Organizacion CSA Ltda

CSA046958

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

PCT

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
INVENTARIO

SOLICITUD DE

PATENTE DE INVENCION
PCT ENTRADA EN FASE NACIONAL

21. EXPEDIENTE No. 09-97220

1/2

54. TITULO: DERIVADOS DE QUINOLINA COMO FUNGICIDAS

52. CLASIFICACION INTERNACIONAL: A01N 43/42, C07D 215/20

71. SOLICITANTE: SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

DOMICILIO: Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basilea - SUIZA

74. APODERADO: Dra. MARGARITA CASTELLANOS A.

22. BOGOTA, D.C., 10 SET. 2009

FN. 14-10-2009

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 09-097220- -00000-0000
Fecha: 2009-09-10 15:26:30 Dep. 2020 NUECREACIONI
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 314

...yo de radicación

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE...
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

SOLICITUD DE:

(1)

[X] Patente de Invención. [ ] Patente de Modelo de Utilidad.

[X] Capítulo I [ ] Capítulo II

(2) SOLICITANTE (71)	Nombre: **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG** Dirección: **Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basilea - SUIZA** Nacionalidad o Domicilio: **Basilea - SUIZA** Lugar de Constitución: **SUIZA** Teléfono: Fax: E-mail:	**IDENTIFICACIÓN** C.C. [ ] NIT [ ] C.E. [ ] Otro [ ] Cual Número
(3) REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: **MARGARITA CASTELLANOS A.** Dirección: **CALLE 94A No. 7A-09** Teléfono: **756 0770** Fax: **755 0158** E-mail: info@castellanosyco.com	**IDENTIFICACIÓN** C.C. [X] NIT [ ] C.E. [ ] Otro [ ] Cual Número **39'779.654** TPA **70.819**
(4) INVENTOR (ES) (72)	**VER ANEXO # 1**	

(5) **PCT (86)**

Solicitud Internacional No. **PCT/EP2008/001974** Fecha **12/03/2008**

Publicación Internacional No. **WO 2008/110355 A1** Fecha **18/09/2008**

(6) **Título (54)** **DERIVADOS DE QUINOLINA COMO FUNGICIDAS**

(7) **Clasificación Internacional (51)** **A01N 43/42, C07D 215/20**

(8) **Prioridad** SI [X] NO [ ]

(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud
GB	14/03/2007	0704906,7

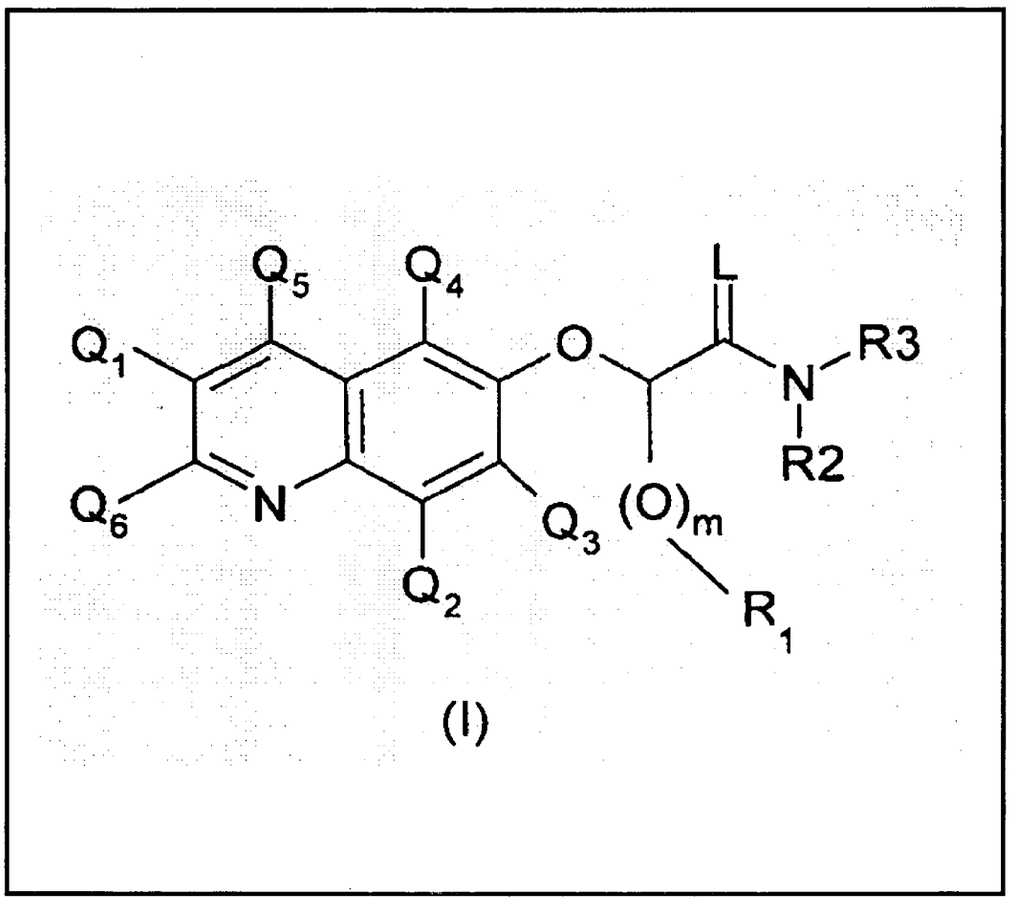
(9) **Comprobante de pago No.** **09-67-234 y 09-67,235** **Fecha** **Septiembre 9 de 2009**

