y metil etil cetona y 25 estos solventes inertes pueden usarse solos o como una mezcla de dos o más clases.

Debido a que esta reacción es una reacción equimolar, cada reactivo puede usarse en la misma mole pero algunos reactivos pueden usarse de manera excesiva. La temperatura 30 de reacción puede hacerse desde el rango de la temperatura ambiente hasta temperatura de ebullición del solvente inerte a usar, y el tiempo de reacción puede variar dependiendo de la escala de reacción y la temperatura de reacción pero puede hacerse entre varios minutos y 48 35 horas.

Cuando se termine la reacción, se aísla el compuesto objetivo de la mezcla de la reacción que contenga el compuesto por medio de un método ordinario, y el compuesto

objetivo puede producirse purificando el compuesto por el método de recristalización, método de destilación, cromatografía de columna, etc. según se requiera. El compuesto objetivo también puede usarse en la siguiente
5 reacción sin aislar el compuesto una vez se termine de hacer esta reacción.

2-2) Fórmula general (VIII) → fórmula general (II-1)

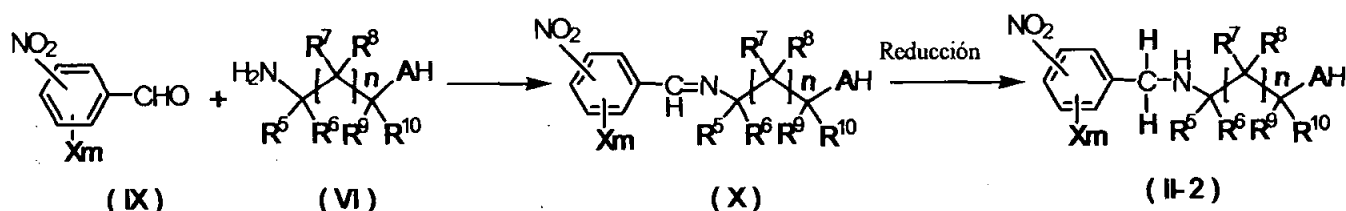
Ejemplos del agente reductor que se usa en esta reacción incluyen compuestos complejos de hidruro metálico
10 tales como hidruro de boro de sodio, hidruro de boro de litio, hidruro de boro de zinc, hidruro de aluminio de litio, hidruro de diisobutilaluminio. El agente reductor puede usarse en una cantidad seleccionada de manera apropiada entre 0,25 y 10 veces mol para el derivado de
15 amida representado por la fórmula general (VIII).

Los solventes inertes que se usan en esta reacción son solventes que no inhiban significativamente el progreso de la reacción y ejemplos de los mismos incluyen alcoholes tales como metanol y etanol, éteres tales como
20 tetrahidrofurano y dioxano, hidrocarburos halogenados tales como cloruro etileno, cloroformo y tetracloruro de carbono y agua, y estos solventes inertes pueden usarse solos o como una mezcla de dos o más clases. La temperatura de la reacción puede seleccionarse entre 0 y 150°C y el tiempo de
25 reacción puede variar dependiendo de la escala de reacción, la temperatura de reacción, etc., pero puede seleccionarse de manera apropiada entre varios minutos y 48 horas.

Cuando se termine la reacción, se aísla el compuesto objetivo de la mezcla de la reacción que contenga el
30 compuesto objetivo por medio de un método ordinario, y el compuesto objetivo puede producirse purificando el compuesto por el método de recristalización, método de destilación, cromatografía de columna, etc. según se requiera. El compuesto objetivo también puede usarse en la
35 siguiente reacción sin aislar el compuesto una vez se termine de hacer esta reacción.

Método 3 para producir intermedios

[Fórmula 5]



en donde R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , A, X, W, m y n son lo mismo
5 que arriba.

El compuesto nitro representado por la fórmula general
(II-2) puede producirse mediante la reacción de un
benzaldehído representado por la fórmula general (IX) y una
amina representada por la fórmula general (VI) en presencia
10 de un catalizador de ácido y en la presencia o en la
ausencia de un solvente inerte para formar un derivado de
imina representado por la fórmula general (X) y reducir el
derivado de imina luego de aislar o no aislar el derivado
de imina.

15 3-1) Fórmula general (IX) $\rightarrow$ fórmula general (X).

Ejemplos del catalizador de ácido que se pueden usar
en esta reacción incluyen ácidos minerales tales como ácido
clorhídrico y ácido sulfúrico, ácidos orgánicos tales como
ácido fórmico, ácido acético y ácido trifluoroacético, y
20 ácidos sulfónicos tales como ácido metanosulfónico, ácido
trifluorometanosulfónico y ácido p-toluensulfónico. El
catalizador de ácido puede usarse en una cantidad
seleccionada de manera apropiada entre 0,001 y 0,5 veces
mol para el benzaldehído representado por la fórmula
25 general (IX).

Los solventes inertes que se pueden usar en esta
reacción son solventes que no inhiban significativamente el
progreso de esta reacción y ejemplos de ellos incluyen
solventes inertes tales como éteres lineales o cíclicos
30 tales como dietil éter, tetrahidrofurano y dioxano,
hidrocarbónos aromáticos tales como benceno, tolueno y
xileno, hidrocarbónos halogenados tales como cloruro de
metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono,

hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno, y estos solventes inertes pueden usarse solos o como mezcla de dos o más clases.

La temperatura de la reacción puede seleccionarse entre 0 y 150°C y el tiempo de reacción puede variar dependiendo de la escala de reacción, la temperatura de reacción, etc., pero puede seleccionarse de manera apropiada entre varios minutos y 48 horas. Cuando se termine la reacción, se aísla el compuesto objetivo de la mezcla de la reacción que contenga el compuesto objetivo por medio de un método ordinario, y el compuesto objetivo puede producirse purificando el compuesto por el método de recristalización, método de destilación, cromatografía de columna, etc. según se requiera. El compuesto objetivo también puede usarse en la siguiente reacción sin aislar el compuesto una vez se termine de hacer esta reacción.

3-2) Fórmula general (X) → fórmula general (II-2)

Esta reacción puede hacerse siguiendo métodos de reducción general de derivados de imina (por ejemplo, referirse a la publicación *Chemical Society of Japan, "Shin Jikken Kagaku Kouza"* ("New Experimental Chemistry Series"), Vol.15, pags. 198 a 199, 1977, Maruzen Co., Ltd).

A continuación, ejemplos representativos de derivados de haloalquilosulfonanilida representados por la fórmula general (I) de la presente invención se ejemplifican en la Tabla 1 y la Tabla 2 y sus intermedios se ejemplifican en las Tablas 3 a 6, pero la presente invención no se limita a estos ejemplos. También, los datos ¹H-NMR de los compuestos que tengan "NMR" en la columna de propiedad física en la Tabla 5 se muestran en la Tabla 7. En las Tablas, "Me" representa un grupo metilo, "Et" representa un grupo etilo, "Pr" representa un grupo propilo, "Bu" representa un grupo butilo, "Pen" representa un grupo pentilo, "Ph" representa un grupo fenilo, "n-" representa un grupo normal, "i-" representa un grupo iso, "s-" representa un grupo secundario, "t-" representa un grupo terciario, "neo-"

representa un grupo neo y "c-" representa un grupo hidrocarbano alicíclico.

- El "sitio sustituido" representa un sitio sustituido con un grupo haloalquilo-sulfonilamino en el anillo de benceno en cada fórmula estructural y las propiedades físicas representan un punto de fusión ($^{\circ}\text{C}$) o índice refractivo n_D (medido a temperatura $^{\circ}\text{C}$).
- 5

[Tabla 1-1]

Fórmula General (I)

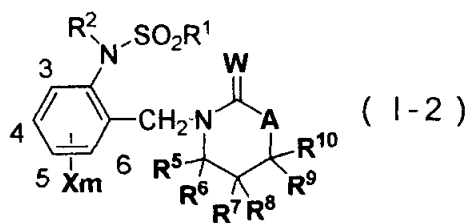


Tabla 1 (m=0, A=O, R¹=CF₃, R⁵=R⁶=H)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-1	H	H	H	H	H	O	1.4952(22)
1-2	CO ₂ Me	H	H	H	H	O	
1-3	CO ₂ Et	H	H	H	H	O	
1-4	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	H	O	1.4977(24)
1-5	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	H	O	1.4888(24)
1-6	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	H	O	1.4875(22)
1-7	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	H	O	
1-8	Me	H	H	H	H	O	
1-9	CH ₂ OMe	H	H	H	H	O	
1-10	CH ₂ OEt	H	H	H	H	O	
1-11	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	H	O	
1-12	H	H	H	H	H	S	113.3-117.2
1-13	CO ₂ Me	H	H	H	H	S	113.3-119.0
1-14	CO ₂ Et	H	H	H	H	S	142.8-144.1
1-15	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	H	S	74.9-77.4
1-16	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	H	S	1.5311(23)
1-17	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	H	S	1.5223(23)
1-18	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	H	S	
1-19	Me	H	H	H	H	S	
1-20	CH ₂ OMe	H	H	H	H	S	
1-21	CH ₂ OEt	H	H	H	H	S	
1-22	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	H	S	
1-23	H	Me	Me	H	H	O	126.5-128.3
1-24	CO ₂ Me	Me	Me	H	H	O	
1-25	CO ₂ Et	Me	Me	H	H	O	1.4882(22)
1-26	CO ₂ <i>n</i> -Pr	Me	Me	H	H	O	1.4835(21)
1-27	CO ₂ <i>n</i> -Bu	Me	Me	H	H	O	1.4873(21)
1-28	CO ₂ <i>i</i> -Bu	Me	Me	H	H	O	1.4792(23)
1-29	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	Me	Me	H	H	O	
1-30	Me	Me	Me	H	H	O	
1-31	CH ₂ OMe	Me	Me	H	H	O	
1-32	CH ₂ OEt	Me	Me	H	H	O	

[Tabla 1-2]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-33	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	Me	Me	H	H	O	129.9 1.5295(26) 1.5223(26)
1-34	H	Me	Me	H	H	S	
1-35	CO ₂ Me	Me	Me	H	H	S	
1-36	CO ₂ Et	Me	Me	H	H	S	
1-37	CO ₂ <i>n</i> -Pr	Me	Me	H	H	S	
1-38	CO ₂ <i>n</i> -Bu	Me	Me	H	H	S	
1-39	CO ₂ <i>i</i> -Bu	Me	Me	H	H	S	
1-40	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	Me	Me	H	H	S	
1-41	Me	Me	Me	H	H	S	
1-42	CH ₂ OMe	Me	Me	H	H	S	
1-43	CH ₂ OEt	Me	Me	H	H	S	1.5159(26)
1-44	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	Me	Me	H	H	S	
1-45	H	H	H	Me	Me	O	
1-46	CO ₂ Me	H	H	Me	Me	O	
1-47	CO ₂ Et	H	H	Me	Me	O	
1-48	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	Me	O	
1-49	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	Me	O	
1-50	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	Me	O	
1-51	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	Me	O	
1-52	CO ₂ (CH ₂) ₄ Me	H	H	Me	Me	O	1.4985(25) 1.4856(28) 1.4860(28) 138.4 1.4879(22) 96.1-99.5 1.4949(26) 1.4921(27)
1-53	CO ₂ CH ₂ Et(<i>n</i> -Bu)	H	H	Me	Me	O	
1-54	Me	H	H	Me	Me	O	
1-55	CH ₂ OMe	H	H	Me	Me	O	
1-56	CH ₂ OEt	H	H	Me	Me	O	
1-57	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	Me	O	
1-58	H	H	H	Me	Me	S	
1-59	CO ₂ Me	H	H	Me	Me	S	
1-60	CO ₂ Et	H	H	Me	Me	S	
1-61	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	Me	S	136.5-137.1 1.5130(26) 1.5151(22)
1-62	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	Me	S	
1-63	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	Me	S	
1-64	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	Me	S	
1-65	Me	H	H	Me	Me	S	
1-66	CH ₂ OMe	H	H	Me	Me	S	
1-67	CH ₂ OEt	H	H	Me	Me	S	
1-68	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	Me	S	
1-69	H	H	H	Me	Et	O	
1-70	CO ₂ Me	H	H	Me	Et	O	102.9-106.8 1.4906(20)
1-71	CO ₂ Et	H	H	Me	Et	O	

[Tabla 1-3]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-72	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	Et	O	72.0-75.7 1.4880(21)
1-73	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	Et	O	
1-74	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	Et	O	
1-75	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	Et	O	
1-76	Me	H	H	Me	Et	O	
1-77	CH ₂ OMe	H	H	Me	Et	O	
1-78	CH ₂ OEt	H	H	Me	Et	O	
1-79	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	Et	O	
1-80	H	H	H	Me	CF ₃	O	
1-81	CO ₂ Me	H	H	Me	CF ₃	O	103.8-105.1 131.1
1-82	CO ₂ Et	H	H	Me	CF ₃	O	
1-83	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CF ₃	O	
1-84	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CF ₃	O	105.5 39.5
1-85	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CF ₃	O	
1-86	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CF ₃	O	
1-87	Me	H	H	Me	CF ₃	O	106.7 1.4540(20)
1-88	CH ₂ OMe	H	H	Me	CF ₃	O	
1-89	CH ₂ OEt	H	H	Me	CF ₃	O	
1-90	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CF ₃	O	75.6-76.2 59.9-60.4
1-91	H	H	H	Et	CF ₃	O	
1-92	CO ₂ Me	H	H	Et	CF ₃	O	
1-93	CO ₂ Et	H	H	Et	CF ₃	O	1.4723(22) 1.4700(24)
1-94	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	CF ₃	O	
1-95	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	CF ₃	O	
1-96	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	CF ₃	O	95.3 121.9
1-97	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	CF ₃	O	
1-98	Me	H	H	Et	CF ₃	O	
1-99	CH ₂ OMe	H	H	Et	CF ₃	O	1.4892(22)
1-100	CH ₂ OEt	H	H	Et	CF ₃	O	
1-101	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	CF ₃	O	
1-102	H	H	H	Et	Et	O	1.4871(22) 1.4813(22)
1-103	CO ₂ Me	H	H	Et	Et	O	
1-104	CO ₂ Et	H	H	Et	Et	O	
1-105	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	Et	O	78
1-106	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	Et	O	
1-107	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	Et	O	
1-108	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	Et	O	
1-109	CO ₂ CH ₂ Et(<i>n</i> -Bu)	H	H	Et	Et	O	
1-110	Me	H	H	Et	Et	O	

[Tabla 1-4]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-111	CH ₂ OMe	H	H	Et	Et	O	131.8-133.2
1-112	CH ₂ OEt	H	H	Et	Et	O	
1-113	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	Et	O	
1-114	H	H	H	Et	Et	S	
1-115	CO ₂ Me	H	H	Et	Et	S	
1-116	CO ₂ Et	H	H	Et	Et	S	
1-117	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	Et	S	
1-118	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	Et	S	
1-119	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	Et	S	
1-120	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	Et	S	
1-121	Me	H	H	Et	Et	S	1.5081(22)
1-122	CH ₂ OMe	H	H	Et	Et	S	
1-123	CH ₂ OEt	H	H	Et	Et	S	
1-124	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	Et	S	
1-125	H	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-126	CO ₂ Me	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-127	CO ₂ Et	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-128	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-129	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-130	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-131	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	68.5-70.4
1-132	Me	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-133	CH ₂ OMe	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-134	CH ₂ OEt	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-135	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-136	CH ₂ OC(=O) <i>t</i> -Bu	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-137	H	H	H		(CH ₂) ₄	O	
1-138	CO ₂ Me	H	H		(CH ₂) ₄	O	
1-139	CO ₂ Et	H	H		(CH ₂) ₄	O	
1-140	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H		(CH ₂) ₄	O	
1-141	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H		(CH ₂) ₄	O	83.1
1-142	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H		(CH ₂) ₄	O	
1-143	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H		(CH ₂) ₄	O	
1-144	CO ₂ CH ₂ Et(<i>n</i> -Bu)	H	H		(CH ₂) ₄	O	
1-145	Me	H	H		(CH ₂) ₄	O	
1-146	CH ₂ OMe	H	H		(CH ₂) ₄	O	
1-147	CH ₂ OEt	H	H		(CH ₂) ₄	O	
1-148	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H		(CH ₂) ₄	O	
							123.8
							90.7-92.7
							141.9

[Tabla 1-5]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-149	H	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	O	1.5123(26)
1-150	CO ₂ Me	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	O	
1-151	CO ₂ Et	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	O	
1-152	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	O	
1-153	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	O	
1-154	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	O	1.4972(25)
1-155	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	O	1.4970(25)
1-156	Me	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	O	
1-157	CH ₂ OMe	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	O	
1-158	CH ₂ OEt	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	O	
1-159	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	O	
1-160	H	H	H	Me	Ph	O	119.1-121.8
1-161	CO ₂ Me	H	H	Me	Ph	O	
1-162	CO ₂ Et	H	H	Me	Ph	O	1.5220(21)
1-163	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	Ph	O	
1-164	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	Ph	O	
1-165	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	Ph	O	1.5121(21)
1-166	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	Ph	O	
1-167	Me	H	H	Me	Ph	O	41.9-42.1
1-168	CH ₂ OMe	H	H	Me	Ph	O	
1-169	CH ₂ OEt	H	H	Me	Ph	O	
1-170	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	Ph	O	
1-171	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	H	H	Me	Ph	O	1.5169(22)
1-172	H	H	H	Me	2-Cl-Ph	O	1.5381(25)
1-173	CO ₂ Me	H	H	Me	2-Cl-Ph	O	
1-174	CO ₂ Et	H	H	Me	2-Cl-Ph	O	1.5220(26)
1-175	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2-Cl-Ph	O	
1-176	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2-Cl-Ph	O	
1-177	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2-Cl-Ph	O	1.5180(26)
1-178	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2-Cl-Ph	O	
1-179	Me	H	H	Me	2-Cl-Ph	O	
1-180	CH ₂ OMe	H	H	Me	2-Cl-Ph	O	
1-181	CH ₂ OEt	H	H	Me	2-Cl-Ph	O	
1-182	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2-Cl-Ph	O	
1-183	H	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	127.5
1-184	CO ₂ Me	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	
1-185	CO ₂ Et	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	1.5190(26)
1-186	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	
1-187	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	

[Tabla 1-6]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-188	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	1.5198(25)
1-189	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	
1-190	Me	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	
1-191	CH ₂ OMe	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	1.5112(25)
1-192	CH ₂ OEt	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	
1-193	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	
1-194	CH ₂ OCH ₂ Ph	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	1.5389(24)
1-195	H	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	57.6-62.5
1-196	CO ₂ Me	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	
1-197	CO ₂ Et	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	1.5281(26)
1-198	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	
1-199	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	
1-200	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	
1-201	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	
1-202	Me	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	
1-203	CH ₂ OMe	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	
1-204	CH ₂ OEt	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	
1-205	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	
1-206	H	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	60.4-64.5
1-207	CO ₂ Me	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	
1-208	CO ₂ Et	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	1.5193(25)
1-209	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	
1-210	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	
1-211	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	44.3-47.8
1-212	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	
1-213	Me	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	
1-214	CH ₂ OMe	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	
1-215	CH ₂ OEt	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	
1-216	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	
1-217	H	H	H	Ph	Ph	O	170.5
1-218	CO ₂ Me	H	H	Ph	Ph	O	
1-219	CO ₂ Et	H	H	Ph	Ph	O	1.5415(27)
1-220	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Ph	Ph	O	
1-221	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Ph	Ph	O	
1-222	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Ph	Ph	O	
1-223	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Ph	Ph	O	
1-224	Me	H	H	Ph	Ph	O	158.9
1-225	CH ₂ OMe	H	H	Ph	Ph	O	
1-226	CH ₂ OEt	H	H	Ph	Ph	O	

[Tabla 1-7]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-227	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Ph	Ph	O	185.4 1.4909(26)
1-228	H	H	H	CF ₃	Ph	O	
1-229	CO ₂ Me	H	H	CF ₃	Ph	O	
1-230	CO ₂ Et	H	H	CF ₃	Ph	O	
1-231	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	CF ₃	Ph	O	
1-232	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	CF ₃	Ph	O	
1-233	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	CF ₃	Ph	O	
1-234	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	CF ₃	Ph	O	
1-235	Me	H	H	CF ₃	Ph	O	
1-236	CH ₂ OMe	H	H	CF ₃	Ph	O	
1-237	CH ₂ OEt	H	H	CF ₃	Ph	O	
1-238	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	CF ₃	Ph	O	
1-239	H	H	H	H	Ph	O	
1-240	CO ₂ Me	H	H	H	Ph	O	152 143.9 163.7 153.2 115.6 1.5349(26) 145.5 169.7 1.5765(26)
1-241	CO ₂ Et	H	H	H	Ph	O	
1-242	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	Ph	O	
1-243	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	Ph	O	
1-244	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	Ph	O	
1-245	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	Ph	O	
1-246	Me	H	H	H	Ph	O	
1-247	CH ₂ OMe	H	H	H	Ph	O	
1-248	CH ₂ OEt	H	H	H	Ph	O	
1-249	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	Ph	O	
1-250	H	H	H	H	2-F-Ph	O	
1-251	CO ₂ Me	H	H	H	2-F-Ph	O	
1-252	CO ₂ Et	H	H	H	2-F-Ph	O	
1-253	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	2-F-Ph	O	
1-254	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	2-F-Ph	O	132.9 1.5119(23)
1-255	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	2-F-Ph	O	
1-256	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	2-F-Ph	O	
1-257	Me	H	H	H	2-F-Ph	O	
1-258	CH ₂ OMe	H	H	H	2-F-Ph	O	
1-259	CH ₂ OEt	H	H	H	2-F-Ph	O	
1-260	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	2-F-Ph	O	
1-261	H	Me	Me	H	Ph	O	
1-262	CO ₂ Me	Me	Me	H	Ph	O	
1-263	CO ₂ Et	Me	Me	H	Ph	O	
1-264	CO ₂ <i>n</i> -Pr	Me	Me	H	Ph	O	
1-265	CO ₂ <i>n</i> -Bu	Me	Me	H	Ph	O	

[Tabla 1-8]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-266	CO ₂ <i>i</i> -Bu	Me	Me	H	Ph	O	1.5240(23)
1-267	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	Me	Me	H	Ph	O	
1-268	Me	Me	Me	H	Ph	O	
1-269	CH ₂ OMe	Me	Me	H	Ph	O	
1-270	CH ₂ OEt	Me	Me	H	Ph	O	1.5092(23)
1-271	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	Me	Me	H	Ph	O	
1-272	H	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-273	CO ₂ Me	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-274	CO ₂ Et	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	O	1.5181(20)
1-275	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-276	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-277	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-278	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	O	1.5155(21)
1-279	Me	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-280	CH ₂ OMe	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-281	CH ₂ OEt	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-282	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	O	1.5407(22)
1-283	H	H	H	H	2-Me-Ph	O	
1-284	CO ₂ Me	H	H	H	2-Me-Ph	O	
1-285	CO ₂ Et	H	H	H	2-Me-Ph	O	
1-286	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	2-Me-Ph	O	1.5160(21)
1-287	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	2-Me-Ph	O	
1-288	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	2-Me-Ph	O	
1-289	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	2-Me-Ph	O	
1-290	Me	H	H	H	2-Me-Ph	O	1.5179(21)
1-291	CH ₂ OMe	H	H	H	2-Me-Ph	O	
1-292	CH ₂ OEt	H	H	H	2-Me-Ph	O	
1-293	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	2-Me-Ph	O	
1-294	H	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	O	181.2
1-295	CO ₂ Me	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	O	
1-296	CO ₂ Et	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	O	
1-297	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	O	
1-298	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	O	1.4997(18)
1-299	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	O	
1-300	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	O	
1-301	Me	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	O	
1-302	CH ₂ OMe	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	O	1.5017(18)
1-303	CH ₂ OEt	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	O	
1-304	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	O	

[Tabla 1-9]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-305	H	H	H	H	2-Cl-Ph	O	1.5351(23)
1-306	CO ₂ Me	H	H	H	2-Cl-Ph	O	
1-307	CO ₂ Et	H	H	H	2-Cl-Ph	O	133.0-135.5
1-308	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	2-Cl-Ph	O	
1-309	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	2-Cl-Ph	O	
1-310	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	2-Cl-Ph	O	
1-311	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	2-Cl-Ph	O	
1-312	Me	H	H	H	2-Cl-Ph	O	1.5256(22)
1-313	CH ₂ OMe	H	H	H	2-Cl-Ph	O	
1-314	CH ₂ OEt	H	H	H	2-Cl-Ph	O	1.5263(22)
1-315	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	2-Cl-Ph	O	
1-316	H	H	H	Et	Ph	O	120.8-122.4
1-317	CO ₂ Me	H	H	Et	Ph	O	1.5229(21)
1-318	CO ₂ Et	H	H	Et	Ph	O	1.5249(22)
1-319	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	Ph	O	
1-320	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	Ph	O	
1-321	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	Ph	O	1.5192(22)
1-322	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	Ph	O	
1-323	Me	H	H	Et	Ph	O	51.0-52.0
1-324	CH ₂ OMe	H	H	Et	Ph	O	
1-325	CH ₂ OEt	H	H	Et	Ph	O	
1-326	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	Ph	O	
1-327	H	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	156.4
1-328	CO ₂ Me	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	
1-329	CO ₂ Et	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	102.2-104.0
1-330	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	
1-331	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	
1-332	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	104.2
1-333	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	
1-334	Me	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	
1-335	CH ₂ OMe	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	
1-336	CH ₂ OEt	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	
1-337	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	
1-338	H	H	H	CF ₃	CF ₃	O	113.7
1-339	CO ₂ Me	H	H	CF ₃	CF ₃	O	103.8-105.1
1-340	CO ₂ Et	H	H	CF ₃	CF ₃	O	102.4
1-341	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	CF ₃	CF ₃	O	
1-342	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	CF ₃	CF ₃	O	
1-343	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	CF ₃	CF ₃	O	1.4542(22)

[Tabla 1-10]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-344	CO ₂ CH ₂ t-Bu	H	H	CF ₃	CF ₃	O	48.0 1.4992(21) 154.0-156.0
1-345	Me	H	H	CF ₃	CF ₃	O	
1-346	CH ₂ OMe	H	H	CF ₃	CF ₃	O	
1-347	CH ₂ OEt	H	H	CF ₃	CF ₃	O	
1-348	CH ₂ Oi-Pr	H	H	CF ₃	CF ₃	O	
1-349	H	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-350	CO ₂ Me	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-351	CO ₂ Et	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-352	CO ₂ n-Pr	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-353	CO ₂ n-Bu	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-354	CO ₂ i-Bu	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	187.4 68.6-72.5 1.5252(22)
1-355	CO ₂ CH ₂ t-Bu	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-356	Me	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-357	CH ₂ OMe	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-358	CH ₂ OEt	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-359	CH ₂ Oi-Pr	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-360	H	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	
1-361	CO ₂ Me	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	
1-362	CO ₂ Et	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	
1-363	CO ₂ n-Pr	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	1.5229(22) 84.0-86.3 79.9-81.5
1-364	CO ₂ n-Bu	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	
1-365	CO ₂ i-Bu	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	
1-366	CO ₂ CH ₂ t-Bu	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	
1-367	Me	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	
1-368	CH ₂ OMe	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	
1-369	CH ₂ OEt	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	
1-370	CH ₂ Oi-Pr	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	
1-371	H	H	H	Me	1-Me-1-c-Pr	O	
1-372	CO ₂ Me	H	H	Me	1-Me-1-c-Pr	O	1.4951(23) 1.5010(23)
1-373	CO ₂ Et	H	H	Me	1-Me-1-c-Pr	O	
1-374	CO ₂ n-Pr	H	H	Me	1-Me-1-c-Pr	O	
1-375	CO ₂ n-Bu	H	H	Me	1-Me-1-c-Pr	O	
1-376	CO ₂ i-Bu	H	H	Me	1-Me-1-c-Pr	O	
1-377	CO ₂ CH ₂ t-Bu	H	H	Me	1-Me-1-c-Pr	O	
1-378	Me	H	H	Me	1-Me-1-c-Pr	O	
1-379	CH ₂ OMe	H	H	Me	1-Me-1-c-Pr	O	
1-380	CH ₂ OEt	H	H	Me	1-Me-1-c-Pr	O	
1-381	CH ₂ Oi-Pr	H	H	Me	1-Me-1-c-Pr	O	136.8-137.2
1-382	H	H	H	Me	c-Bu	O	

[Tabla 1-11]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-383	CO ₂ Me	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	1.5001(21)
1-384	CO ₂ Et	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	
1-385	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	
1-386	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	
1-387	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	80.3-81.3
1-388	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	94.6-95.8
1-389	Me	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	1.4995(25)
1-390	CH ₂ OMe	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	
1-391	CH ₂ OEt	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	
1-392	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	
1-393	H	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	1.5005(26)
1-394	CO ₂ Me	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	1.4951(26)
1-395	CO ₂ Et	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	1.5123(24)
1-396	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	
1-397	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	
1-398	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	
1-399	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	1.5250(24)
1-400	Me	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	
1-401	CH ₂ OMe	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	
1-402	CH ₂ OEt	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	
1-403	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	1.4799(20)
1-404	H	H	H	Me	2-Me-Ph	O	
1-405	CO ₂ Me	H	H	Me	2-Me-Ph	O	
1-406	CO ₂ Et	H	H	Me	2-Me-Ph	O	
1-407	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2-Me-Ph	O	1.4845(20)
1-408	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2-Me-Ph	O	
1-409	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2-Me-Ph	O	
1-410	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2-Me-Ph	O	
1-411	Me	H	H	Me	2-Me-Ph	O	123.8-124.7
1-412	CH ₂ OMe	H	H	Me	2-Me-Ph	O	
1-413	CH ₂ OEt	H	H	Me	2-Me-Ph	O	
1-414	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2-Me-Ph	O	
1-415	CO ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	H	H	Et	CF ₃	O	1.4916(24)
1-416	CO ₂ CH ₂ CCl ₃	H	H	Et	CF ₃	O	1.4916(24)
1-417	H	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	
1-418	CO ₂ Me	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	
1-419	CO ₂ Et	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	
1-420	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	1.4916(24)
1-421	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	

[Tabla 1-12]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-422	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	1.4904(24)
1-423	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	1.4829(24)
1-424	Me	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	
1-425	CH ₂ OMe	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	
1-426	CH ₂ OEt	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	
1-427	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	
1-428	H	H	H	Me	2-F-Ph	O	1.5212(27)
1-429	CO ₂ Me	H	H	Me	2-F-Ph	O	1.5051(26)
1-430	CO ₂ Et	H	H	Me	2-F-Ph	O	1.4950(26)
1-431	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2-F-Ph	O	
1-432	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2-F-Ph	O	
1-433	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2-F-Ph	O	
1-434	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2-F-Ph	O	
1-435	Me	H	H	Me	2-F-Ph	O	
1-436	CH ₂ OMe	H	H	Me	2-F-Ph	O	
1-437	CH ₂ OEt	H	H	Me	2-F-Ph	O	
1-438	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2-F-Ph	O	
1-439	H	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	1.4982(27)
1-440	CO ₂ Me	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	1.5005(25)
1-441	CO ₂ Et	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	1.4871(25)
1-442	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-443	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-444	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-445	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-446	Me	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-447	CH ₂ OMe	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-448	CH ₂ OEt	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-449	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-450	H	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	163.7-164.2
1-451	CO ₂ Me	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	
1-452	CO ₂ Et	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	1.4873(24)
1-453	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	
1-454	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	
1-455	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	1.4842(24)
1-456	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	1.4821(24)
1-457	Me	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	
1-458	CH ₂ OMe	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	
1-459	CH ₂ OEt	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	
1-460	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	

[Tabla 1-13]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-461	H	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	143.1
1-462	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	
1-463	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	1.4962(23)
1-464	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	
1-465	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	
1-466	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	
1-467	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	
1-468	Me	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	
1-469	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	
1-470	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	
1-471	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	
1-472	H	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	1.5348(25)
1-473	CO ₂ Me	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	1.5275(25)
1-474	CO ₂ Et	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	1.5330(25)
1-475	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	
1-476	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	
1-477	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	
1-478	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	
1-479	Me	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	
1-480	CH ₂ OMe	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	
1-481	CH ₂ OEt	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	
1-482	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	
1-483	H	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	183.6
1-484	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-485	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	1.5270(25)
1-486	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-487	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-488	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-489	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-490	Me	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-491	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-492	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-493	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-494	H	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	114.1-115.0
1-495	CO ₂ Me	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	
1-496	CO ₂ Et	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	1.4905(25)
1-497	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	
1-498	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	
1-499	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	1.4840(25)

[Tabla 1-14]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-500	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	1.5069(25)
1-501	CO ₂ Ph	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	
1-502	Me	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	
1-503	CH ₂ OMe	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	
1-504	CH ₂ OEt	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	
1-505	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	1.5187(26)
1-506	CO ₂ Ph	H	H	Me	Me	O	
1-507	H	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	O	
1-508	CO ₂ Me	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	O	
1-509	CO ₂ Et	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	O	
1-510	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	O	1.4820(25)
1-511	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	O	
1-512	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	O	
1-513	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	O	
1-514	CO ₂ Ph	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	O	
1-515	Me	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	O	90.9-92.6
1-516	CH ₂ OMe	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	O	
1-517	CH ₂ OEt	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	O	
1-518	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	O	
1-519	H	H	H	Me	3-Cl-Ph	O	
1-520	CO ₂ Me	H	H	Me	3-Cl-Ph	O	1.5275(24) 52
1-521	CO ₂ Et	H	H	Me	3-Cl-Ph	O	
1-522	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3-Cl-Ph	O	
1-523	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3-Cl-Ph	O	
1-524	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3-Cl-Ph	O	
1-525	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3-Cl-Ph	O	1.5225(25)
1-526	CO ₂ Ph	H	H	Me	3-Cl-Ph	O	
1-527	Me	H	H	Me	3-Cl-Ph	O	
1-528	CH ₂ OMe	H	H	Me	3-Cl-Ph	O	
1-529	CH ₂ OEt	H	H	Me	3-Cl-Ph	O	
1-530	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3-Cl-Ph	O	147.0-149.4
1-531	H	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	O	
1-532	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	O	
1-533	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	O	
1-534	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	O	
1-535	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	O	1.5086(26)
1-536	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	O	
1-537	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	O	
1-538	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	O	

[Tabla 1-15]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-539	Me	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	O	127.7-131.1
1-540	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	O	
1-541	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	O	
1-542	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	O	
1-543	H	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	O	
1-544	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	O	
1-545	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	O	
1-546	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	O	
1-547	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	O	
1-548	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	O	
1-549	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	O	1.5252(24)
1-550	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	O	
1-551	Me	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	O	
1-552	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	O	
1-553	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	O	
1-554	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	O	
1-555	H	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	O	
1-556	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	O	
1-557	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	O	
1-558	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	O	125.0-126.8
1-559	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	O	
1-560	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	O	
1-561	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	O	
1-562	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	O	
1-563	Me	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	O	
1-564	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	O	
1-565	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	O	
1-566	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	O	
1-567	H	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	O	1.5012(26)
1-568	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	O	
1-569	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	O	
1-570	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	O	
1-571	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	O	
1-572	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	O	
1-573	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	O	
1-574	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	O	
1-575	Me	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	O	
1-576	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	O	1.4994(26)
1-577	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	O	

[Tabla 1-16]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-578	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	O	190.2-193.0
1-579	H	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-580	CO ₂ Me	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-581	CO ₂ Et	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-582	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-583	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-584	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-585	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-586	CO ₂ Ph	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-587	Me	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-588	CH ₂ OMe	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-589	CH ₂ OEt	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-590	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-591	H	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	
1-592	CO ₂ Me	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	
1-593	CO ₂ Et	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	1.4778(24)
1-594	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	
1-595	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	
1-596	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	1.4804(24)
1-597	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	
1-598	CO ₂ Ph	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	
1-599	Me	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	104.9
1-600	CH ₂ OMe	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	
1-601	CH ₂ OEt	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	
1-602	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	
1-603	H	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	
1-604	CO ₂ Me	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	
1-605	CO ₂ Et	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	
1-606	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	
1-607	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	
1-608	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	
1-609	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	
1-610	CO ₂ Ph	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	
1-611	Me	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	
1-612	CH ₂ OMe	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	
1-613	CH ₂ OEt	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	
1-614	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	98.1-102.4
1-615	H	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	O	
1-616	CO ₂ Me	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	O	

[Tabla 1-17]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-617	CO ₂ Et	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	O	1.4761(24)
1-618	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	O	
1-619	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	O	
1-620	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	O	1.4738(24)
1-621	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	O	
1-622	CO ₂ Ph	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	O	
1-623	Me	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	O	
1-624	CH ₂ OMe	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	O	
1-625	CH ₂ OEt	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	O	
1-626	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	O	
1-627	H	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	O	105.9-108.2
1-628	CO ₂ Me	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	O	
1-629	CO ₂ Et	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	O	1.4839(28)
1-630	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	O	
1-631	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	O	
1-632	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	O	1.4851(28)
1-633	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	O	
1-634	CO ₂ Ph	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	O	
1-635	Me	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	O	
1-636	CH ₂ OMe	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	O	
1-637	CH ₂ OEt	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	O	
1-638	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	O	
1-639	H	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	O	79.5-82.0
1-640	CO ₂ Me	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	O	
1-641	CO ₂ Et	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	O	1.4831(26)
1-642	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	O	
1-643	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	O	
1-644	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	O	1.4746(26)
1-645	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	O	
1-646	CO ₂ Ph	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	O	
1-647	Me	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	O	
1-648	CH ₂ OMe	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	O	
1-649	CH ₂ OEt	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	O	
1-650	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	O	
1-651	H	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	O	89.7-92.4
1-652	CO ₂ Me	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	O	
1-653	CO ₂ Et	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	O	1.4829(26)
1-654	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	O	
1-655	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	O	

[Tabla 1-18]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-656	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	O	1.4822(26)
1-657	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	O	
1-658	CO ₂ Ph	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	O	
1-659	Me	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	O	
1-660	CH ₂ OMe	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	O	
1-661	CH ₂ OEt	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	O	
1-662	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	O	
1-663	H	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	O	1.4752(26)
1-664	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	O	
1-665	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	O	1.4642(26)
1-666	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	O	
1-667	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	O	1.4669(26)
1-668	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	O	
1-669	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	O	
1-670	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	O	
1-671	Me	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	O	
1-672	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	O	
1-673	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	O	
1-674	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	O	
1-675	H	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	O	
1-676	CO ₂ Me	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	O	
1-677	CO ₂ Et	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	O	
1-678	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	O	
1-679	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	O	
1-680	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	O	
1-681	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	O	
1-682	CO ₂ Ph	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	O	
1-683	Me	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	O	
1-684	CH ₂ OMe	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	O	
1-685	CH ₂ OEt	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	O	
1-686	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	O	
1-687	H	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	O	
1-688	CO ₂ Me	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	O	
1-689	CO ₂ Et	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	O	
1-690	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	O	
1-691	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	O	
1-692	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	O	
1-693	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	O	
1-694	CO ₂ Ph	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	O	

[Tabla 1-19]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-695	Me	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	O	134.4-134.8
1-696	CH ₂ OMe	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	O	
1-697	CH ₂ OEt	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	O	
1-698	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	O	
1-699	H	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	O	
1-700	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	O	
1-701	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	O	
1-702	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	O	
1-703	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	O	
1-704	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	O	
1-705	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	O	1.5018(27)
1-706	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	O	
1-707	Me	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	O	
1-708	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	O	
1-709	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	O	
1-710	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	O	
1-711	H	H	H	Me	3-F-Ph	O	
1-712	CO ₂ Me	H	H	Me	3-F-Ph	O	
1-713	CO ₂ Et	H	H	Me	3-F-Ph	O	
1-714	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3-F-Ph	O	116.0-117.0
1-715	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3-F-Ph	O	
1-716	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3-F-Ph	O	
1-717	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3-F-Ph	O	
1-718	CO ₂ Ph	H	H	Me	3-F-Ph	O	
1-719	Me	H	H	Me	3-F-Ph	O	
1-720	CH ₂ OMe	H	H	Me	3-F-Ph	O	
1-721	CH ₂ OEt	H	H	Me	3-F-Ph	O	
1-722	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3-F-Ph	O	
1-723	H	H	H	Me	4-F-Ph	O	118.5
1-724	CO ₂ Me	H	H	Me	4-F-Ph	O	
1-725	CO ₂ Et	H	H	Me	4-F-Ph	O	
1-726	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	4-F-Ph	O	
1-727	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	4-F-Ph	O	
1-728	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	4-F-Ph	O	
1-729	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	4-F-Ph	O	
1-730	CO ₂ Ph	H	H	Me	4-F-Ph	O	
1-731	Me	H	H	Me	4-F-Ph	O	
1-732	CH ₂ OMe	H	H	Me	4-F-Ph	O	1.5082(22) 1.5005(22)
1-733	CH ₂ OEt	H	H	Me	4-F-Ph	O	