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

(10) Anexos

- [X] Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud.
- [X] Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
- [X] Poderes, si fuere el caso, junto con la sustitución del mismo a mi favor
- [ ] Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.
- [ ] Declaraciones.
- [X] Copia de la solicitud internacional (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos).
- [X] Traducción de la solicitud internacional al castellano (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos).
- [ ] Copia del examen preliminar internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen Preliminar (IPEA).
- [ ] Traducción del examen preliminar internacional efectuado por la IPEA.
- [ ] De ser el caso, copia 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.
- [X] 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.
- [X] Otros: **Tarjeta Propietario y Extracto para la publicación**

(11) FIGURA CARACTERISTICA:



(I)

(12) Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

FIRMA:

C.C. No. 39'779.654 Usaquén - TPA 70.819 C.S.J.

10 SET. 2009

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página. - MCA/gcb - P1816

CASTELLANOS & CO LTDA
ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A-09
Bogotá, D.C. – COLOMBIA

ANEXO # 1
INVENTORES

1. **LAURA QUARANTA**
   Syngenta Crop Protection Münchwilen AG
   Schaffhauserstrasse
   CH-4332 Stein
   SUIZA

2. **HANS-GEORG BRUNNER**
   Syngenta Crop Protection Münchwilen AG
   Schaffhauserstrasse
   CH-4332 Stein
   SUIZA

3. **RENAUD BEAUDEGNIES**
   Syngenta Crop Protection Münchwilen AG
   Schaffhauserstrasse
   CH-4332 Stein
   SUIZA

4. **FREDRIK CEDERBAUM**
   Syngenta Crop Protection Münchwilen AG
   Schaffhauserstrasse
   CH-4332 Stein
   SUIZA

5. **FIONA MURPHY KESSABI**
   Syngenta Crop Protection Münchwilen AG
   Schaffhauserstrasse
   CH-4332 Stein
   SUIZA

P1816
4

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 09-097220- -00000-0000
Fecha: 2009-09-10 15:26:30 Dep: 2020 NUECREACIONI
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 314

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 67,234
FECHA : SEPTIEMBRE 9 DE 2009

***** C O N S I G N A C I O N *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
ALVARO CASTELLANOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	92622795	09/09/2009	7,644,440.00

***** C O N C E P T O *****

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._____

5

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 09-097220- -00000-0000

Fecha: 2009-09-10 15:26:30 Dep. 2020 NUECREACIONI
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 314

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 67,235
FECHA : SEPTIEMBRE 9 DE 2009

***** C O N S I G N A C I O N *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
ALVARO CASTELLANOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	92622795	09/09/2009	7,644,440.00

***** C O N C E P T O *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
63	50005-01-01 SOLICITUDES	*** REIVINDICACION UNITARIA ADICIONAL	1,575,000.00
		TOTAL : $	1,575,000.00