[Tabla 1-20]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-734	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	4-F-Ph	O	1.5165(25) 1.4939(25) 1.4950(26)
1-735	H	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	
1-736	CO ₂ Me	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	
1-737	CO ₂ Et	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	
1-738	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	
1-739	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	
1-740	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	
1-741	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	
1-742	CO ₂ Ph	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	
1-743	Me	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	
1-744	CH ₂ OMe	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	
1-745	CH ₂ OEt	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	
1-746	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	
1-747	H	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	
1-748	CO ₂ Me	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	
1-749	CO ₂ Et	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	
1-750	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	
1-751	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	
1-752	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	
1-753	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	
1-754	CO ₂ Ph	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	
1-755	Me	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	
1-756	CH ₂ OMe	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	136.2 1.4875(24) 1.4962(24)
1-757	CH ₂ OEt	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	
1-758	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	
1-759	H	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-760	CO ₂ Me	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-761	CO ₂ Et	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-762	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-763	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-764	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-765	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-766	CO ₂ Ph	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-767	Me	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-768	CH ₂ OMe	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-769	CH ₂ OEt	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-770	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-771	H	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	
1-772	CO ₂ Me	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	

[Tabla 1-21]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-773	CO ₂ Et	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	1.5172(21)
1-774	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	
1-775	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	
1-776	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	
1-777	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	
1-778	CO ₂ Ph	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	
1-779	Me	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	
1-780	CH ₂ OMe	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	
1-781	CH ₂ OEt	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	
1-782	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	
1-783	H	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-784	CO ₂ Me	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-785	CO ₂ Et	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-786	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-787	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-788	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-789	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-790	CO ₂ Ph	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-791	Me	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-792	CH ₂ OMe	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-793	CH ₂ OEt	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-794	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-795	H	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-796	CO ₂ Me	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-797	CO ₂ Et	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-798	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-799	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-800	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-801	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-802	CO ₂ Ph	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-803	Me	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-804	CH ₂ OMe	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-805	CH ₂ OEt	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-806	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-807	H	H	H	Et	3-F-Ph	O	
1-808	CO ₂ Me	H	H	Et	3-F-Ph	O	
1-809	CO ₂ Et	H	H	Et	3-F-Ph	O	
1-810	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	3-F-Ph	O	
1-811	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	3-F-Ph	O	

[Tabla 1-22]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-812	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	3-F-Ph	O	141.0-142.0 1.5150(27) 1.4905(27)
1-813	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	3-F-Ph	O	
1-814	CO ₂ Ph	H	H	Et	3-F-Ph	O	
1-815	Me	H	H	Et	3-F-Ph	O	
1-816	CH ₂ OMe	H	H	Et	3-F-Ph	O	
1-817	CH ₂ OEt	H	H	Et	3-F-Ph	O	
1-818	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	3-F-Ph	O	
1-819	H	H	H	Et	4-F-Ph	O	
1-820	CO ₂ Me	H	H	Et	4-F-Ph	O	
1-821	CO ₂ Et	H	H	Et	4-F-Ph	O	
1-822	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	4-F-Ph	O	
1-823	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	4-F-Ph	O	
1-824	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	4-F-Ph	O	
1-825	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	4-F-Ph	O	
1-826	CO ₂ Ph	H	H	Et	4-F-Ph	O	
1-827	Me	H	H	Et	4-F-Ph	O	
1-828	CH ₂ OMe	H	H	Et	4-F-Ph	O	
1-829	CH ₂ OEt	H	H	Et	4-F-Ph	O	
1-830	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	4-F-Ph	O	
1-831	H	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-832	CO ₂ Me	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-833	CO ₂ Et	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-834	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-835	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-836	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-837	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-838	CO ₂ Ph	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-839	Me	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-840	CH ₂ OMe	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-841	CH ₂ OEt	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-842	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-843	H	H	H	Me	2-Br-Ph	O	1.5350(27)
1-844	CO ₂ Me	H	H	Me	2-Br-Ph	O	1.5370(26)
1-845	CO ₂ Et	H	H	Me	2-Br-Ph	O	1.5239(27)
1-846	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2-Br-Ph	O	
1-847	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2-Br-Ph	O	
1-848	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2-Br-Ph	O	
1-849	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2-Br-Ph	O	
1-850	CO ₂ Ph	H	H	Me	2-Br-Ph	O	

[Tabla 1-23]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-851	Me	H	H	Me	2-Br-Ph	O	94.1-96.7 1.5485(25) 1.5402(25)
1-852	CH ₂ OMe	H	H	Me	2-Br-Ph	O	
1-853	CH ₂ OEt	H	H	Me	2-Br-Ph	O	
1-854	CH ₂ Oi-Pr	H	H	Me	2-Br-Ph	O	
1-855	H	H	H	Me	3-Me-Ph	O	
1-856	CO ₂ Me	H	H	Me	3-Me-Ph	O	
1-857	CO ₂ Et	H	H	Me	3-Me-Ph	O	
1-858	CO ₂ n-Pr	H	H	Me	3-Me-Ph	O	
1-859	CO ₂ n-Bu	H	H	Me	3-Me-Ph	O	
1-860	CO ₂ i-Bu	H	H	Me	3-Me-Ph	O	
1-861	CO ₂ CH ₂ t-Bu	H	H	Me	3-Me-Ph	O	135.2-137.9 1.5152(25) 1.5075(26)
1-862	CO ₂ Ph	H	H	Me	3-Me-Ph	O	
1-863	Me	H	H	Me	3-Me-Ph	O	
1-864	CH ₂ OMe	H	H	Me	3-Me-Ph	O	
1-865	CH ₂ OEt	H	H	Me	3-Me-Ph	O	
1-866	CH ₂ Oi-Pr	H	H	Me	3-Me-Ph	O	
1-867	H	H	H	Me	4-Me-Ph	O	
1-868	CO ₂ Me	H	H	Me	4-Me-Ph	O	
1-869	CO ₂ Et	H	H	Me	4-Me-Ph	O	
1-870	CO ₂ n-Pr	H	H	Me	4-Me-Ph	O	
1-871	CO ₂ n-Bu	H	H	Me	4-Me-Ph	O	132.9-133.8 1.5174(27)
1-872	CO ₂ i-Bu	H	H	Me	4-Me-Ph	O	
1-873	CO ₂ CH ₂ t-Bu	H	H	Me	4-Me-Ph	O	
1-874	CO ₂ Ph	H	H	Me	4-Me-Ph	O	
1-875	Me	H	H	Me	4-Me-Ph	O	
1-876	CH ₂ OMe	H	H	Me	4-Me-Ph	O	
1-877	CH ₂ OEt	H	H	Me	4-Me-Ph	O	
1-878	CH ₂ Oi-Pr	H	H	Me	4-Me-Ph	O	
1-879	H	H	H	Me	3-MeO-Ph	O	
1-880	CO ₂ Me	H	H	Me	3-MeO-Ph	O	
1-881	CO ₂ Et	H	H	Me	3-MeO-Ph	O	1.5174(27)
1-882	CO ₂ n-Pr	H	H	Me	3-MeO-Ph	O	
1-883	CO ₂ n-Bu	H	H	Me	3-MeO-Ph	O	
1-884	CO ₂ i-Bu	H	H	Me	3-MeO-Ph	O	
1-885	CO ₂ CH ₂ t-Bu	H	H	Me	3-MeO-Ph	O	
1-886	CO ₂ Ph	H	H	Me	3-MeO-Ph	O	
1-887	Me	H	H	Me	3-MeO-Ph	O	
1-888	CH ₂ OMe	H	H	Me	3-MeO-Ph	O	
1-889	CH ₂ OEt	H	H	Me	3-MeO-Ph	O	

[Tabla 1-24]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-890	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3-MeO-Ph	O	119.9-122.0 1.5065(25)
1-891	H	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	
1-892	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	
1-893	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	
1-894	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	
1-895	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	
1-896	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	
1-897	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	
1-898	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	
1-899	Me	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	
1-900	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	109 1.5028(25)
1-901	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	
1-902	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	
1-903	H	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	
1-904	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	
1-905	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	
1-906	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	
1-907	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	
1-908	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	
1-909	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	
1-910	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	116.6-118.5 1.5162(25)
1-911	Me	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	
1-912	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	
1-913	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	
1-914	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	
1-915	H	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	
1-916	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	
1-917	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	
1-918	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	
1-919	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	
1-920	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	136.7
1-921	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	
1-922	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	
1-923	Me	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	
1-924	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	
1-925	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	
1-926	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	
1-927	H	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	
1-928	CO ₂ Me	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	

[Tabla 1-25]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-929	CO ₂ Et	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	69.6-73.8
1-930	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	
1-931	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	
1-932	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	94.4-95.7
1-933	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	
1-934	CO ₂ Ph	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	
1-935	Me	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	
1-936	CH ₂ OMe	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	
1-937	CH ₂ OEt	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	
1-938	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	
1-939	H	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	111.6-112.3
1-940	CO ₂ Me	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	
1-941	CO ₂ Et	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	1.4821(25)
1-942	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	
1-943	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	
1-944	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	66.9
1-945	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	
1-946	CO ₂ Ph	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	
1-947	Me	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	
1-948	CH ₂ OMe	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	
1-949	CH ₂ OEt	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	
1-950	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	
1-951	H	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	1.5045(24)
1-952	CO ₂ Me	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	1.4917(25)
1-953	CO ₂ Et	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	1.4923(25)
1-954	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	
1-955	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	
1-956	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	
1-957	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	
1-958	CO ₂ Ph	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	
1-959	Me	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	
1-960	CH ₂ OMe	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	
1-961	CH ₂ OEt	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	
1-962	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	
1-963	H	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	133.0-133.3
1-964	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	
1-965	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	1.5154(27)
1-966	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	
1-967	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	

[Tabla 1-26]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-968	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	64.0-65.0 1.5411(24) 1.5468(24)
1-969	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	
1-970	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	
1-971	Me	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	
1-972	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	
1-973	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	
1-974	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	
1-975	H	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	
1-976	CO ₂ Me	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	
1-977	CO ₂ Et	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	
1-978	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	1.5012(25) 1.4930(24)
1-979	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	
1-980	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	
1-981	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	
1-982	CO ₂ Ph	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	
1-983	Me	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	
1-984	CH ₂ OMe	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	
1-985	CH ₂ OEt	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	
1-986	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	
1-987	H	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	
1-988	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	1.4871(24) 1.4809(24)
1-989	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	
1-990	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	
1-991	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	
1-992	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	
1-993	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	
1-994	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	
1-995	Me	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	
1-996	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	
1-997	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	
1-998	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	143.7 1.5172(26)
1-999	H	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	
1-1000	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	
1-1001	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	
1-1002	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	
1-1003	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	
1-1004	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	
1-1005	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	
1-1006	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	

[Tabla 1-27]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-1007	Me	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	147.1-147.7
1-1008	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	
1-1009	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	
1-1010	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	
1-1011	H	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	
1-1012	CO ₂ Me	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	
1-1013	CO ₂ Et	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	
1-1014	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	
1-1015	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	
1-1016	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	
1-1017	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	
1-1018	CO ₂ Ph	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	
1-1019	Me	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	
1-1020	CH ₂ OMe	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	152.8-153.6
1-1021	CH ₂ OEt	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	
1-1022	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	
1-1023	H	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-1024	CO ₂ Me	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-1025	CO ₂ Et	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-1026	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-1027	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-1028	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-1029	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-1030	CO ₂ Ph	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-1031	Me	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-1032	CH ₂ OMe	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-1033	CH ₂ OEt	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	1.5286(21) 1.5145(22) 1.5228(22)
1-1034	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-1035	H	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	
1-1036	CO ₂ Me	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	
1-1037	CO ₂ Et	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	
1-1038	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	
1-1039	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	
1-1040	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	
1-1041	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	
1-1042	CO ₂ Ph	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	
1-1043	Me	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	
1-1044	CH ₂ OMe	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	
1-1045	CH ₂ OEt	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	

[Tabla 1-28]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-1046	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	1.4991(21)
1-1047	H	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	
1-1048	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	
1-1049	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	
1-1050	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	
1-1051	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	
1-1052	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	
1-1053	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	
1-1054	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	
1-1055	Me	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	
1-1056	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	1.4849(22)
1-1057	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	
1-1058	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	
1-1059	H	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1060	CO ₂ Me	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1061	CO ₂ Et	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1062	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1063	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1064	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1065	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1066	CO ₂ Ph	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	136.9
1-1067	Me	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1068	CH ₂ OMe	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1069	CH ₂ OEt	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1070	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1071	H	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	
1-1072	CO ₂ Me	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	
1-1073	CO ₂ Et	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	
1-1074	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	
1-1075	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	
1-1076	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	73-76
1-1077	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	
1-1078	CO ₂ Ph	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	
1-1079	Me	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	
1-1080	CH ₂ OMe	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	
1-1081	CH ₂ OEt	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	
1-1082	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	
1-1083	H	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	
1-1084	CO ₂ Me	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	

[Tabla 1-29]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-1085	CO ₂ Et	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	1.5168(19)
1-1086	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	
1-1087	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	
1-1088	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	
1-1089	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	
1-1090	CO ₂ Ph	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	
1-1091	Me	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	
1-1092	CH ₂ OMe	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	
1-1093	CH ₂ OEt	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	
1-1094	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	
1-1095	H	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	91-94 1.5068(19)
1-1096	CO ₂ Me	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	
1-1097	CO ₂ Et	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	
1-1098	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	
1-1099	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	
1-1100	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	
1-1101	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	
1-1102	CO ₂ Ph	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	
1-1103	Me	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	
1-1104	CH ₂ OMe	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	
1-1105	CH ₂ OEt	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	117.8 1.5068(20) 1.5135(20)
1-1106	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	
1-1107	H	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1108	CO ₂ Me	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1109	CO ₂ Et	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1110	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1111	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1112	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1113	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1114	CO ₂ Ph	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1115	Me	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	116.2 1.5070(21) 1.5102(21)
1-1116	CH ₂ OMe	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1117	CH ₂ OEt	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1118	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1119	H	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	O	
1-1120	CO ₂ Me	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	O	
1-1121	CO ₂ Et	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	O	
1-1122	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	O	
1-1123	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	O	

[Tabla 1-30]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-1124	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	O	
1-1125	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	O	
1-1126	CO ₂ Ph	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	O	
1-1127	Me	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	O	
1-1128	CH ₂ OMe	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	O	
1-1129	CH ₂ OEt	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	O	
1-1130	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	O	
1-1131	H	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	O	
1-1132	CO ₂ Me	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	O	
1-1133	CO ₂ Et	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	O	
1-1134	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	O	
1-1135	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	O	
1-1136	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	O	
1-1137	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	O	
1-1138	CO ₂ Ph	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	O	
1-1139	Me	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	O	
1-1140	CH ₂ OMe	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	O	
1-1141	CH ₂ OEt	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	O	
1-1142	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	O	
1-1143	H	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	O	
1-1144	CO ₂ Me	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	O	
1-1145	CO ₂ Et	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	O	
1-1146	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	O	
1-1147	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	O	
1-1148	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	O	
1-1149	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	O	
1-1150	CO ₂ Ph	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	O	
1-1151	Me	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	O	
1-1152	CH ₂ OMe	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	O	
1-1153	CH ₂ OEt	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	O	
1-1154	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	O	
1-1155	H	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1156	CO ₂ Me	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1157	CO ₂ Et	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1158	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1159	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1160	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1161	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1162	CO ₂ Ph	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	

[Tabla 1-31]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-1163	Me	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1164	CH ₂ OMe	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1165	CH ₂ OEt	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1166	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1167	H	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1168	CO ₂ Me	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1169	CO ₂ Et	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1170	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1171	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1172	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1173	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1174	CO ₂ Ph	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1175	Me	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1176	CH ₂ OMe	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1177	CH ₂ OEt	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1178	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1179	H	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1180	CO ₂ Me	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1181	CO ₂ Et	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1182	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1183	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1184	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1185	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1186	CO ₂ Ph	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1187	Me	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1188	CH ₂ OMe	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1189	CH ₂ OEt	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1190	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1191	H	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1192	CO ₂ Me	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1193	CO ₂ Et	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1194	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1195	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1196	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1197	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1198	CO ₂ Ph	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1199	Me	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1200	CH ₂ OMe	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1201	CH ₂ OEt	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	

[Tabla 1-32]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-1202	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1203	H	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1204	CO ₂ Me	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1205	CO ₂ Et	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1206	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1207	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1208	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1209	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1210	CO ₂ Ph	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1211	Me	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1212	CH ₂ OMe	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1213	CH ₂ OEt	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1214	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1215	H	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1-1216	CO ₂ Me	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1-1217	CO ₂ Et	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1-1218	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1-1219	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1-1220	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1-1221	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1-1222	CO ₂ Ph	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1-1223	Me	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1-1224	CH ₂ OMe	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1-1225	CH ₂ OEt	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1-1226	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1-1227	H	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1228	CO ₂ Me	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1229	CO ₂ Et	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1230	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1231	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1232	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1233	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1234	CO ₂ Ph	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1235	Me	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1236	CH ₂ OMe	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1237	CH ₂ OEt	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1238	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1239	H	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	
1-1240	CO ₂ Me	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	

[Tabla 1-33]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-1241	CO ₂ Et	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	1.5068(21)
1-1242	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	
1-1243	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	
1-1244	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	
1-1245	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	
1-1246	CO ₂ Ph	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	
1-1247	Me	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	
1-1248	CH ₂ OMe	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	
1-1249	CH ₂ OEt	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	
1-1250	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	
1-1251	H	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1252	CO ₂ Me	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1253	CO ₂ Et	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1254	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1255	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1256	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1257	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1258	CO ₂ Ph	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1259	Me	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1260	CH ₂ OMe	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1261	CH ₂ OEt	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1262	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1263	H	H	H	Me	4-Br-Ph	O	1.5323(19)
1-1264	CO ₂ Me	H	H	Me	4-Br-Ph	O	1.5195(22)
1-1265	CO ₂ Et	H	H	Me	4-Br-Ph	O	1.5222(22)
1-1266	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	4-Br-Ph	O	
1-1267	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	4-Br-Ph	O	
1-1268	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	4-Br-Ph	O	
1-1269	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	4-Br-Ph	O	
1-1270	CO ₂ Ph	H	H	Me	4-Br-Ph	O	
1-1271	Me	H	H	Me	4-Br-Ph	O	
1-1272	CH ₂ OMe	H	H	Me	4-Br-Ph	O	
1-1273	CH ₂ OEt	H	H	Me	4-Br-Ph	O	
1-1274	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	4-Br-Ph	O	
1-1275	H	H	H	Et	2-F-Ph	O	
1-1276	CO ₂ Me	H	H	Et	2-F-Ph	O	
1-1277	CO ₂ Et	H	H	Et	2-F-Ph	O	
1-1278	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	2-F-Ph	O	
1-1279	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	2-F-Ph	O	

[Tabla 1-34]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-1280	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	2-F-Ph	O	
1-1281	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	2-F-Ph	O	
1-1282	CO ₂ Ph	H	H	Et	2-F-Ph	O	
1-1283	Me	H	H	Et	2-F-Ph	O	
1-1284	CH ₂ OMe	H	H	Et	2-F-Ph	O	
1-1285	CH ₂ OEt	H	H	Et	2-F-Ph	O	
1-1286	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	2-F-Ph	O	
1-1287	H	H	H	Et	3-MeO-Ph	O	
1-1288	CO ₂ Me	H	H	Et	3-MeO-Ph	O	
1-1289	CO ₂ Et	H	H	Et	3-MeO-Ph	O	
1-1290	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	3-MeO-Ph	O	
1-1291	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	3-MeO-Ph	O	
1-1292	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	3-MeO-Ph	O	
1-1293	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	3-MeO-Ph	O	
1-1294	CO ₂ Ph	H	H	Et	3-MeO-Ph	O	
1-1295	Me	H	H	Et	3-MeO-Ph	O	
1-1296	CH ₂ OMe	H	H	Et	3-MeO-Ph	O	
1-1297	CH ₂ OEt	H	H	Et	3-MeO-Ph	O	
1-1298	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	3-MeO-Ph	O	
1-1299	H	H	H	Me	c-Hex	O	
1-1300	CO ₂ Me	H	H	Me	c-Hex	O	
1-1301	CO ₂ Et	H	H	Me	c-Hex	O	
1-1302	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	c-Hex	O	
1-1303	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	c-Hex	O	
1-1304	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	c-Hex	O	
1-1305	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	c-Hex	O	
1-1306	CO ₂ Ph	H	H	Me	c-Hex	O	
1-1307	Me	H	H	Me	c-Hex	O	
1-1308	CH ₂ OMe	H	H	Me	c-Hex	O	
1-1309	CH ₂ OEt	H	H	Me	c-Hex	O	
1-1310	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	c-Hex	O	
1-1311	H	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	O	
1-1312	CO ₂ Me	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	O	
1-1313	CO ₂ Et	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	O	
1-1314	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	O	
1-1315	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	O	
1-1316	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	O	
1-1317	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	O	
1-1318	CO ₂ Ph	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	O	