SON: UN MILLON QUINIENTOS SETENTA Y CINCO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No._____

CASTELLANOS & CO.
ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A-09
Bogotá, D.C. – COLOMBIA

Señor

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Comercio, Desarrollo, Industria y Turismo

E. S. D.

Ref.: **PODER** conferido por la sociedad **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**

Yo, **XIMENA CASTELLANOS ABONDANO,** mayor de edad, identificada y domiciliada como aparece al pié de mi firma, atentamente manifiesto a Uds. que sustituyo en la Dra. **MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO,** el poder que me confirió la sociedad **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG,** con domicilio en **Schwarzwaldalle 215, CH-4058 Basilea, SUIZA,** debidamente legalizado por Apostilla, bajo el No. **8117** el día **1° de Abril de 2004**, con las mismas facultades que me fueron conferidas, para tramitar la solicitud de Patente PCT Entrada en Fase Nacional, en Colombia, para: **"DERIVADOS DE QUINOLINA COMO FUNGICIDAS".**

Del Señor Jefe,

Acepto

Ximena Castellanos Abondano
C.C. No. **39.773.330** de Usaquén
T.P.A. No. **58.236** del C.S.J.
Calle 94 A No. 7 A-09 – Bogotá, D.C.
Teléfono: 756 07 70

Margarita Castellanos Abondano
C.C. No. **39.779.654** de Usaquén
T.P.A. No. **70.819** del C.S.J.
Calle 94 A No. 7 A-09 – Bogotá, D.C.
Teléfono: 756 07 70

Bogotá, D.C.
XCA/MCA/P1816

El anterior memorial fué presentado personalmente por
Jimena Castellanos Aboudano
quien se identificó con la C. de C. No. 39.773.330
de Usaquén
Tarjeta Profesional No. 58.236 C.S. de la J.
Bogotá, D.C. 9 SET. 2009
El Notario Veintiseis
Gustavo Samper Rodríguez

El anterior memorial fué presentado personalmente por
Margarita Castellanos Aboudano
quien se identificó con la C. de C. No. 39.779.654
de Usaquén
Tarjeta Profesional No. 70.819 C.S. de la J.
Bogotá, D.C. 9 SET. 2009
El Notario Veintiseis
Gustavo Samper Rodríguez

49157

COLOMBIA

PODER

El (los) Gregory W. Warren
SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

Nombran por el presente a **XIMENA CASTELLANOS A. y/o MARGARITA CASTELLANOS A.** abogadas con oficinas en la Carrera 9 No. 93-09, Bogotá-Colombia para

y para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad Industrial y con este fin autorizamos a dichos apoderados para que nos representen ante cualesquiera autoridades o personas de los órdenes administrativo, contencioso –administrativo y judicial en todo lo relacionado con los siguientes actos y gestiones:
a) Obtención de patentes de invención, modelos y dibujos industriales; registro de marcas de fabrica, de servicio, colectivas o defensivas y de denominaciones de origen, depósito de nombres y enseñas comerciales; su renovación, prórroga, inscripción de traspaso y cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Para la obtención de registros sanitarios; c) Acciones de oposición, observación, cancelación, nulidad, medidas cautelares y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso - administrativos que promovamos o se nos promuevan, pudiendo en todos los actos y gestiones arriba mencionados sustituir éste mandato, transigir, desistir, recibir, cancelar, renunciar, aceptar notificaciones y nombrar apoderados judiciales y extrajudiciales.

Dado y firmado hoy 24 de Marzo de 2004

en Research Triangle Park, Carolina del Norte 27709
por Gregory W. Warren

(El notario debe suscribir el documento en la pagina siguiente)

(Se requiere legalización consular)

POWER OF ATTORNEY

I (we) the undersigned Gregory W. Warren
Syngenta Participations AG

hereby grant(s) Power of Attorney to **XIMENA CASTELLANOS A. and /or MARGARITA CASTELLANOS** a. attorneys residing at Carrera 9 No. 93-09, Bogota- Colombia, to prosecute
and to obtain the protection of my (our Industrial Property, for which purpose we authorize the said attorneys to represent us before any authorities, or persons, specially those, administrative, contentious and judicial, in all matters concerning the following:

a) Obtention of patents, models and designs, registration of trademarks, service, collective and defensive marks, and of designations of origin; the deposit of trade names and ensigns; its renewal, extension, recordal of assignments, change of name or domicile, voluntary cancellation, and the registration of licenses of use of the above rights; b) For the obtention of Sanitary registrations; c) Actions of opposition, cancellation, nullity, infringement, granting of licenses; and in general the civil, criminal and administrative suits related to those rights; actions and suits instituted by us or against us; and that in all the above matters they may substitute this power of attorney, compromise, desist, cancel, receive, renounce, accept notifications and appoint attorneys in fact, in or out of court.