[Tabla 1-35]

Tabla 1 (continuación)

Compuesto No.	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
1-1319	Me	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	O	
1-1320	CH ₂ OMe	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	O	
1-1321	CH ₂ OEt	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	O	
1-1322	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	O	
1-1323	H	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1324	CO ₂ Me	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1325	CO ₂ Et	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1326	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1327	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1328	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1329	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1330	CO ₂ Ph	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1331	Me	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1332	CH ₂ OMe	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1333	CH ₂ OEt	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1334	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	

[Tabla 2]

Fórmula General (I-3)

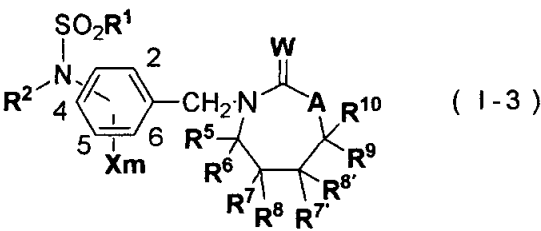
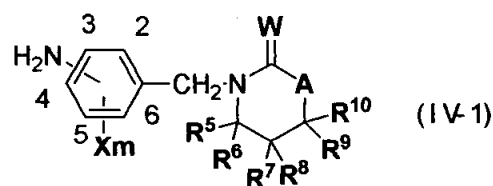


Tabla 2 (m=0, A=O, R⁵=R⁶=R⁷=R⁸=H)

Compuesto No.	Sitio sustituido	R ¹	R ²	R ^{7'}	R ^{8'}	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
2-1	2	CF ₃	H	H	H	H	H	O	110.6
2-2	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	H	H	H	O	
2-3	2	CF ₃	CO ₂ Et	H	H	H	H	O	1.4977(27)
2-4	2	CF ₃	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	H	O	86.7
2-5	2	CF ₃	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	H	O	1.4935(26)
2-6	2	CF ₃	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	H	O	1.4928(26)
2-7	2	CF ₃	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	H	O	
2-8	2	CF ₃	Me	H	H	H	H	O	
2-9	2	CF ₃	CH ₂ OMe	H	H	H	H	O	
2-10	2	CF ₃	CH ₂ OEt	H	H	H	H	O	
2-11	2	CF ₃	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	H	O	
2-12	2	CF ₃	H	H	H	H	H	S	1.5204(26)
2-13	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	H	H	H	S	
2-14	2	CF ₃	CO ₂ Et	H	H	H	H	S	49.7-52.8
2-15	2	CF ₃	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	H	S	
2-16	2	CF ₃	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	H	S	
2-17	2	CF ₃	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	H	S	59.3-62.8
2-18	2	CF ₃	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	H	S	
2-19	2	CF ₃	Me	H	H	H	H	S	
2-20	2	CF ₃	CH ₂ OMe	H	H	H	H	S	
2-21	2	CF ₃	CH ₂ OEt	H	H	H	H	S	
2-22	2	CF ₃	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	H	S	
2-23	2	CF ₃	H	Me	H	H	H	O	1.4945(26)
2-24	2	CF ₃	CO ₂ Me	Me	H	H	H	O	1.4965(25)
2-25	2	CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	H	H	O	1.4909(25)
2-26	2	CF ₃	CO ₂ <i>n</i> -Pr	Me	H	H	H	O	
2-27	2	CF ₃	CO ₂ <i>n</i> -Bu	Me	H	H	H	O	1.4889(25)
2-28	2	CF ₃	CO ₂ <i>i</i> -Bu	Me	H	H	H	O	1.4898(25)
2-29	2	CF ₃	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	Me	H	H	H	O	
2-30	2	CF ₃	Me	Me	H	H	H	O	
2-31	2	CF ₃	CH ₂ OMe	Me	H	H	H	O	
2-32	2	CF ₃	CH ₂ OEt	Me	H	H	H	O	
2-33	2	CF ₃	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	Me	H	H	H	O	
2-34	2	CF ₃	CO ₂ CH ₂ CCl ₃	Me	H	H	H	O	1.5041(25)

[Tabla 3-1]

Fórmula General (IV-1)

Tabla 3 ($m=0$, $A=O$, $R^5=R^6=H$)

Compuesto No.	Sitio sustituido	R^7	R^8	R^9	R^{10}	W	Propiedades Físicas
3-1	2	H	H	H	H	O	1.5489(22)
3-2	2	H	H	H	H	S	1.6278(24)
3-3	2	Me	Me	H	H	O	1.5509(23)
3-4	2	Me	Me	H	H	S	90.8-92.1
3-5	2	H	H	Me	Me	O	1.5402(22)
3-6	2	H	H	Me	Me	S	1.5815(22)
3-7	2	H	H	Me	Et	O	1.5476(22)
3-8	2	H	H	Me	CF ₃	O	1.5088(22)
3-9	2	H	H	Et	CF ₃	O	1.5069(22)
3-10	2	H	H	Et	Et	O	1.5365(22)
3-11	2	H	H	Et	Et	S	1.5743(23)
3-12	2	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	1.5481(20)
3-13	2	H	H		(CH ₂) ₄	O	1.5612(24)
3-14	2	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	O	1.5475(27)
3-15	2	H	H	Me	Ph	O	1.5891(25)
3-16	2	H	H	Me	2-Cl-Ph	O	1.5732(26)
3-17	2	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	1.5853(27)
3-18	2	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	1.5891(26)
3-19	2	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	1.5581(25)
3-20	2	H	H	Ph	Ph	O	61-65
3-21	2	H	H	CF ₃	Ph	O	1.5314(26)
3-22	2	H	H	H	Ph	O	1.5719(26)
3-23	2	H	H	H	2-F-Ph	O	1.5822(24)
3-24	2	Me	Me	H	Ph	O	1.5712(23)
3-25	2	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	O	1.5721(20)
3-26	2	H	H	H	2-Me-Ph	O	1.5929(22)
3-27	2	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	O	1.5535(21)
3-28	2	H	H	H	2-Cl-Ph	O	1.5892(23)
3-29	2	H	H	Et	Ph	O	1.5576(22)
3-30	2	H	H	CF ₃	CF ₃	O	1.4831(22)
3-31	2	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	154.2
3-32	2	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	1.5629(21)

[Tabla 3-2]

Tabla 3 (continuación)

Compuesto No.	Sitio sustituido	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
3-33	2	H	H	Me	1-Me-1- <i>c</i> -Pr	O	1.5531(20)
3-34	2	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	123.5-126.1
3-35	2	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	1.4955(23)
3-36	2	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	1.5210(20)
3-37	2	H	H	Me	2-F-Ph	O	110.5
3-38	2	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	1.5295(26)
3-39	2	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	1.5520(26)
3-40	2	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	97
3-41	2	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	1.5878(23)
3-42	2	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	1.5258(26)
3-43	2	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	O	1.5273(26)
3-44	2	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	O	1.5744(26)
3-45	2	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	1.5200(25)
3-46	2	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	O	1.5752(24)
3-47	2	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	1.5192(25)
3-48	2	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	O	1.5960(24)
3-49	2	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	O	1.5296(26)
3-50	2	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	1.5754(26)
3-51	2	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	O	1.5252(25)
3-52	2	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	O	1.5132(25)
3-53	2	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	O	1.5269(26)
3-54	2	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	O	1.4971(25)
3-55	2	H	H	Me	2-Br-Ph	O	1.5705(26)
3-56	2	H	H	Et	4-F-Ph	O	1.5281(27)
3-57	2	H	H	Me	3-MeO-Ph	O	1.5800(27)
3-58	2	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	O	1.5580(27)
3-59	2	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	O	1.5187(27)
3-60	2	H	H	Me	3-Me-Ph	O	1.5780(24)
3-61	2	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	1.5568(25)
3-62	2	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	112
3-63	2	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	1.5352(26)
3-64	2	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	1.5550(25)
3-65	2	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	1.5708(24)
3-66	2	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	1.5211(24)
3-67	2	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	1.5299(26)
3-68	2	H	H	Me	3-F-Ph	O	1.5486(25)
3-69	2	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	1.5363(25)
3-70	2	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	1.5728(24)

[Tabla 3-3]

Tabla 3 (continuación)

Compuesto No.	Sitio sustituido	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
3-71	2	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	1.5767(24)
3-72	2	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	1.5479(24)
3-73	2	H	H	Me	4-Me-Ph	O	138.9-140.2
3-74	2	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	1.5340(26)
3-75	2	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	1.5732(24)
3-76	2	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	1.5781(24)
3-77	2	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	1.5593(20)
3-78	2	H	H	Me	4-F-Ph	O	1.5620(21)
3-79	2	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	1.5730(26)
3-80	2	H	H	Me	3-MeO-Ph	O	1.5800(27)
3-81	2	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	1.5710(19)
3-82	2	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	1.5652(19)
3-83	2	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	1.5724(20)
3-84	2	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	1.5732(24)
3-85	2	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	1.5728(24)
3-86	2	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	1.5550(25)
3-87	2	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	1.5708(24)
3-88	2	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	1.5568(25)
3-89	2	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	O	1.5580(27)
3-90	2	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	1.5862(22)
3-91	2	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	1.5279(23)

[Tabla 4]

Fórmula General (IV-2)

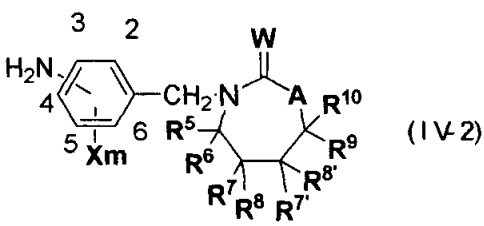


Tabla 4 (m=0, A=O, R⁵=R⁶=R⁷=R⁸=H)

Compuesto No.	Sitio sustituido	R ^{7'}	R ^{8'}	R ⁹	R ¹⁰	W	Propiedades Físicas
4-1	2	H	H	H	H	O	1.5480(22)
4-2	2	H	H	H	H	S	1.5979(26)
4-3	2	Me	H	H	H	O	1.5432(26)

[Tabla 5-1]

Fórmula General (II-3)

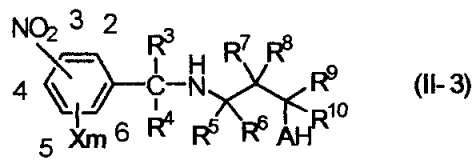


Tabla 5 (m=0, A=O, R³=R⁴=R⁵=R⁶=H)

Compuesto No.	Sitio sustituido	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	A	Propiedades Físicas
5-1	2	H	H	H	H	O	1.5489(24)
5-2	2	Me	Me	H	H	O	1.5265(23)
5-3	2	H	H	Me	Me	O	65.3-67.9
5-4	2	H	H	Me	Et	O	1.5392(23)
5-5	2	H	H	Me	CF ₃	O	1.4945(19)
5-6	2	H	H	Et	CF ₃	O	1.4992(22)
5-7	2	H	H	Et	Et	O	1.5245(20)
5-8	2	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	1.5350(20)
5-9	2	H	H		(CH ₂) ₄	O	1.5416(23)
5-10	2	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	O	1.5369(27)
5-11	2	H	H	Me	Ph	O	1.5572(23)
5-12	2	H	H	Me	2-Cl-Ph	O	1.5749(25)
5-13	2	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	1.5604(26)
5-14	2	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	1.5571(25)
5-15	2	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	1.5603(26)
5-16	2	H	H	Ph	Ph	O	98.2-100.1
5-17	2	H	H	CF ₃	Ph	O	1.5416(26)
5-18	2	H	H	H	Ph	O	1.5537(25)
5-19	2	H	H	H	2-F-Ph	O	1.5625(26)
5-20	2	Me	Me	H	Ph	O	1.5468(25)
5-21	2	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	O	86.2
5-22	2	H	H	H	2-Me-Ph	O	1.5696(19)
5-23	2	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	O	69.2-70.3
5-24	2	H	H	H	2-Cl-Ph	O	1.5714(17)
5-25	2	H	H	Et	Ph	O	1.5570(20)
5-26	2	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	1.5325(17)
5-27	2	H	H	CF ₃	CF ₃	O	67.2
5-28	2	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	1.5606(18)
5-29	2	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	108.3
5-30	2	H	H	Me	1-Me-1- <i>c</i> -Pr	O	1.5361(21)
5-31	2	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	1.5398(25)
5-32	2	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	NMR-1
5-33	2	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	1.5219(25)

[Tabla 5-2]

Tabla 5 (continuación)

Compuesto No.	Sitio sustituido	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	A	Propiedades Físicas
5-34	2	H	H	Me	2-F-Ph	O	NMR
5-35	2	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	1.5276(25)
5-36	2	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	
5-37	2	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	NMR
5-38	2	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	
5-39	2	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	1.5204(25)
5-40	2	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	O	1.5185(26)
5-41	2	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	O	
5-42	2	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	1.5145(24)
5-43	2	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	O	
5-44	2	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	1.5106(26)
5-45	2	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	O	
5-46	2	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	O	
5-47	2	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
5-48	2	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	O	1.5161(24)
5-49	2	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	O	1.5182(25)
5-50	2	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	O	1.5255(26)
5-51	2	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	O	1.4995(28)
5-52	2	H	H	Me	2-Br-Ph	O	NMR
5-53	2	H	H	Et	4-F-Ph	O	1.5422(26)
5-54	2	H	H	Me	3-MeO-Ph	O	1.5542(27)
5-55	2	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	O	1.5010(27)
5-56	2	H	H	Me	3-Me-Ph	O	1.5491(25)
5-57	2	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	1.5382(24)
5-58	2	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	1.5220(25)
5-59	2	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	1.5223(25)
5-60	2	H	H	Me	3-F-Ph	O	1.5442(25)
5-61	2	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	1.5289(25)
5-62	2	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	1.5735(23)
5-63	2	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	1.5358(26)
5-64	2	H	H	Me	4-Me-Ph	O	1.5525(23)
5-65	2	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	1.5225(25)
5-66	2	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	1.5742(24)
5-67	2	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	1.5635(21)
5-68	2	H	H	Me	4-F-Ph	O	1.5421(20)
5-69	2	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	1.5600(23)
5-70	2	H	H	Me	3-MeO-Ph	O	1.5746(26)
5-71	2	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	1.5636(22)

[Tabla 5-3]

Tabla 5 (continuación)

Compuesto No.	Sitio sustituido	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	A	Propiedades Físicas
5-72	2	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	1.5339(22)
5-73	2	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	1.5350(22)
5-74	2	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	1.5502(26)
5-75	2	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	1.5558(26)
5-76	2	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	1.5396(24)
5-77	2	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	1.5508(26)
5-78	2	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	1.5449(26)
5-79	2	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	O	1.5468(26)
5-80	2	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	1.5556(21)
5-81	2	H	H	Me	4-Br-Ph	O	1.5615(19)
5-82	2	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	1.5241(20)

[Tabla 6]

Fórmula General (II-4)

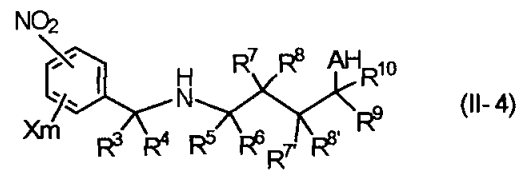


Tabla 6 (m=0, A=O, R³=R⁴=R⁵=R⁶=R⁷=R⁸=H)

Compuesto No.	Sitio sustituido	R ^{7'}	R ^{8'}	R ⁹	R ¹⁰	Propiedades Físicas
6-1	2	H	H	H	H	1.5431(24)
6-2	2	Me	H	H	H	1.5372(24)

[Tabla 7]

Tabla 7

Compuesto No.	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, valor δ ppm)
5-32	7.96(1H, dd), 7.77(1H, d), 7.72(1H, d), 7.57(1H, ddd), 7.51(1H, t), 7.46(1H, dd), 7.42(1H, ddd), 7.34(1H, t), 3.93(1H, d), 3.82(1H, d), 2.95(1H, ddd), 2.59(1H, ddd), 2.35(1H, ddd), 2.02(1H, ddd), 1.60(3H, s)
5-34	7.98(1H, d), 7.77(1H, ddd), 7.58(1H, ddd), 7.45(1H, d), 7.43(1H, ddd), 7.22(1H, dd), 7.15(1H, ddd), 6.99(1H, dd), 3.92(1H, d), 3.83(1H, d), 2.89(1H, ddd), 2.43(1H, ddd), 2.28(1H, ddd), 2.01(1H, ddd), 1.56(3H, s)
5-37	7.98(1H, d), 7.58(1H, dd), 7.45(2H, m), 7.38(1H, d), 7.29(1H, d), 3.94(1H, d), 3.85(1H, d), 2.86(1H, ddd), 2.50(1H, ddd), 2.20-1.91(2H, m), 1.48(3H, s)
5-52	8.02(1H, dd), 7.98(1H, dd), 7.58(1H, ddd), 7.56(1H, dd), 7.47-7.40(2H, m), 7.33(1H, ddd), 7.09(1H, ddd), 3.90(1H, d), 3.81(1H, d), 2.92-2.82(1H, m), 2.38(1H, m), 1.98(1H, m), 1.68(3H, s)

Los derivados de haloalquilosulfonanilida o sales de los mismos de la presente invención son útiles para controlar, por ejemplo, malezas anuales, bianuales y perennes que ocurran en arrozales, tierras altas, huertos, suelos pantanosos, etc., tales como pasto de corral (*Echinochloa cruz-galli* Beauv., un pasto gramíneo anual que es una maleza perjudicial para arrozales), pimpinela falsa (*Lindernia pyxidaria*, una planta parasítica perjudicial para arrozales), monochoria (*Monochoria vaginalis*, una hierba anual o perenne perjudicial para arrozales), (*Monochoria korsakowii*, una hierba anual perjudicial para arrozales), ammannia (*Ammannia multiflora* Roxb., hierba literáceo anual que es una hierba perjudicial para arrozales), planta sombrilla (*Cyperus difformis* L., un pasto ciperáceo anual perjudicial para arrozales), pasto con hojas filamentosas (*Eleocharis acicularis* Roem et Schult, un pasto ciperáceo perenne perjudicial para arrozales y que también crece en pantanos y vías fluviales, fruto de flecha de tres puntas (*Sagitaria trifolia* L., una hierba perenne perjudicial de la familia Alismataceae que

crece en arrozales, pantanos y zanjas), la punta de flecha (*Sagittaria pygmaea* Miq., una hierba perenne perjudicial de la familia Alismataceae que crece en arrozales, pantanos y zanjas), hierba recta de pantano (*Scirpus juncoides* var. *ohwianus*, una hierba ciperácea perenne que crece en arrozales, pantanos y zanjas), *kuroguwai* (*Eleocharis kuroguwai*, una hierba ciperácea perenne que crece en arrozales, pantanos y zanjas), pasto cola de zorro (*Alopecurus aequalis* var. *amurensis* Ohwi, un pasto gramíneo que crece en tierras altas y pantanos bajos), avena silvestre (*Avena fatua* L., un pasto gramíneo bianual que crece en planos, tierras de desecho y tierras altas), altamisa o hierba de San Juan (*Artemisia princeps* Pamp., un pasto compuesto perenne que crece en campos cultivados y sin cultivar y montañas), pasto de cuaresma grande (*Digitaria adscendens* Henr., un pasto gramíneo anual perjudicial para tierras altas y huertos), *Gishigishi* o Japanese dock (*Rumex japonicus* Houtt., una hierba poligonácea perenne que crece en tierras altas y veras del camino), junco chato (*Cyperus iria* L., una hierba ciperácea anual perjudicial para tierras altas), amaranto espigado (*Amarantus viridis* L., una hierba anual de la familia Amarantácea que crece en tierras vacías, veras del camino y tierras altas), bardana menor (*Xanthium strumarium* L., una hierba compuesta anual perjudicial que crece en tierras altas), malva india (*Abutilon theophrasti* L., una hierba anual perjudicial de la familia Malvácea que crece en tierras altas), estramonio o hierba del diablo (*Datura stramonium*, una hierba anual perjudicial de tierras altas), bird's eye speedwell (*Verónica persica* Poir., una hierba bianual perjudicial de la familia Escrofulariácea que crece en tierras altas) y la hierba prensil (*Galium spurium* L., una maleza anual perjudicial de la familia rubiácea que crece en tierras altas y huertos), etc. Son efectivos para el control de maleza en arrozales en particular y tienen un excelente desempeño como herbicidas para arrozales debido a que el ancho en selectividad entre el rice-paddy weed es amplia.

Debido a que los derivados de haloalquilosulfonanilida o sales de los mismos de la presente invención exhiben un excelente efecto controlador en malezas previo o posterior a que emerjan, las actividades fisiológicas características de la composición herbicida de la presente invención pueden manifestarse de manera efectiva mediante el tratamiento de campos con los herbicidas antes de sembrar allí las plantas útiles, o después de sembrar las plantas útiles (incluido el caso en el que ya se hayan sembrado plantas útiles como en huertos) pero durante el periodo desde la etapa inicial de emergencia de las malezas hasta su etapa de crecimiento. Sin embargo, la aplicación de la composición herbicida de la presente invención no se restringe solo a las modalidades que se mencionan arriba. La composición herbicida de la presente invención puede aplicarse para controlar no solo malezas que crezcan en arrozales sino también, por ejemplo, malezas que crezcan en otros lugares como tierras altas, arrozales temporalmente no cultivados y tierras altas, estribaciones entre campos, senderos agrícolas, vías fluviales, terrenos construidos para pastizales, camposantos, carreteras, campos de juego, áreas desocupadas alrededor de edificios, terrenos desarrollados, vías férreas, bosques. El tratamiento de los campos con los herbicidas es más efectivo en términos de costos cuando el tratamiento se hace en la etapa inicial de emergencia de la maleza. Sin embargo, el tratamiento no se restringe a ello y puede realizarse aún durante la etapa de crecimiento de las malezas.

Para aplicar los derivados de haloalquilosulfonanilida o las sales de los mismos de la presente invención como herbicidas, ellos son formulados preferiblemente en una forma conveniente para usar de acuerdo con el procedimiento empleado convencionalmente para preparar químicos agrícolas. Es decir, los derivados de haloalquilosulfonanilida representados por la fórmula (I) o sales de los mismos se mezclan con un vehículo inerte adecuado, y según se requiera, además con un adyuvante, en una relación apropiada, y la mezcla se hace en una forma

deseada de preparación, tal como suspensión, emulsión, concentrado emulsificable, solución, polvo humectable, gránulo dispersible en agua, gránulos, polvo, formulaciones jumbo en tabletas, formulaciones en paquete, disolución, 5 dispersión, suspensión, mezcla, impregnado, adsorción o adhesión.

Los vehículos inertes que se usan en la presente invención pueden ser sólidos o líquidos, y ejemplos de materiales que se pueden usar como vehículos sólidos 10 incluyen polvos vegetales (por ejemplo, harina de frijol soya, harina de cereal, harina de madera, harina de corteza, polvo de aserrín, tallos de tabaco en polvo, conchas de nuez en polvo, salvado, celulosa en polvo, residuos de extracción de vegetales), polímeros sintéticos 15 de resinas en polvo, arcillas (por ejemplo, caolín, bentonita y arcilla ácida), talcos (por ejemplo talco y pirofilita), polvos u hojuelas de sílice [por ejemplo tierra diatomácea, arena de sílice, mica y carbono blanco (es decir ácido silícico altamente dispersado, denominado 20 también sílice hidratada dividida finamente o ácido silícico hidratado)], carbono activado, materiales minerales naturales (por ejemplo, azufre en polvo, pómez en polvo, atapulgita y zeolita), tierra diatomácea calcinada, ladrillo molido, ceniza volátil, arena, vehículos plásticos 25 (por ejemplo polietileno, polipropileno, cloruro de polivinilideno), polvos minerales inorgánicos tales como polvo de carbonato de calcio y polvo de fosfato de calcio, fertilizantes químicos tales como sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, urea y cloruro de 30 amonio y abono. Estos materiales pueden usarse solos o como una mezcla de dos o más clases.

Los materiales que se pueden usar como vehículos líquidos son seleccionados no solo de los que tengan solvencia por sí mismos sino también de los que no tengan 35 solvencia pero que puedan dispersar el compuesto ingrediente activo con la ayuda de adyuvantes. Ejemplos típicos de los vehículos líquidos, que pueden usarse solos o en combinación de dos o más, son agua, alcoholes (por

ejemplo metanol, etanol, isopropanol, butanol y etilen glicol) cetonas (por ejemplo, acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona, diisobutil cetona y ciclohexanona), éteres (por ejemplo, etil éter, dioxano, celosolva, dipropil éter y tetrahidrofurano), hidrocarburos alifáticos (por ejemplo, querosén y aceites minerales), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo benceno, tolueno, xileno, nafta solvente y alquilonaftalenos), hidrocarburos halogenados (por ejemplo, dicloroetano, cloroformo y tetracloruro de carbono), ésteres (por ejemplo acetato de etilo, ftalato de diisopropilo, ftalato de dibutilo y ftalato de dioctilo), amidas (por ejemplo, dimetilformamida, dietilformamida y dimetilacetamida), nitrilos (por ejemplo, acetonitrilo) y dimetil sulfóxido.

Los otros adyuvantes incluyen adyuvantes típicos según se ejemplifican más adelante, y pueden usarse de acuerdo con los respectivos propósitos. En algunos casos, pueden usarse solos o en combinación de dos o más, en otros casos es posible no usar adyuvantes. Con el propósito de emulsificar, dispersar, solubilizar y/o humectar los compuestos del ingrediente activo, se pueden usar agentes activos de superficie, por ejemplo, éteres de polioxietileno alquilo, ésteres de polioxietileno alquiloarilo, ésteres de polietileno de ácidos más grasos, resينات de polioxietileno, monolaurato de polioxietileno sorbitan, monooleato de polioxietileno sorbitan, alquilarilsulfonatos, productos de condensación de ácido naftalensulfónico, ligninsulfonatos y ésteres de sulfato de alcohol más alto.

Con el propósito de impartir una propiedad de dispersión adhesividad y/o unión estable a los compuestos del ingrediente activo se puede usar adyuvantes tales como caseína, gelatina, almidón, metil celulosa, carboxi metil celulosa, goma arábica, alcohol polivinílico, trementina, aceite de salvado, bentonita y ligninsulfonatos. Con el propósito de mejorar las propiedades de flujo de las composiciones herbicidas sólidas se pueden usar adyuvantes tales como ceras, estearatos y alquilo fosfatos. Adyuvantes

tales como productos de condensación de ácido naftalensulfónico y polifosfatos pueden usarse como peptizantes en composiciones herbicidas dispersibles. Como agentes espumantes se pueden usar adyuvantes como aceites
5 de silicona.

El contenido del compuesto del ingrediente activo para todo el herbicida de la presente invención no se limita en particular y puede variarse según se requiera, y por ejemplo, para la preparación de un producto en polvo o
10 granulado, el contenido es preferiblemente de 0,1 a 50% por masa, más preferiblemente de 0,5 a 10% por masa, y para la preparación del concentrado emulsificable, polvo humectable, gránulo dispersible en agua, el contenido es preferiblemente de 0,1 a 90% por masa, más preferiblemente
15 de 0,5 a 50% por masa.

Para controlar varias malezas o para inhibir su crecimiento, los herbicidas de la presente invención son aplicados tal como estén o luego de ser diluidos apropiadamente o suspendidos en agua u otro medio, cuando
20 no se desee la emergencia o crecimiento de la maleza. Por ejemplo, en el caso de tierras altas o campos no cultivados, los herbicidas pueden aplicarse al follaje y tallos o al suelo, y en el campo de arrozales, pueden aplicarse al agua del arrozal.

La cantidad usada de herbicidas de la presente invención varía dependiendo de varios factores, por ejemplo, el propósito de la aplicación, las clases de malezas identificadas, el estado de crecimiento del cultivo, la tendencia de la maleza a emerger, el clima,
25 condiciones ambientales, la forma de los herbicidas usados, el modo de aplicación, el tipo o estado del sitio de la aplicación y la hora de la aplicación, pero la cantidad es seleccionada de manera apropiada de acuerdo con el
30 propósito entre 0,1g a 10kg en términos de la cantidad de compuesto de ingrediente activo por hectárea.
35

Además, los herbicidas que comprenden el derivado de haloalquilosulfonanilida o sales del mismo de la presente invención como ingrediente activo pueden usarse como una

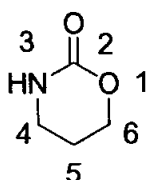
mezcla con otro compuesto que tenga la actividad herbicida con el propósito de expandir el espectro herbicida, mejorar la actividad herbicida, etc. Además, las composiciones herbicidas de la presente invención pueden mezclarse y
5 usarse con un insecticida o un fungicida.

[Ejemplos]

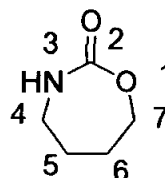
A continuación, la presente invención se describe de manera específica a modo de Ejemplos, Formulación y Ejemplos de Prueba, pero la invención no se limita a ellos.

- 5 Aquí, [1,3]-oxazinan-2-ona y [1,3]-oxazepan-2-ona representan la siguiente estructura.

[Fórmula 6]



[1,3]-oxazinan-2-ona



[1,3]-oxazepan-2-ona

- 10 Ejemplo 1. Producción de 3-[2-(trifluorometansulfonilamino) bencil]-[1,3]-oxazinan-2-ona
(Compuesto No. 1-1)

1-1) Producción de 3-(2-nitrobencil)-[1,3]-oxazinan-2-ona

- Se disolvió 3-(2-Nitrobencilamino)-1-propanol (1.03g, 4.90 mmol) en cloroformo (20 ml) y la solución de reacción se enfrió a 0°C. En seguida se agregó trietilamina (1.98 g, 19.6 mmol), trifosgeno (0.58 g, 1.95 mmol) y la mezcla se agitó a la misma temperatura durante 1,5 horas. La mezcla de la reacción se agregó con agua y se extrajo con etil acetato y luego la capa orgánica se lavó con una salmuera saturada, se secó en sulfato de sodio anhidro y se evaporó el solvente a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano: etil acetato=1:4) y se obtuvo 3-(2-nitrobencil)-[1,3]-oxazinan-2-ona (0.29 g).

Rendimiento: 25% - Propiedades físicas: mp 137.8°C

1-2) Producción de 3-(2-aminobencil)-[1,3]-oxazinan-2-ona
(Compuesto No. 3-1)

- Se suspendió 3-(2-Nitrobencil)-[1,3]-oxazinan-2-ona (0.24 g, 1.02 mmol), polvo de hierro (0.28 g, 5.02 mmol),

cloruro de amonio (0.03 g, 0.56 mmol) en etanol (10 ml) y agua (5 ml) y se calentó a reflujo durante una hora. Luego de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de la reacción se filtró con succión y se extrajo con etil acetato. La
5 capa orgánica se lavó con salmuera saturada y luego se secó en sulfato de sodio anhidro y se obtuvo 3-(2-aminobencil)-[1,3]-oxazinan-2-ona evaporando el solvente a presión reducida (0.20 g)

Rendimiento: 95% - Propiedades físicas: n_D 1.5489 (22°C)

10 1-3) Producción de 3-[2-(trifluorometansulfonilamino)bencil]-[1,3]-oxazinan-2-ona (Compuesto No. 1-1)

Se disolvió 3-(2-aminobencil)-[1,3]-oxazinan-2-ona (0.17 g, 0.83 mmol) y trietilamina (0.09 g, 0.89 mmol) en cloroformo (10 ml) y la solución de reacción se enfrió a
15 -10°C. Se agregó anhídruo trifluorometansulfónico lentamente y por goteo (0.24 g, 0.85 mmol) y se agitó a la temperatura que tenía durante 30 minutos. La mezcla de la reacción se vació en agua helada y se ajustó el pH de 3 a 4 con 0.5N de agua de ácido clorhídrico y se extrajo la
20 mezcla de la reacción con etil acetato. El solvente se evaporó a presión reducida luego de que la capa orgánica se secó en sulfato de sodio anhidro. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:etil acetato=1:4) para obtener 3-[2-(trifluorometansulfonilamino)bencil]-[1,3]-oxazinan-2-ona
25 (0.20 g)

Rendimiento: 71% - Propiedades físicas: n_D 1.4952 (22°C)

Ejemplo 2. Producción de 3-[2-[N-(propoxicarbonilo)-N-(trifluorometansulfonilo)amino]bencil]-[1,3]-oxazinan-2-ona
30 (Compuesto No. 1-4)

Se suspendió 3-[2-(Trifluorometansulfonilamino)bencil]-[1,3]-oxazinan-2-ona (0.13 g, 0.38 mmol) y carbonato de hidrógeno sódico (0.06 g, 0.71 mmol) en acetonitrilo (15 ml), se agregó con cloroformato de propilo (0.09 g, 0.77
35 mmol) y se calentó a reflujo durante seis horas. Luego de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de la reacción se agregó con agua y se extrajo con etil acetato. La capa

orgánica se lavó con salmuera saturada y luego se secó en sulfato de sodio anhidro y se evaporó el solvente a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano: etil acetato=1:4) para
5 obtener 3-({2-[N-(propoxicarbonilo)-N-(trifluorometansulfonilo)amino]bencil)-[1,3]-oxazinan-2-ona (0.11 g)

Rendimiento: 68% - Propiedades físicas: n_D 1.4977 (24°C)

Ejemplo 3. Producción de 6-fenilo-3-[2-
10 (trifluorometansulfonilamino)bencil]-[1,3]-oxazinan-2-ona.
(Compuesto No. 1.239)

3-1) Producción de 3-(2-nitrobencil)-6-fenilo-[1,3]-oxazinan-2-ona.

Se disolvió 3-(2-Nitrobencilamino)-1-fenilopropanol
15 (3.00 g, 10.5 mmol), trietilamina (4.24 g, 42.0 mmol) en tolueno (50 ml). En estado helado, se agregó lentamente por goteo una solución en la que trifosgeno (1.24 g, 4.19 mmol) se disolvió en tolueno (5 ml) y se calentó a reflujo durante seis horas y se agitó a temperatura ambiente
20 durante una hora. La mezcla de la reacción se vació en agua y luego de dejarse enfriar se extrajo con etil acetato. La capa orgánica se lavó con 0.1N de agua de ácido clorhídrico y luego se secó en sulfato de sodio anhidro y el solvente se evaporó a presión reducida. El residuo se
25 lavó con una mezcla de éter-etil acetato (1:2) para obtener 3-(2-nitrobencil)-6-fenilo-[1,3]-oxazinan-2-ona (1.70 g).

Rendimiento: 52% - Propiedades físicas: mp. 117.8°C

3-2) Producción de 3-(2-aminobencil)-6-fenilo[1,3]-oxazinan-2-ona. (Compuesto No. 3-22)

30 Se suspendió una mezcla de 3-(2-Nitrobencil)-6-fenilo-[1,3]-oxazinan-2-ona (1.59 g, 5.10 mmol), polvo de hierro (1.42 g, 25.4 mmol), cloruro de amonio (0.14 g, 2.62 mmol) en etanol (30 ml) y agua (15 ml) y se calentó a reflujo durante 1.5 horas. Luego de enfriar a temperatura ambiente,
35 la mezcla de la reacción se filtró con succión y se extrajo con etil acetato. La capa orgánica se lavó con una salmuera saturada y luego se secó en sulfato de sodio

anhidro y se obtuvo 3-(2-aminobencil)-6-fenilo-[1,3]-oxazinan-2-ona (1.43 g) evaporando el solvente a presión reducida.

Rendimiento: 99% - Propiedades físicas: n_D 1.5719 (26°C)

- 5 3-3) Producción de 6-fenilo-3-[2-(trifluorometansulfonilamino)bencil]-[1,3]-oxazinan-2-ona.
(Compuesto No. 1-239)

Se disolvió una mezcla de 3-(2-Aminobencil)-6-fenilo-[1,3]-oxazinan-2-ona (1.33 g, 4.72 mmol) y trietilamina
10 (0.50 g, 4.95 mmol) en cloroformo (20 ml) y la solución de la reacción se enfrió a -10°C. Se agregó lentamente por goteo anhídruo trifluorometanosulfónico (1.40 g, 4.96 mmol) y se agitó a la temperatura que tenía, durante dos horas. La mezcla de la reacción se vació en agua helada y el pH se
15 ajustó de 3 a 4 con 0.5N de agua de ácido clorhídrico y la mezcla de la reacción se extrajo con etil acetato. El solvente se evaporó a presión reducida y luego la capa orgánica se secó en sulfato de sodio anhidro. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice
20 (hexano:etil acetato=2:1) para obtener 6-fenilo-3-[2-(trifluorometansulfonilamino)bencil]-[1,3]-oxazinan-2-ona (1.70 g).

Rendimiento: 87% - Propiedades físicas: mp. 152.0°C

- Ejemplo 4. Producción de 6-fenilo-3-{2[-N-etoximetil)-N-(trifluorometanosulfonil)amino]bencil}-[1,3]-oxazinan-2-ona.
25 (Compuesto No. 1-248)

Se suspendió 6-Fenilo-3-[2-(trifluorometanosulfonilamino)bencil]-[1,3]-oxazinan-2-ona
(0.20 g, 0.48 mmol) y carbonato de hidrógeno sódico (0.08
30 g, 0.85 mmol) en acetonitrilo (10 ml) adicionado con clorometiletil éter (0.07 g, 0.83 mmol) y se calentó a reflujo durante tres horas. Luego de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de la reacción se agregó con agua y se extrajo con etil acetato. La capa orgánica se lavó con
35 salmuera saturada y luego se secó en sulfato de sodio anhidro y se evaporó el solvente a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de

sílice (hexano: etil acetato=2:1) para obtener 6-fenilo-3-{2-[N-etoximetil)-N-(trifluorometanosulfonil) amino] bencil)-[1,3]-oxazinan-2-ona (0.17 g).

Rendimiento: 75% - Propiedades físicas: mp. 115.6°C

- 5 Ejemplo 5. Producción de 6-metil-3-[2-(trifluorometanosulfonilamino)bencil]-[1,3]-oxazepan-2-ona
(Compuesto No. 2-23)

5-1) Producción de 6-metil-3-(2-nitrobencil)-[1,3]-oxazepan-2-ona.

- 10 Se disolvió una mezcla de 2-Metil-4-(2-nitrobencilamino) butanol (5.00 g, 21.0 mmol), trietilamina (8.49 g, 84.1 mmol) en tolueno (50 ml). En estado helado, se agregó lentamente por goteo una solución en la que trifosgeno (2.50 g, 8.42 mmol) se disolvió en tolueno (10 ml) y se
15 calentó a reflujo durante seis horas y se agitó a temperatura ambiente durante una hora. La mezcla de la reacción se vació en agua y luego de dejarse enfriar se extrajo con etil acetato. La capa orgánica se lavó con 0.1N de agua de ácido clorhídrico y luego se secó en sulfato de
20 sodio anhidro y el solvente se evaporó a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:etil acetato=2:1) para obtener 6-metil-3-(2-nitrobencil)-[1,3]-oxazepan-2-ona (2.00 g).

Rendimiento: 36% - Propiedades físicas: n_D 1.5392 (26°C)

- 25 5-2) Producción de 3-(2-aminobencil)-6-metil-[1,3]-oxazepan-2-ona (Compuesto No. 4-3)

- Se suspendió 6-metil-3-(2-nitrobencil)-[1,3]-oxazepan-2-ona (1.91 g, 7.23 mmol), polvo de hierro (2.02 g, 36.2 mmol), cloruro de amonio (0.19 g, 3.55 mmol) en etanol (30
30 ml) y agua (15 ml) y se calentó a reflujo durante una hora. Luego de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de la reacción se filtró con succión y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una salmuera saturada y luego se secó en sulfato de sodio anhidro, y se obtuvo 3-
35 (2-aminobencil)-6-metil-[1,3]-oxazepan-2-ona (1.02g) evaporando el solvente a presión reducida.