Given and signed this 24th March 2004

in Research Triangle Park, North Carolina 27709

by Gregory W. Warren Gregory W. Warren

(Notary shall execute on the other side)

(Consular legalization required)

Como Notaria Veintiséis del Circulo de Bogotá, hago constar que esta copia coincide con original que se ha presentado
Bogotá D.C. Colombia.
-9 SET 2009
GUSTAVO SAMPER RODRIGUEZ
NOTARIO VEINTISEIS

ALVARO CASTELLANOS M. & CIA.
ABOGADOS COLOMBIA
Carrera 9 No. 93-09- P.O.Box 6349 - Bogotá, Colombia
Tels.: (571) 610 74 20 / 60 / 80 - Fax (571) 610 07 06 - e-mail acastell@impsat.net.co

XC/cm

COLOMBIA

CERTIFICADO NOTARIAL (Sociedad)

Hoy 24 de Marzo del año 2004
compareció (eron) personalmente Gregory W. Warren
a quienes conozco como la(s) personas que firma(n) en representación de la Sociedad (Compañía denominada
Certifico : Syngenta Participations AG

a) Que es una sociedad/Compañía legalmente constituida y existente de acuerdo con las leyes de
b) Que el domicilio de dicha Sociedad/Compañía es Basel, Suiza
c) Que el objeto u objetos para los cuales se otorga el presente poder están comprendidos dentro del objeto social de la mencionada Sociedad /Compañía.
d) Que el Sr. Gregory W. Warren

esta autorizado para otorgar el presente poder. Lo anterior esta probado por medio de los siguientes documentos, que certifico he visto*

(Ciudad) REsearch Triangle Park

(Estado) Carolina del Norte 27709

Hoy del 24 de Marzo de 2004

(Notario Público) LANEISHA C. HAYES

*Los documentos debe identificarse con fecha y origen.

NOTARIAL (Corporation)

On this 24th day of March of 2004 personally appeared Gregory W. Warren whom I know to be the person(s) who signed this document as representative(s) of the Corporation /Company named Syngenta Participations AG
I certify:

a) That Syngenta Participations AG is a corporation (Company legally constituted and in existence in accordance with the laws of Basel, Switzerland
b) That the domicile of said Corporation/Company is Basel, Switzerland
c) That the purpose or purposes for which the present Power of Attorney is granted are comprised within the object set forth in the charter of the mentioned Corporation/Company.
d) That Mr. Gregory W. Warren

is (are) authorized to grant the present Power of Attorney. The aforementioned was duly proven through the following documents and I duly certify having seen them*: on the 24th day of March, 2004 in Research Triangle Park, North Carolina 27709.

(City) Research Triangle Park

(State) North Carolina, 27709

this 24th day of March of the year 2004

(Notary Public) Laneisha C. Hayes

*Documents must be identified with date and origin
3/24/04 - Research Triangle Park, North Carolina 27709 - Syngenta Biotech, Inc.

LANEISHA C. HAYES NOTARY PUBLIC WAKE COUNTY, N.C.