Rendimiento: 60% - Propiedades físicas: n_D 1.5432 (26°C)

5-3) Producción de 6-metil-3-[2-(trifluorometanosulfonilamino)bencil]-[1,3]-oxazepan-2-ona.
(Compuesto No. 2-23)

5 Se disolvió una mezcla de 3-(2-Aminobencil)-6-metil-[1,3]-oxazepan-2-ona (0.95 g, 4.06 mmol) y trietilamina (0.43 g, 4.26 mmol) en cloroformo (25 ml) y la solución de la reacción se enfrió a -10°C. Se agregó lentamente por goteo anhídrido trifluorometansulfónico (1.20 g, 4.26 mmol)
10 y se agitó a la temperatura que tenía durante dos horas. La mezcla de la reacción se vació en agua helada y el pH se ajustó de 3 a 4 con 0.5N de agua de ácido clorhídrico y la mezcla de la reacción se extrajo con etil acetato. El solvente se evaporó a presión reducida luego de secar la
15 capa orgánica en sulfato de sodio anhidro. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano: etil acetato=2:1) para obtener 6-metil-3-[2-(trifluorometanosulfonilamino) bencil]-[1,3]-oxazepan-2-ona (1.10 g)

20 Rendimiento: 74% - Propiedades físicas: n_D 1.4945 (26°C)

Ejemplo 6. Producción de 3-(2-[N-(isobutoxicarbonilo)-N-(trifluorometanosulfonil)amino]bencil)-6-metil-[1,3]-oxazepan-2-ona. (Compuesto No. 2-28)

Se suspendió una mezcla de 6-Metil-3-[2-(trifluorometanosulfonilamino) bencil]-[1,3]-oxazepan-2-ona
25 (0.15 g, 0.41 mmol) y carbonato de hidrógeno sódico (0.06 g, 0.71 mmol) en acetonitrilo (10 ml), se adicionó con cloroformato de isobutilo (0.10 g, 0.73 mmol) y se calentó a reflujo durante tres horas. Luego de enfriar a
30 temperatura ambiente, la mezcla de la reacción se agregó con agua y se extrajo con etil acetato. La capa de etil acetato se lavó con una salmuera saturada y luego se secó en sulfato de sodio anhidro y el solvente se evaporó a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía
35 en columna de gel de sílice (hexano: etil acetato=3:1) para obtener 3-(2-[N-(isobutoxicarbonilo)-N-

(trifluorometanosulfonil)amino]bencil)-6-metil-[1,3]-oxazepan-2-ona (0.10 g).

Rendimiento: 52% - Propiedades físicas: n_D 1.4898 (25°C)

Ejemplo 7. Producción de 5,5-dimetil-3-[2-(trifluorometanosulfonilamino)bencil]-[1,3]-oxazinan-2-tiona. (Compuesto No. 1-34).

7-1) Producción de 5,5-dimetil-3-(2-nitrobencil)-[1,3]-oxazinan-2-tiona

Se disolvió 2,2-Dimetil-3-(2-nitrobencilamino)-1-propanol (1.07 g, 4.50 mmol) en cloroformo (20 ml) y la solución de la reacción se enfrió a 0°C. Enseguida se agregó trietilamina (1.82 g, 18.0 mmol), tiofosgeno (0.52 g, 4.50 mmol) y se agitó a la temperatura que tenía durante dos horas y a temperatura ambiente durante una hora. La mezcla de la reacción se agregó con agua, se agitó a temperatura ambiente durante una hora y luego se extrajo con etil acetato. La capa orgánica se lavó con una salmuera saturada y luego se secó en sulfato de sodio anhidro y el solvente se evaporó a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano: etil acetato=1:1) para obtener 5,5-dimetil-3-(2-nitrobencil)-[1,3]-oxazinan-2-tiona (1.12 g).

Rendimiento: 89% - Propiedades físicas: n_D 1.5759 (21°C)

7-2) Producción de 3-(2-aminobencil)-5,5-dimetil-[1,3]-oxazinan-2-tiona. (Compuesto No. 3-4)

Se suspendió una mezcla de 5,5-Dimetil-3-(2-nitrobencil)-[1,3]-oxazinan-2-tiona (1.06 g, 3.79 mmol), polvo de hierro (1.06 g, 19.0 mmol), cloruro de amonio (0.10 g, 1.87 mmol) en etanol (20ml) y agua (10 ml) y se calentó a reflujo durante una hora. Luego de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla se filtró con succión y se extrajo con etil acetato. La capa orgánica se lavó con una salmuera saturada y luego se secó en sulfato de sodio anhidro y el solvente se evaporó a presión reducida para obtener 3-(2-aminobencil)-5,5-dimetil-[1,3]-oxazinan-2-tiona (0.60 g).

Rendimiento: 63% - Propiedades físicas: Punto de fusión 90.8-92.1°C

7-3) Producción de 5,5-dimetil-3-[2-(trifluorometanosulfonilamino)bencil]-[1,3]-oxazinan-2-tiona. (Compuesto No. 1-34)

Luego de disolver 3-(2-aminobencil)-5,5-dimetil-[1,3]-oxazinan-2-tiona (0.54 g, 2.16 mmol) y trietilamina (0.23 g, 2.28 mmol) en cloroformo (15 ml), la solución de la reacción se enfrió a -10°C. En seguida se agregó por goteo anhidruro trifluorometanosulfónico (0.64 g, 2.28 mmol) y se agitó a la temperatura que tenía durante una hora. Se agregó la mezcla de la reacción con ácido clorhídrico diluido y se extrajo con etil acetato. El solvente se evaporó a presión reducida luego de que la capa orgánica se secó en sulfato de sodio anhidro. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:etil acetato=2:1) para obtener 5,5-dimetil-3-[2-(trifluorometanosulfonilamino)bencil]-[1,3]-oxazinan-2-tiona (0.57 g).

20 Rendimiento: 69% - Propiedades físicas: punto de fusión 129.9°C

Ejemplo 8. Producción de 5,5-dimetil-3-(2-[N-(metoxycarbonilo)-N-(trifluorometanosulfonilo)amino]bencilo)-[1,3]-oxazinan-2-tiona. (Compuesto No. 1-35)

Se suspendió una mezcla de 5,5-dimetil-3-[2-(trifluorometanosulfonilamino) bencil]-[1,3]-oxazinan-2-tiona (0.15 g, 0.39 mmol) y carbonato de hidrógeno sódico (0.05 g, 0.60 mmol) en acetonitrilo (10 ml), se agregó con cloroformato de metilo (0.06 g, 0.60 mmol) y se calentó a reflujo durante tres horas. Luego de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de la reacción se agregó con agua y se extrajo con etil acetato. El solvente se evaporó a presión reducida luego de que la capa orgánica se secó en sulfato de sodio anhidro. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano: etil acetato=1:1) para obtener 5,5-dimetil-3-(2-[N-(metoxycarbonil)-N-

(trifluorometanosulfonil) amino]bencilo)-[1,3]-oxazinan-2-tiona (0.08 g)

Rendimiento: 47% - Propiedades físicas: n_D 1.5295 (26°C)

Ejemplo Referencial 1. Producción de 3-(2-

5 nitrobencilamino)propanol

Se disolvió una mezcla de 3-Aminopropanol (3.94 g, 52.5 mmol) y trietilamina (1.77 g, 17.5 mmol) en tetrahidrofurano (30 ml) y se agregó con 2-nitrobencil cloruro (3.00 g, 17.5 mmol) a temperatura ambiente. Luego de calentar a reflujo durante siete horas, se dejó enfriar la mezcla de la reacción y se vació en 1N de agua de ácido clorhídrico y se extajo con éter. La capa acuosa se ajustó a un pH de 9 con una solución acuosa de carbonato de hidrógeno sódico saturado y luego se extrajo con etil acetato. La capa orgánica se lavó con salmuera saturada y luego se secó en sulfato de sodio anhidro y el solvente se evaporó a presión reducida para obtener 3-(2-nitrobencilamino) propanol (1.22 g).

Rendimiento: 33% - Propiedades físicas: n_D 1.5489 (24°C)

20 Ejemplo Referencial 2. Producción de 3-(2-nitrobencilamino)-1-fenilopropanol

2-1) Producción de 3-hidroxi-N-(2-nitrobencil)-3-fenilo ácido propiónico amida

Se agregó 2-Nitrobencil amina hidrocloreuro (2.27 g, 12.0 mmol), 3-hidroxi-3-fenilo ácido propiónico (2.00 g, 12.0 mmol), trietilamina (1.34 g, 13.3 mmol) a tetrahidrofurano (50 ml) y se enfrió en hielo la mezcla de la reacción. En estado helado, se agregó lentamente 4-(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-ilo)-4-cloruro de metilmorfolino (3.33 g., 12.0 mmol) y se agitó a temperatura ambiente durante cinco horas. La mezcla de la reacción se vació en agua de ácido clorhídrico diluido y se extrajo con etil acetato. La capa orgánica se lavó con una salmuera saturada y luego se seco en sulfato de sodio anhidro y el solvente se evaporó a presión reducida. El cristal de crudo que se obtuvo se lavó con una mezcla de hexano-éter (2:1) para

obtener 3-hidroxi-N-(2-nitrobencil)-3-fenilo ácido propiónico amida (3.32 g).

Rendimiento: 92% - Propiedades físicas: Punto de fusión 145.1°C

5 2-2) Producción de 3-(2-nitrobencilamino)-1-fenilopropanol

Se disolvió 3-Hidroxi-N-(2-nitrobencilo)-3-fenilo ácido propiónico amida (3.19 g, 10.6 mmol) en tetrahidrofurano (50 ml) y en estado helado, se agregó por goteo un 1M de una solución de tetrahidrofuran-borano
10 tetrahidrofurano (27.0 ml, 27.0 mmol). Cuando se terminó de agregar este goteo, se devolvió la mezcla de la reacción a temperatura ambiente y se agitó durante una hora, luego se calentó a reflujo durante seis horas y se dejó enfriar. Se le agregó metanol (30 ml) bajo estado helado y se calentó a
15 reflujo durante 30 minutos. Luego de dejarse enfriar, se evaporó el solvente y se agregó 0.5N de agua de ácido clorhídrico (30 ml). Luego de extraerse con dietil éter, la capa acuosa se ajustó a un pH de 8 con una solución acuosa de carbonato de hidrógeno sódico saturado y se extrajo con
20 etil acetato. La capa orgánica se secó en sulfato de sodio anhidro y el solvente se evaporó a presión reducida para obtener 3-(2-nitrobencilamino)-1-fenilopropanol.

Rendimiento: 99% - Propiedades físicas: n_D 1.5537 (25°C)

Ejemplo referencial 3. Producción de 2-metil-4-(2-nitrobencilamino)butanol

Se disolvió 2-Nitrobenzaldehído (7.33 g, 48.5 mmol) y 4-amino-2-metilbutanol (5.00 g, 48.5 mmol) en tolueno (50 ml) y se calentó a reflujo durante dos horas con un aparato de deshidratación Dean Stark. Luego de dejarse enfriar, se evaporó el solvente a presión reducida. El concentrado obtenido se disolvió en metanol (100 ml), se agregó con borohidruro de sodio (2.75 g, 72.8 mmol) bajo estado helado y se agitó a la misma temperatura durante dos horas. La mezcla de la reacción se agitó nuevamente a temperatura ambiente durante dos horas, se ajustó el pH a 4 agregando 1N de ácido clorhídrico y el solvente se evaporó a presión reducida. Se agregó agua (30 ml) para disolver el concentrado y luego de extraerse con etil acetato, se ajustó el pH a 8 agregando una solución acuosa de carbonato de hidrógeno sódico saturado y se extrajo con etil acetato. La capa orgánica se secó en sulfato de sodio anhidro y el solvente se evaporó a presión reducida para obtener 2-metil-4-(2-nitrobencilamino)butanol (11.12 g).

Rendimiento: 96% - Propiedades físicas: n_D 1.5372 (24°C)

A continuación figuran ejemplos de formulación típica y ejemplos de prueba de la presente invención, pero la invención no se limita a estos ejemplos. En los ejemplos de formulación, partes significa partes por masa.

5 Ejemplo de Formulación 1. Concentrado emulsificable.

	Compuesto de la presente invención	10 partes
	Xileno	70 partes
	N-metilpirrolidona	10 partes
10	Mezcla de polioxietilen-nonilfenilo-éter y calcio alquilobencenosulfonato	10 partes

Se mezclan los anteriores ingredientes de manera uniforme para obtener un concentrado emulsificable.

Ejemplo de Formulación 2. Formulación de polvo

	Compuesto de la presente invención	3 partes
15	Polvo de arcilla	82 partes
	Polvo de tierra diatomácea	15 partes

Se mezclan los anteriores ingredientes de manera uniforme para obtener una formulación de polvo.

Ejemplo de Formulación 3. Gránulo

20	Compuesto de la presente invención	5 partes
	Polvo mezclado de bentonita y arcilla	90 partes
	Ligningulfonato de calcio	5 partes

Se mezclan los anteriores ingredientes de manera uniforme, se amasa la mezcla con una cantidad apropiada de agua y se granula el producto amasado y se seca para obtener los gránulos.

Ejemplo de Formulación 4. Polvo humectable

	Compuesto de la presente invención	20 partes
30	Caolín y ácido silícico sintético altamente disperso	75 partes
	Mezcla de polioxietilen nonilfenilo éter y alquilobencenosulfonato de calcio	5 partes

Se mezclan los anteriores ingredientes de manera uniforme para obtener un polvo humectable.

Ejemplo de Prueba 1. Eficacia herbicida en malezas de arrozales de etapa pre-emergencia (pre)

- 5 Se llenaron macetas plásticas de 75 cm² con la tierra (greda de arcilla). Se sembraron semillas de Scirpus juncoides, una maleza de arrozal y se cubrieron con 75 cm³ de tierra mezclada con semillas de Lindernia procumbens y luego se llenaron con agua a una profundidad de 5 cm. Al
- 10 día siguiente, una dosis efectiva predeterminada (1000 g/ha como ingrediente activo) de formulaciones que comprendían un compuesto de la presente invención como ingrediente activo el cual se preparó siguiendo los Ejemplos de
- 15 Formulación 1 a 4 se diluyó en agua y se aplicó por goteo hasta la superficie del agua. Luego se llevaron las macetas a un vivero y se examinó el efecto herbicida luego de 21 días de tratamiento comparando con el resultado de un grupo sin tratar de acuerdo con el siguiente criterio. La Tabla 8 muestra los resultados. En la tabla, "-" significa que la
- 20 prueba no se hizo.

Criterios para eficacia herbicida (grado de inhibición del crecimiento) y fitotoxicidad.

- 5 ... 100% efecto herbicida, fitotoxicidad
- 4 ... 90% - 99% efecto herbicida, fitotoxicidad
- 25 3 ... 70% - 89% efecto herbicida, fitotoxicidad
- 2 ... 40% - 69% efecto herbicida, fitotoxicidad
- 1 ... 1% - 39% efecto herbicida, fototoxicidad
- 0 ... 0% efecto herbicida, fitotoxicidad

- Ejemplo de Prueba 2. Efecto herbicida en malezas de
- 30 arrozales de etapa pos-emergencia (post)

- Se llenaron macetas plásticas de 75 cm² con la tierra (greda de arcilla). Se sembraron semillas de Scirpus juncoides y Echinochloa crus-galli, malezas de arrozal y se cubrieron con 75 cm³ de tierra mezclada con semillas de
- 35 Lindernia procumbens y luego se llenaron con agua a una profundidad de 5 cm. Luego se llevaron las macetas a un

vivero. Cuando las plantas de prueba estaban en la etapa de una hoja, se aplicó al agua de maceta una dosis efectiva predeterminada (1000 g/ha como ingrediente activo) de formulaciones que comprendían un compuesto de la presente invención como ingrediente activo. Luego se llevaron las macetas a un vivero y se examinó el efecto herbicida luego de 21 días de tratamiento comparando con el resultado de un grupo sin tratar de acuerdo con criterio del Ejemplo de Prueba 1. La Tabla 8 muestra los resultados. En la tabla, "-" significa que la prueba no se hizo.

Ejemplo de Prueba 3. Prueba de fitotoxicidad en arroz-arrozal transplantado.

Se llenaron macetas plásticas de 75 cm² con la tierra (greda de arcilla) y se llenaron con agua a una profundidad de 5 cm. y se transplantaron allí 2 semillas de planta de arroz (especie: *Nihonbare*) cuando las plantas estaban en la etapa de dos hojas. Luego se llevaron las macetas a un vivero y luego de cinco días siguientes al transplante se aplicó al agua de maceta una dosis efectiva predeterminada (1000 g/ha en términos de ingrediente activo) de formulaciones que comprendían un compuesto de la presente invención como ingrediente activo. Luego se llevaron a un vivero y se examinó la fitotoxicidad luego de 21 días siguientes al tratamiento comparando con el resultado de un grupo sin tratar de acuerdo con el criterio del Ejemplo de Prueba 1. La Tabla 8 muestra los resultados. En la tabla, "-" significa que la prueba no se hizo.

[Tabla 8-1]

Tabla 8

Compuesto No.	Arroz	Echinochloa crus-galli post	Scirpus juncoides pre	Scirpus juncoides post	Lindernia procumbens pre	Lindernia procumbens post
1-1	3	4	4	4	4	4
1-4	3	4	4	4	4	4
1-5	3	4	4	4	4	4
1-6	3	4	4	4	4	4
1-16	3	4	4	4	4	4
1-17	3	4	4	4	4	4
1-23	2	4	4	4	4	4
1-25	3	4	4	4	4	4
1-26	2	4	4	4	4	4
1-27	2	4	4	4	4	4
1-28	2	4	4	4	4	4
1-34	2	4	4	4	4	4
1-35	2	4	4	4	4	4
1-36	2	4	4	4	4	4
1-39	2	4	4	4	4	4
1-45	2	4	4	4	4	4
1-47	3	4	4	4	4	4
1-50	3	4	4	4	4	4
1-51	3	4	4	4	4	4
1-52	3	4	4	4	4	4
1-53	2	4	4	4	4	4
1-54	1	-	4	4	-	-
1-55	2	4	4	4	4	4
1-58	2	4	4	4	4	4
1-63	2	4	4	4	4	4
1-64	2	4	4	4	4	4
1-69	3	4	4	4	4	4
1-71	3	4	4	4	4	4
1-74	3	4	4	4	4	4
1-75	3	4	4	4	4	4
1-80	1	4	4	4	4	-
1-81	1	4	4	4	5	5
1-82	0	4	5	4	5	5
1-85	1	4	4	4	4	-
1-86	0	4	4	4	4	4
1-91	1	4	4	4	5	5
1-92	1	4	4	4	5	5

[Tabla 8-2]

Tabla 8 (continuación)

Compuesto No.	Arroz	Echinochloa crus-galli post	Scirpus juncoides pre	Scirpus juncoides post	Lindernia procumbens pre	Lindernia procumbens post
1-93	1	4	5	4	5	5
1-94	1	-	5	4	5	5
1-95	1	-	5	4	5	5
1-96	0	4	4	4	5	5
1-100	0	4	4	-	5	4
1-102	4	4	4	4	4	4
1-104	2	4	4	4	4	4
1-107	2	4	4	4	4	4
1-108	1	-	4	4	4	4
1-109	1	4	4	4	4	4
1-114	2	4	4	4	4	4
1-119	1	-	4	4	4	4
1-120	1	4	4	4	4	4
1-125	2	4	4	4	4	4
1-130	2	4	4	4	4	4
1-131	2	4	4	4	4	4
1-136	2	4	4	4	4	4
1-137	2	4	4	4	4	4
1-142	2	4	4	4	4	4
1-143	2	4	4	4	4	4
1-144	1	-	4	4	4	4
1-145	0	-	4	4	-	-
1-149	0	-	-	-	-	-
1-154	0	-	-	-	4	-
1-155	0	-	4	4	4	4
1-160	2	-	4	4	4	4
1-162	2	-	4	4	4	4
1-165	2	-	4	4	4	-
1-167	0	-	4	-	-	-
1-171	0	-	-	-	-	-
1-172	1	-	4	4	4	4
1-174	1	-	4	4	4	4
1-177	1	-	4	4	4	4
1-183	1	-	4	4	4	4
1-185	1	4	4	4	4	4
1-188	1	4	4	4	4	-
1-191	0	4	-	-	4	-
1-194	0	-	-	-	-	-
1-195	0	-	4	4	4	4

[Tabla 8-3]

Tabla 8 (continuación)

Compuesto No.	Arroz	Echinochloa crus-galli post	Scirpus juncoides pre	Scirpus juncoides post	Lindernia procumbens pre	Lindernia procumbens post
1-197	0	-	4	4	4	4
1-206	2	-	4	4	4	4
1-208	1	4	4	4	4	4
1-211	0	4	4	4	4	4
1-217	0	-	4	4	4	4
1-219	0	-	4	4	4	4
1-224	0	-	-	-	4	-
1-228	1	-	5	4	5	5
1-230	1	4	5	4	5	5
1-239	1	4	-	4	5	5
1-241	1	4	-	4	5	5
1-244	0	-	-	-	5	5
1-246	0	-	-	-	5	-
1-248	0	4	-	-	-	5
1-250	1	-	5	5	5	5
1-252	1	-	4	4	5	5
1-255	0	-	-	-	5	5
1-257	0	-	4	-	5	5
1-261	1	4	5	4	5	5
1-263	1	4	4	4	5	5
1-268	0	-	4	4	5	5
1-270	1	-	-	4	5	5
1-272	1	4	4	4	5	5
1-274	1	4	4	4	5	5
1-279	1	-	-	4	5	5
1-281	0	-	-	4	5	5
1-283	1	4	5	4	5	5
1-285	1	4	4	4	5	5
1-290	0	-	-	4	5	5
1-292	1	4	-	4	5	5
1-294	1	-	4	4	5	5
1-296	2	4	4	4	5	5
1-301	0	-	-	-	5	5
1-303	1	4	-	4	5	5
1-305	1	-	4	4	5	5
1-307	0	-	4	4	5	5
1-312	0	-	-	-	5	5
1-314	1	-	4	-	5	5

[Tabla 8-4]

Tabla 8 (continuación)

Compuesto No.	Arroz	Echinochloa crus-galli post	Scirpus juncoides pre	Scirpus juncoides post	Lindernia procumbens pre	Lindernia procumbens post
1-316	1	4	4	4	5	5
1-317	1	4	4	4	5	5
1-318	1	4	4	4	5	5
1-321	1	4	4	4	5	5
1-323	0	-	-	-	5	5
1-327	4	4	5	4	5	5
1-329	2	4	5	4	5	5
1-332	3	4	5	4	5	5
1-338	0	-	4	4	4	5
1-339	0	4	4	4	5	5
1-340	0	4	4	4	5	-
1-343	0	4	5	4	5	5
1-349	3	-	5	-	5	5
1-350	2	-	5	4	5	5
1-351	1	-	4	4	5	5
1-360	1	-	5	4	5	5
1-361	1	4	5	4	5	5
1-362	1	4	4	4	5	5
1-369	0	-	-	4	5	5
1-371	4	4	5	4	5	5
1-373	3	4	5	4	5	5
1-376	4	4	5	4	5	5
1-377	3	-	4	4	5	5
1-382	4	4	5	4	5	5
1-384	4	4	5	4	5	5
1-387	4	5	5	5	5	5
1-388	2	5	5	4	5	5
1-393	1	-	5	4	5	5
1-394	1	4	5	4	5	5
1-395	1	4	5	4	5	5
1-404	1	-	4	4	5	5
1-406	1	5	5	4	5	5
1-415	1	5	5	4	5	5
1-416	1	5	5	4	5	-
1-417	4	4	5	4	5	5
1-419	4	-	5	4	5	5
1-422	4	-	5	4	5	5
1-423	4	-	4	4	5	5

[Tabla 8-5]

Tabla 8 (continuación)

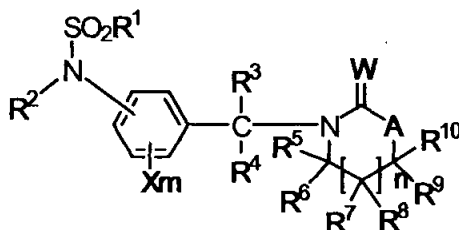
Compuesto No.	Arroz	Echinochloa crus-galli post	Scirpus juncoides pre	Scirpus juncoides post	Lindernia procumbens pre	Lindernia procumbens post
1-428	1	-	5	4	5	5
1-429	1	-	4	4	5	5
1-430	1	4	5	4	5	5
1-439	2	-	5	4	5	5
1-440	2	4	4	4	5	5
1-441	1	5	5	4	5	5
1-450	4	4	5	4	5	5
1-452	4	4	5	4	5	5
1-455	3	5	5	4	5	5
1-456	3	-	5	4	5	5
1-461	1	-	5	4	5	5
1-463	1	4	5	4	5	5
1-494	4	4	5	4	5	5
1-496	3	4	5	4	5	5
1-499	3	4	5	4	5	5
1-501	3	5	5	4	5	5
1-506	4	4	5	4	5	5
2-1	3	4	4	4	4	4
2-3	2	4	4	4	4	4
2-4	2	4	4	4	4	4
2-5	2	4	4	4	4	4
2-6	2	4	4	4	4	4
2-12	1	4	4	4	4	-
2-14	1	4	4	4	4	4
2-17	0	4	4	4	-	-
2-23	3	4	4	4	4	4
2-24	3	4	4	4	4	4
2-25	3	4	4	4	4	4
2-27	2	4	4	4	4	4
2-28	3	4	4	4	4	4
2-34	2	4	4	4	4	4

REIVINDICACIONES

1. Un derivado de haloalquilosulfonanilida representado por la fórmula general (I)

[Fórmula 1]

5



- en donde R^1 representa un grupo halo-alquilo (C_1-C_8);
- 10 R^2 representa un átomo de hidrógeno; un grupo alcoxycarbonilo (C_1-C_6); un grupo alquilocarbonilo (C_1-C_{18}); un grupo halo-alquilocarbonilo (C_1-C_6); un grupo fenilocarbonilo; un grupo fenilocarbonilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, los cuales
- 15 pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo alcoxycarbonilo (C_1-C_{18}); un grupo alquenciloxycarbonilo (C_2-C_{18}); un grupo alquenciloxycarbonilo (C_2-C_{18}); un grupo halo-alcoxycarbonilo (C_1-C_6); un grupo alcoxycarbonilo (C_1-C_6); un grupo alquiltio (C_1-C_6); un grupo alquiltio (C_1-C_6); un grupo alquilosulfinilo (C_1-C_6); un grupo alquilosulfinilo (C_1-C_6); un grupo alquilosulfonilo (C_1-C_6); un grupo alquilosulfonilo (C_1-C_6); un grupo fenoxycarbonilo; un grupo fenoxycarbonilo sustituido que tiene de 1 a 5
- 25 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo fenoxi-alquilocarbonilo (C_1-C_6); un grupo fenoxi-alquilocarbonilo (C_1-C_6) sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo benciloxycarbonilo; un grupo benciloxycarbonilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo alquiltiocarbonilo (C_1-C_6); un grupo
- 30 alquilosulfonilo (C_1-C_6); un grupo halo-alquilosulfonilo (C_1-C_6); un grupo fenilosulfonilo; un grupo fenilosulfonilo
- 35

- sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo alquilo(C₁-C₆); un grupo alqueno(C₂-C₆); un grupo alquino(C₂-C₆); un grupo fenilo-alquilo(C₁-C₆); un grupo fenilo-alquilo(C₁-C₆) sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo fenilocarbonilo-alquilo(C₁-C₆); un grupo fenilocarbonilo-alquilo(C₁-C₆) sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo alcoxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo alcoxi(C₁-C₆)alcoxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo tri-alquilosilil(C₁-C₆)alcoxi(C₁-C₆) alquilo(C₁-C₆) que puede ser el mismo o diferente; un grupo fenilo-alcoxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo fenilo-alcoxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆) sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo alquilocarboniloxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo fenilocarboniloxi-alquilo(C₁-C₆); un grupo fenilocarboniloxi-alquilo(C₁-C₆) sustituido en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo fenilocarboniloxi-alcoxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo fenilocarboniloxi-alcoxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆) sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo alcoxicarboniloxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo mono-alquiloaminocarboniloxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo di-alquiloaminocarboniloxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆) que pueden ser los mismos o diferentes y pueden enlazarse entre sí para formar un anillo de 5 a 8 miembros; un grupo feniloaminocarboniloxi-alquilo(C₁-C₆); un grupo feniloaminocarboniloxi-alquilo (C₁-C₆) sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo N-alquilo(C₁-C₆)-N-feniloaminocarboniloxi-alquilo(C₁-C₆); un grupo N-alquilo(C₁-C₆)-N-fenilo aminocarboniloxi-alquilo(C₁-C₆) que tiene de 1 a 5

- sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo feniltio-alquilo(C₁-C₆); un grupo feniltio-alquilo(C₁-C₆) sustituido que tiene de 1 a 5
- 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo fenilosulfonilo-alquilo(C₁-C₆); un grupo fenilosulfonilo-alquilo(C₁-C₆) sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos
- 10 o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo fenilo-alquiltio(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo fenilo-alquiltio(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆) sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y
- 15 según se define a continuación; un grupo fenilo-alquilosulfonilo(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo fenilo-alquilosulfonilo(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆) sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a
- 20 continuación; un grupo alquiltio(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo halo-alquiltio(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo tiocianato-alquilo(C₁-C₆); un grupo alquilo(C₁-C₆) heterocíclico, en donde el heterociclo representa piridina, piridina-N-óxido, pirimidina, pirazina, triazina, furano,
- 25 tetrahydrofurano, tiofeno, tetrahidrotiofeno, tetrahidropirano, tetrahidrotiopirano, oxazol, isoxazol, oxadiazol, tiazol, isotiazol, tiadiazol, imidazol, triazol, pirazol, pirrol, pirrolidina, ftalimida o 2,3-dihidro-1,2-benzotiazol-3-ona 1,1-dioxida; o un grupo alquilo(C₁-C₆)
- 30 heterocíclico que tiene de 1 a 4 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación, en donde el heterociclo es el mismo que arriba,

- R³ y R⁴, que pueden ser el mismo o diferentes, cada uno
- 35 representa un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo(C₁-C₆); un grupo cicloalquilo(C₃-C₆); un grupo alcoxi(C₁-C₆); un átomo de halógeno o un grupo ciano, y R³ y R⁴ pueden estar enlazados entre sí para formar un anillo de 3 a 7 miembros;

R^5 y R^6 , que pueden ser el mismo o diferentes, cada uno representa un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo (C_1-C_6); un grupo cicloalquilo (C_3-C_6); un grupo alcoxi (C_1-C_6); un átomo de halógeno; o un grupo ciano;

- 5 R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} , que pueden ser el mismo o diferentes, cada uno representa un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; un grupo alquilo (C_1-C_6); un grupo cicloalquilo (C_3-C_6); un grupo alcoxi (C_1-C_6); un grupo halo-alquilo (C_1-C_6); un grupo alcoxi (C_1-C_6) alquilo (C_1-C_6); un grupo
- 10 alquilocarboniloxi (C_1-C_6) alquilo (C_1-C_6); un grupo mono-alquiloamino (C_1-C_6) alquilo (C_1-C_6); un grupo di-alquiloamino (C_1-C_6) alquilo (C_1-C_6) que puede ser el mismo o diferente; un grupo mono-alquiloaminocarbonilo (C_1-
- 15 C_6) alquilo (C_1-C_6); un grupo di-alquiloaminocarbonilo (C_1-C_6) alquilo (C_1-C_6) que pueden ser los mismos o diferentes; un grupo fenilo-alquilo (C_1-C_6); un grupo fenilo-alquilo (C_1-C_6) sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo fenoxi-alquilo (C_1-
- 20 C_6); un grupo fenoxi-alquilo (C_1-C_6) sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo fenilo; un grupo fenilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden
- 25 ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo alcoxicarbonilo (C_1-C_6); un grupo mono-alquiloaminocarbonilo (C_1-C_6); un grupo di-alquiloaminocarbonilo (C_1-C_6) que puede ser el mismo o diferente; un grupo hidroxilo; o un grupo ciano, y R^5 , R^6 ,
- 30 R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} pueden estar enlazados respectivamente a un sustituyente adyacente para formar un anillo de 3 a 7 miembros por medio de un grupo alquilenilo (C_1-C_4) que pueden ser los mismos o diferentes y puede interrumpirse con uno o dos heteroátomos seleccionados de un átomo de oxígeno, un
- 35 átomo de azufre, o un átomo de nitrógeno; en donde el átomo de nitrógeno puede ser sustituido con un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo (C_1-C_6), un grupo alquilenilo (C_2-

C₆), un grupo alquinilo(C₂-C₆) o un grupo ciclo-alquilo(C₃-C₆);

n representa 1 ó 2;

A representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

5 W representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

X puede ser el mismo o diferente y representa un átomo de halógeno; un grupo alquilo(C₁-C₆); un grupo alquenilo(C₂-C₆); un grupo alquinilo(C₂-C₆); un grupo ciclo-alquilo (C₃-C₆); un grupo halo-alquilo (C₁-C₆); un grupo ciclohalo-
10 alquilo(C₃-C₆); un grupo alcoxi(C₁-C₆); un grupo halo-alcoxi(C₁-C₆); un grupo alcoxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo halo-alcoxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo alquiltio(C₁-C₆); un grupo halo-alquiltio(C₁-C₆); un grupo alquiltio(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo halo-alquiltio(C₁-C₆)alquilo(C₁-
15 C₆); un grupo alquilosulfinilo(C₁-C₆); un grupo halo-alquilosulfinilo(C₁-C₆); un grupo alquilosulfonilo(C₁-C₆); un grupo halo-alquilosulfonilo(C₁-C₆); un grupo fenilo; un grupo fenilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y
20 según se define a continuación; un grupo fenoxi; un grupo fenoxi sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo feniltio; un grupo feniltio sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que
25 pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo fenilosulfinilo; un grupo fenilosulfinilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo
30 fenilosulfonilo; un grupo fenilosulfonilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo fenilocarbonilo; un
35 grupo fenilocarbonilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y según se define a continuación; un grupo alcoxicarbonilo(C₁-C₆); un grupo carboxilo; un grupo mono-

alquiloaminocarbonilo(C_1-C_6); un grupo di-alquilo
 aminocarbonilo(C_1-C_6) que puede ser el mismo o diferente; un
 grupo feniloaminocarbonilo; un grupo feniloaminocarbonilo
 sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo,
 5 que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de Y
 según se define a continuación; un grupo fenilo-
 alquiloaminocarbonilo(C_1-C_6); un grupo fenilo-
 alquiloaminocarbonilo(C_1-C_6) sustituido que tiene de 1 a 5
 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o
 10 diferentes, seleccionado de Y según se define a
 continuación; un grupo hidroxilo o un grupo ciano; y m
 representa un entero de 0 a 4, y X puede tomarse junto con
 un átomo de carbono adyacente en el anillo de benceno para
 formar un anillo de 5 o 6 miembros por medio de un grupo
 15 alquilenilo(C_1-C_4) que pueden ser los mismos o diferentes y
 puede interrumpirse con uno o dos heteroátomos
 seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, o
 un átomo de nitrógeno el cual puede ser sustituido con un
 átomo de hidrógeno, un grupo alquilo(C_1-C_6), un grupo
 20 alquenilo(C_2-C_6), un grupo alquinilo(C_2-C_6) o un grupo
 ciclo-alquilo(C_3-C_6);

Y, que puede ser el mismo o diferente, representa de 1
 a 5 sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno; un
 grupo nitro; un grupo alquilo(C_1-C_6); un grupo alquenilo(C_2-
 25 C_6); un grupo alquinilo(C_2-C_6); un grupo ciclo-alquilo(C_3-
 C_6); un grupo halo-alquilo(C_1-C_6); un grupo ciclohalo-
 alquilo(C_3-C_6); un grupo alcoxi(C_1-C_6); un grupo halo-
 alcoxi(C_1-C_6); un grupo ciano-alcoxi(C_1-C_6); un grupo
 alcoxi(C_1-C_6)alcoxi(C_1-C_6); un grupo alquiltio(C_1-C_6); un
 30 grupo halo-alquiltio(C_1-C_6); un grupo alquilosulfinilo(C_1-
 C_6); un grupo halo-alquilosulfinilo(C_1-C_6); un grupo
 alquilosulfonilo(C_1-C_6); un grupo halo-alquilosulfonilo(C_1-
 C_6); un grupo fenilo; un grupo fenilo sustituido que tiene
 de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o
 35 diferentes, seleccionado de un átomo de halógeno, un grupo
 alquilo(C_1-C_6), un grupo alquenilo(C_2-C_6), un grupo
 alquinilo(C_2-C_6), un grupo ciclo-alquilo(C_3-C_6), un grupo
 halo-alquilo(C_1-C_6), un grupo ciclohalo-alquilo(C_3-C_6), un

- grupo alcoxi(C₁-C₆), un grupo halo-alcoxi(C₁-C₆), un grupo alquiltio (C₁-C₆), un grupo halo-alquiltio(C₁-C₆), un grupo alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo halo-
- 5 alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo alcoxicarbonilo(C₁-C₆), un grupo carboxilo, un grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆), un grupo di-
- 10 alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆) que puede ser el mismo o diferente, un grupo hidroxilo o un grupo ciano; un grupo heterocíclico que representa un grupo piridilo, un grupo piridin-N-óxido, un grupo pirimidinilo, un grupo pirazinilo, un grupo triazinilo, un grupo furilo, un grupo tetrahidrofurilo, un grupo tienilo, un grupo
- 15 tetrahidrotienilo, un grupo tetrahidropiranilo, un grupo tetrahidrotiopiranilo, un grupo oxazolilo, un grupo isooxazolilo, un grupo oxadiazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo tiadiazolilo, un grupo imidazolilo, un grupo triazolilo, un grupo pirazolilo, un
- 20 grupo pirrolilo o un grupo pirrolidinilo; un grupo heterocíclico sustituido según se define arriba, que tiene uno o más sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de un átomo de halógeno, un grupo alquilo(C₁-C₆), un grupo alquenilo(C₂-C₆), un grupo
- 25 alquinilo(C₂-C₆) un grupo ciclo-alquilo(C₃-C₆), un grupo halo-alquilo(C₁-C₆), un grupo ciclohalo-alquilo(C₃-C₆), un grupo alcoxi(C₁-C₆), un grupo halo-alcoxi(C₁-C₆), un grupo alquiltio(C₁-C₆), un grupo halo-alquiltio(C₁-C₆), un grupo alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfinilo(C₁-
- 30 C₆), un grupo alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo alcoxicarbonilo(C₁-C₆), un grupo carboxilo, un grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆), un grupo di-
- 35 alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆) que puede ser el mismo o diferente, un grupo hidroxilo o un grupo ciano; un grupo fenoxi; un grupo fenoxi sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de un átomo de halógeno, un grupo alquilo(C₁-

- C₆), un grupo alqueno(C₂-C₆), un grupo alquino(C₂-C₆), un grupo ciclo-alquilo(C₃-C₆), un grupo halo-alquilo(C₁-C₆), un grupo ciclohalo-alquilo(C₃-C₆), un grupo alcoxi(C₁-C₆), un grupo halo-alcoxi(C₁-C₆), un grupo alquiltio(C₁-C₆), un
- 5 grupo halo-alquiltio (C₁-C₆), un grupo alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo halo-
- 10 alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo alcoxicarbonilo, un grupo carboxilo, un grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆), un grupo di-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆) el cual puede ser el mismo o diferente, un grupo hidroxilo o un grupo ciano; un grupo feniltio; un grupo feniltio sustituido que tiene de 1
- 15 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de un átomo de halógeno, un grupo alquilo(C₁-C₆), un grupo alqueno(C₂-C₆), un grupo alquino(C₂-C₆), un grupo ciclo-alquilo(C₃-C₆), un grupo halo-alquilo(C₁-C₆), un grupo ciclohalo-alquilo(C₃-C₆), un grupo alcoxi(C₁-C₆), un grupo halo-alcoxi(C₁-C₆), un grupo alquiltio(C₁-C₆), un
- 20 grupo halo-alquiltio(C₁-C₆), un grupo alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo halo-
- 25 alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo alcoxicarbonilo(C₁-C₆), un grupo carboxilo, un grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆), un grupo di-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆) que puede ser el mismo o diferente, un grupo hidroxilo o un grupo ciano(C₁-C₆); un grupo fenilosulfinilo; un grupo fenilosulfinilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser
- 30 los mismos o diferentes, seleccionado de un átomo de halógeno, un grupo alquilo(C₁-C₆), un grupo alqueno(C₂-C₆), un grupo alquino(C₂-C₆), un grupo ciclo-alquilo(C₃-C₆), un grupo halo-alquilo(C₁-C₆), un grupo ciclohalo-
- 35 alquilo(C₃-C₆), un grupo alcoxi(C₁-C₆), un grupo halo-alcoxi(C₁-C₆), un grupo alquiltio(C₁-C₆), un grupo halo-alquiltio(C₁-C₆), un grupo alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilocarbonilo(C₁-

C₆), un grupo alcoxycarbonilo(C₁-C₆), un grupo carboxilo, un grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆), un grupo di-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆) el cual puede ser el mismo o diferente, un grupo hidroxilo o un grupo ciano; un grupo
5 fenilosulfonilo; un grupo fenilosulfonilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de un átomo de halógeno, un grupo alquilo(C₁-C₆), un grupo alqueno(C₂-C₆), un grupo alquino(C₂-C₆), un grupo ciclo-alquilo(C₁-C₆), un grupo
10 halo-alquilo(C₁-C₆), un grupo ciclohalo-alquilo(C₃-C₆), un grupo alcoxi(C₁-C₆); un grupo halo-alcoxi(C₁-C₆); un grupo alquiltio(C₁-C₆), un grupo halo-alquiltio(C₁-C₆); un grupo alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo halo-
15 alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo alcoxycarbonilo(C₁-C₆), un grupo carboxilo, un grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆), un grupo di-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆) que puede ser el mismo o
20 diferente, un grupo hidroxilo o un grupo ciano; un grupo alquilocarbonilo(C₁-C₆); un grupo halo-alquilocarbonilo(C₁-C₆); un grupo fenilocarbonilo; un grupo fenilocarbonilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de un átomo de
25 halógeno, un grupo alquilo(C₁-C₆), un grupo alqueno(C₂-C₆), un grupo alquino(C₂-C₆), un grupo ciclo-alquilo(C₃-C₆), un grupo halo-alquilo(C₁-C₆), un grupo ciclohalo-alquilo(C₃-C₆), un grupo alcoxi(C₁-C₆), un grupo halo-alcoxi(C₁-C₆), un grupo alquiltio(C₁-C₆), un grupo halo-
30 alquiltio(C₁-C₆), un grupo alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfinilo(C₁-C₆), un grupo alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilosulfonilo(C₁-C₆), un grupo alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilocarbonilo(C₁-C₆), un grupo alcoxycarbonilo(C₁-C₆), un grupo carboxilo, un
35 grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆), un grupo di-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆) que puede ser el mismo o diferente, un grupo hidroxilo o un grupo ciano; un grupo alcoxycarbonilo(C₁-C₆), un grupo carboxilo; un grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C₁-C₆), un grupo di-

- alquiloaminocarbonilo(C_1-C_6) que puede ser el mismo o diferente; un grupo feniloaminocarbonilo; un grupo feniloaminocarbonilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o
- 5 diferentes, seleccionado de un átomo de halógeno, un grupo alquilo(C_1-C_6), un grupo alqueno(C_2-C_6), un grupo alquino(C_2-C_6), un grupo ciclo-alquilo(C_3-C_6), un grupo halo-alquilo(C_1-C_6), un grupo ciclohalo-alquilo(C_3-C_6), un grupo alcoxi(C_1-C_6), un grupo halo-alcoxi(C_1-C_6), un grupo
- 10 alquiltio(C_1-C_6), un grupo halo-alquiltio(C_1-C_6), un grupo alquilosulfinilo(C_1-C_6), un grupo halo-alquilosulfinilo(C_1-C_6), un grupo alquilosulfonilo(C_1-C_6), un grupo halo-alquilosulfonilo(C_1-C_6), un grupo alquilocarbonilo(C_1-C_6), un grupo halo-alquilocarbonilo(C_1-C_6), un grupo
- 15 alcóxicarbonilo(C_1-C_6), un grupo carboxilo, un grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C_1-C_6), un grupo di-alquiloaminocarbonilo(C_1-C_6) que puede ser el mismo o diferente, un grupo hidroxilo o un grupo ciano; un grupo fenilo-alquiloaminocarbonilo(C_1-C_6); un grupo fenilo-
- 20 alquiloaminocarbonilo(C_1-C_6) sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de un átomo de halógeno, un grupo alquilo(C_1-C_6), un grupo alqueno(C_2-C_6), un grupo alquino(C_2-C_6), un grupo ciclo-alquilo(C_3-C_6), un grupo
- 25 halo-alquilo(C_1-C_6), un grupo ciclohalo-alquilo(C_3-C_6), un grupo alcoxi(C_1-C_6), un grupo halo-alcoxi(C_1-C_6), un grupo alquiltio(C_1-C_6), un grupo halo-alquiltio(C_1-C_6), un grupo alquilosulfinilo(C_1-C_6), un grupo halo-alquilosulfinilo(C_1-C_6) un grupo alquilosulfonilo(C_1-C_6), un grupo halo-
- 30 alquilosulfonilo(C_1-C_6), un grupo alquilocarbonilo(C_1-C_6), un grupo halo-alquilocarbonilo(C_1-C_6), un grupo alcóxicarbonilo(C_1-C_6), un grupo carboxilo, un grupo mono-alquiloaminocarbonilo(C_1-C_6), un grupo di-
- 35 alquiloaminocarbonilo(C_1-C_6) que puede ser el mismo o diferente, un grupo hidroxilo o un grupo ciano; un grupo hidroxilo o un grupo ciano, y Y puede tomarse junto con un átomo de carbono adyacente en el anillo de benceno para formar un anillo de 5 ó 6 miembros por medio de un grupo alquilenio(C_1-C_4) que puede ser el mismo o diferente y puede

- ser interrumpido con uno o dos heteroátomos seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, o un átomo de nitrógeno el cual puede ser sustituido con un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo(C₁-C₆), un grupo alqueno(C₂-C₆), un grupo alquínico(C₂-C₆) o un grupo ciclo-alquilo(C₃-C₆), o una sal del mismo.
2. El derivado de haloalquilosulfonanilida o una sal del mismo según la reivindicación 1, en donde R¹ es un grupo fluoro-alquilo(C₁-C₆); R² es un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo(C₁-C₆); un grupo alcóxicarbonilo(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo alquilcarbonilo(C₁-C₁₈); un grupo halo-alquilcarbonilo(C₁-C₆); un grupo alcóxicarbonilo(C₁-C₁₈); un grupo halo-alcóxicarbonilo(C₁-C₆); un grupo alcóxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo alcóxi(C₁-C₆)alcóxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo alquilcarboniloxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); o un grupo alcóxicarboniloxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); R³, R⁴, R⁵ y R⁶ son átomos de hidrógeno; R⁷ y R⁸, que pueden ser el mismo o diferente, cada uno representa un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; un grupo alquilo(C₁-C₆); un grupo cicloalquilo(C₃-C₆); un grupo alcóxi(C₁-C₆); un grupo halo-alquilo(C₁-C₆); o un grupo alcóxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); R⁹ y R¹⁰, que pueden ser el mismo o diferente, cada uno representa un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno, un grupo alquilo(C₁-C₆); un grupo cicloalquilo(C₃-C₆); un grupo alcóxi(C₁-C₆); un grupo halo-alquilo(C₁-C₆); un grupo alcóxi(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₆); un grupo fenilo-alquilo(C₁-C₆); un grupo fenilo-alquilo(C₁-C₆) sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes en el anillo, los cuales pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de un átomo de halógeno, un grupo alquilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilo(C₁-C₆), un grupo alcóxi(C₁-C₆) o un grupo halo-alcóxi(C₁-C₆); un grupo fenilo; un grupo fenilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo alquilo(C₁-C₆), un grupo halo-alquilo(C₁-C₆), un grupo alcóxi(C₁-C₆) o un grupo halo-alcóxi(C₁-C₆), y R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ pueden estar enlazados respectivamente a un sustituyente adyacente entre sí para formar un anillo de 3 a 7 miembros por medio de un grupo

alquilenos(C_1-C_4); m representa 0; A representa un átomo de oxígeno; y W representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre.

3. El derivado de haloalquilosulfonanilida o una sal del mismo según la reivindicación 1, en donde R^1 es un grupo trifluorometilo; R^2 es un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo(C_1-C_6); un grupo alcóxicarbonilo(C_1-C_{18}); un grupo halo-alcóxicarbonilo(C_1-C_6); un grupo alcóxi(C_1-C_8)alquilo(C_1-C_6); o un grupo alquilocarbonilo(C_1-C_6)alquilo(C_1-C_6); R^3 , R^4 , R^5 y R^6 son átomos de hidrógeno; R^7 y R^8 , que pueden ser el mismo o diferente, cada uno representa un átomo de hidrógeno; o un grupo alquilo(C_1-C_6); R^9 y R^{10} que pueden ser el mismo o diferente, cada uno representa un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo(C_1-C_6); un grupo cicloalquilo(C_3-C_6); un grupo halo-alquilo(C_1-C_6); un grupo fenilo; un grupo fenilo sustituido que tiene de 1 a 5 sustituyentes, que pueden ser los mismos o diferentes, seleccionado de un átomo de halógeno, un grupo alquilo(C_1-C_6) o un grupo alcóxi(C_1-C_6), y R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} pueden estar enlazados a un sustituyente adyacente entre sí para formar un anillo de 6 a 7 miembros por medio de un grupo alquilenos(C_1-C_4) el cual puede ser el mismo o diferente y puede interrumpirse con uno o dos heteroátomos seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, o un átomo de nitrógeno el cual puede ser sustituido con un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo(C_1-C_6); m representa 0; A representa un átomo de oxígeno y W representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre.

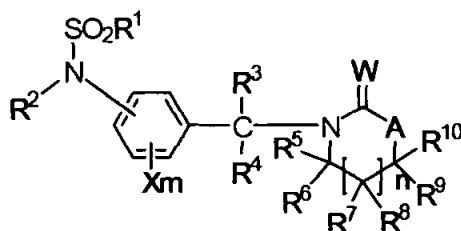
4. Un herbicida caracterizado porque comprende, como ingrediente activo, un derivado de haloalquilosulfonanilida o una sal del mismo según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3.

5. Un método para usar un herbicida caracterizado porque comprende tratar el suelo, un arrozal o una planta con una cantidad efectiva del herbicida según la reivindicación 4.

RESUMEN

Un derivado de haloalquilosulfonanilida representado por la fórmula general (I) o una sal del mismo, en donde R^1 representa un grupo halo-alquilo(C_1-C_8), R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} representan átomos de hidrógeno, etc., n representa 1 ó 2, A representa un átomo de oxígeno, W representa un átomo de oxígeno, X representa un átomo de halógeno y m representa un entero de 0 a 4, son compuestos útiles como herbicidas que tienen un extraordinario efecto herbicida y características tales como excelente selectividad cosecha-maleza.

Fórmula General (I):



INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2007/072256

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D265/08(2006.01)i, A01N47/04(2006.01)i, A01P13/00(2006.01)i,
C07D265/10(2006.01)i, C07D267/06(2006.01)i, A01N33/18(2006.01)n,
A01N43/72(2006.01)n, A01N43/86(2006.01)n

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D265/08, A01N47/04, A01P13/00, C07D265/10, C07D267/06, A01N33/18,
A01N43/72, A01N43/86

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Jitsuyo Shinan Koho 1922-1996 Jitsuyo Shinan Toroku Koho 1996-2008
Kokai Jitsuyo Shinan Koho 1971-2008 Toroku Jitsuyo Shinan Koho 1994-2008

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

BIOSIS (STN), Caplus (STN), EMBASE (STN), MEDLINE (STN), REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 2006/090792 A1 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 31 August, 2006 (31.08.06), Full text; particularly, Claims 1 to 5 & JP 2006-265240 A	1-5
Y	WO 2004/011429 A1 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 05 February, 2004 (05.02.04), Full text; particularly, Claims 1 to 3, 5, 6; tables 7 to 9, 39 to 41 & JP 2004-107323 A	1-5
A	JP 2005-314407 A (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 10 November, 2005 (10.11.05), Full text (Family: none)	1-5



Further documents are listed in the continuation of Box C.



See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

04 January, 2008 (04.01.08)

Date of mailing of the international search report

15 January, 2008 (15.01.08)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2007/072256

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 2000-247814 A (Kumiai Chemical Industry Co., Ltd.), 12 September, 2000 (12.09.00), Full text (Family: none)	1-5
A	JP 2003-55346 A (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 26 February, 2003 (26.02.03), Full text (Family: none)	1-5

REPORTE DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL

Solicitud Internacional N°

PCT /JP 2007/072256

A. CLASIFICACION DE LA MATERIA OBJETO

C07D265/08 (2006.01)i, A01N47/04(2006.01)i, A01P13/00 (2006.01)i, C07D265/10 (2006.01)i, C07D267/06 (2006.01)i, A01N33/18 (2006.01)n, A01N43/72 (2006.01)n, A01N43/86 (2006.01)n

Conforme con la clasificación Internacional de Patentes (IPC) o bien, tanto con la clasificación nacional como la IPC

B. SECTORES COMPRENDIDOS EN LA BUSQUEDA

Documentación mínima consultada (sistema de clasificación seguido por símbolos de clasificación)

C07D265/08, A01N47/04, A01P13/00, C07D265/10, C07D267/06, A01N33/18, A01N43/72, A01N43/86

Otros documentos consultados además de la documentación mínima, en la medida en que tales documentos forman parte de los sectores comprendidos en la búsqueda

Jitsuyo Shinan Koho	1992-1996	Jitsuyo Shinan Toroku Koho	1996-2008
Kokai Jitsuyo Shinan Koho	1971-2008	Toroku Jitsuyo Shinan Koho	1994-2008

Base de datos electrónica consultada durante la búsqueda internacional (nombre de la base de datos y términos de búsqueda utilizados).

BIOSIS (STN), Cplus (STN), EMBASE (STN), MEDLINE (STN), REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTOS CONSIDERADOS PERTINENTES

Categoría*	Cita del documento con indicación, cuando sea apropiado de los pasajes pertinentes	N° de las reivindicaciones a las que se refieren.
Y	WO 2006/090792 A1 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), Agosto 31, 2006 (31.08.06), Texto completo; particularmente, reivindicaciones 1 a 5 & JP 2006-265240 A	1-5
Y	WO 2004/011429 A1 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), Febrero 5, 2004 (05.02.04), Texto completo; particularmente, reivindicaciones 1 a 3, 5, 6; tablas 7 a 9, 39 a 41 & JP 2004-107323 A	1-5
A	JP 2005-314407 A (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), Noviembre 10, 2005 (10.11.05), Texto completo (Familia: ninguna)	1-5

☒ Se anexan documentos adicionales en la continuación del cuadro C

☐ Véase anexo de familia de patentes

* Categorías especiales de documentos citados:

"A" documento que define el estado general de la técnica, no considerado como particularmente pertinente

"E" documento anterior publicado ya sea en la fecha de presentación internacional o con posterioridad a la misma.

"L" documento que puede plantear dudas sobre una reivindicación de cita o por una razón especial (como la indicada)

"O" documento que se refiere a una divulgación oral, a una utilización, a una exposición o a cualquier otro tipo de medio

"P" documento publicado antes de la fecha de presentación internacional, pero con posterioridad a la fecha de prioridad reivindicada

"T" documento ulterior publicado con posterioridad a la fecha de solicitud internacional o fecha de prioridad y que no se contraponga con la solicitud mencionada para comprender el principio a la teoría que constituye la base de la invención

"X" documento particularmente pertinente: la invención reivindicada no puede considerarse como nueva ni que implique una actividad inventiva cuando el documento se toma solo

"Y" documento particularmente pertinente: la invención reivindicada no puede considerarse que implique una actividad inventiva cuando el documento se asocia a otros documentos de la misma naturaleza, cuya combinación resulta evidente para un experto en la materia

"&" documento que forma parte de la misma familia de patentes

Fecha en la que se ha concluido efectivamente la búsqueda internacional

04 de Enero de 2008 (04.01.08)

Fecha de expedición del presente informe de búsqueda internacional

15 de Enero de 2008 (15.01.08)

Nombre y dirección postal de la ISA /

Oficina Japonesa de Patentes

Facsímil N°

Firma del funcionario que autoriza

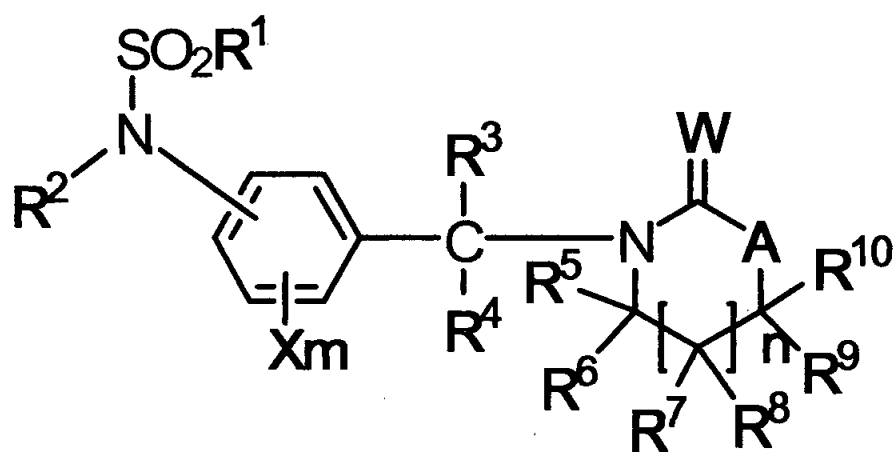
Teléfono N°

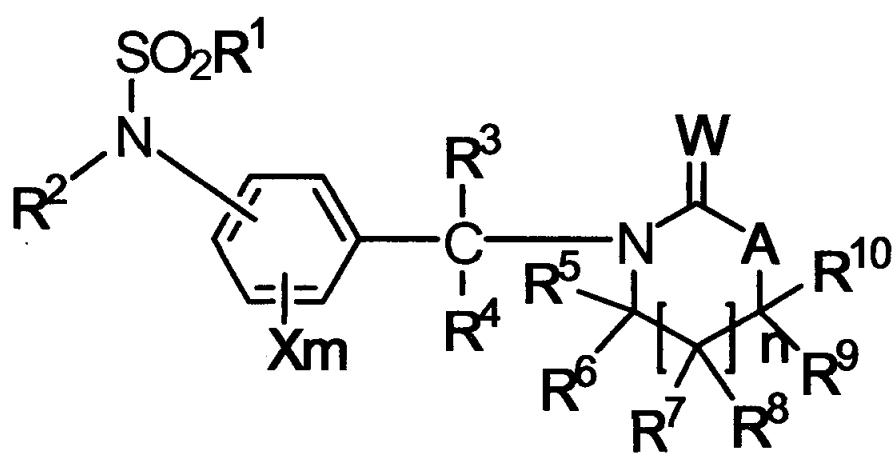
Forma PCT/ISA 210 (segunda hoja) (Abril 2007)

REPORTE DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL

Solicitud Internacional N°
PCT/JP2007/072256

Categoría*	Cita del documento con indicación, cuando sea apropiado de los pasajes pertinentes	N° de las reivindicaciones a las que se refieren.
A	JP 2000-247814 A (Kumiai Chemical Industry Co., Ltd.), Septiembre 12, 2000 (12.09.00), Texto completo (Familia: ninguna)	1-5
A	JP 2003-55346 A (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), Febrero 26, 2003 (26.02.03), Texto completo (Familia: ninguna)	1-5







REQUISITOS MÍNIMOS PARA ADMISIÓN A TRAMITE PCT

PATENTE DE INVENCION



MODELO DE UTILIDAD []

- ◆ Indicación de que se solicita la concesión de 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 [✓]

COMPLETA []

INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

- ◆ Indicación de que se solicita el registro de 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 []

- ◆ Indicación de que se solicita el registro de un Esquema de Trazado []
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud []
- ◆ Representación gráfica del esquema trazado []
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas []

COMPLETA []

INCOMPLETA []

Sandra Rodríguez

Firma Responsable

Fecha ABRIL 27-9

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5,7y10
Conmutador: 3 82 0840
Fax: 3505220
E-mail: info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá D.C. - Colombia

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Folio 150

2020
Bogotá D.C.,

Doctor(a)
CUBILLOS MENDOZA GERMAN ALONSO
Apoderado(a) y/o Representante de
NIHON NOHYAKU CO, LTD.

REFERENCIA	Radicación No.	9 42237
	Solicitud internacional	PCT/JP2007/072256
	Fecha inicio fase nacional	17/06/2009
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	416
	Oficio No.	8405
	Folios	1

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial.

Cúmplase
Dado en Bogotá DC,

02 JUL. 2009

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

jfernand