Como Notaria Veintiséis del Circulo de Bogotá, hago constar que esta copia coincide con original que se ha presentado
Bogotá D.C. Colombia.
-9 SET 2009
GUSTAVO SAMPER RODRIGUEZ
NOTARIO VEINTISEIS

ALVARO CASTELLANOS M. & CIA.
ABOGADOS COLOMBIA
Carrera 9 No. 93-09- P.O.Box 6349 - Bogotá, Colombia
Tels.: (571) 610 74 20 / 60 / 80 - Fax (571) 610 07 06 - e-mail acastell@impsat.net.co

WAKE COUNTY
NORTH CAROLINA

Wake County Register of Deeds
Post Office Box 1897
Raleigh, North Carolina 27602-1897

Laura M. Riddick
Register Of Deeds

STATE OF NORTH CAROLINA

WAKE COUNTY

CERTIFICATE OF REGISTER OF DEEDS THAT NOTARY PUBLIC WAS ACTING NOTARY AT TIME OF SIGNATURE

I, LAURA M. RIDDICK, REGISTER OF DEEDS OF THE AFORESAID COUNTY AND STATE, DO HEREBY CERTIFY THAT Laneisha C. Hayes WAS, AT THE TIME OF SIGNING THE FOREGOING (OR ANNEXED) CERTIFICATE, A DULY COMMISSIONED AND QUALIFIED NOTARY PUBLIC IN AND FOR THE COUNTY OF WAKE, STATE OF NORTH CAROLINA, AND AS SUCH FULL FAITH AND CREDIT IS DUE TO HIS OFFICIAL ACTS; AND, FURTHER, THAT HIS SIGNATURE THERETO IS IN HIS OWN PROPER HANDWRITING.

IN TESTIMONY WHEREOF, I HAVE HEREUNTO SET MY HAND AND SEAL OF OFFICE THIS, THE 30TH DAY OF MARCH, 2004.

Laura M. Riddick
REGISTER OF DEEDS

DEPUTY / ~~ASSISTANT~~

(SEAL) LAURA M. RIDDICK * REGISTER OF DEEDS SEAL * WAKE COUNTY, N.C.

Como Notaria Veintiséis del Circulo de Bogotá, hago constar que esta copia coincide con original que se ha presentado
Bogotá D.C. Colombia.
9 SET 2009
GUSTAVO SAMPER RODRIGUEZ
NOTARIO VEINTISEIS

4915-FNPCT 10

APOSTILLE
(Convention de La Haye 5 octobre 1961)

1. COUNTRY: **UNITED STATES OF AMERICA**
2. This Public Document has been signed by CARLA N. BROWN
3. acting in the capacity of DEPUTY REGISTER OF DEEDS ~~LAURA M. RIDDICK, REGISTER OF DEEDS~~
4. bears the seal/stamp of COUNTY OF WAKE, NORTH CAROLINA

CERTIFIED

5. at Raleigh, North Carolina
6. the 1ST DAY OF APRIL, 2004
7. by Deputy Secretary of State, State of North Carolina
8. No. 8117
9. Seal/Stamp:

STATE OF NORTH CAROLINA DEPARTMENT OF THE SECRETARY OF STATE
MAY 20, 1775
APRIL 12, 1776
ESSE QUAM VIDERI

10. Signature

Rodney S. Maddox

Como Notaria Veintiséis del Circulo de Bogotá, hago constar que esta copia coincide con original que se ha presentado
Bogotá D.C. - Colombia.
09 SET 2009
GUSTAVO SAMPER RODRIGUEZ
NOTARIO VEINTISEIS

----------TRADUCCION OFICIAL No. -040417----------

de un documento escrito en INGLES, el cual para su identificación lleva el sello de la Traductora e Intérprete oficial, Res. 2755/68 y 01144/97 de Minjusticia, al igual que la presente.----------

----------(Anexos a un poder otorgado por Syngenta Participations AG)

(fdo) illegible

3/24/04 Research Triangle Park, NC 27709

ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE

CONDADO DE WAKE

Yo, Laura M.Riddick, Registrador de Escrituras del condado y estado antes mencionados, certifico por medio del presente que Laneisha C. Hayes, al momento de firmar este documento era un Notario Público debidamente comisionado y habilitado en y para el Condado de Wake, Estado de Carolina del Norte, y como tal debe dares plena fe y crédito a sus actos oficiales, y además, que su firma en el mismo es de su propia letra.

En testimonio de lo cual, he impuesto aquí mi firma y sello de oficio, hoy día 30 de Marzo de 2004.

Laura M. Riddick, Registrador de Escrituras

Por (fdo) ilegible

Como Notaria Veintiséis del Circulo de Bogotá, hago constar que este copia coincide con original que se ha presentado
Bogotá D.C. - Colombia.
-9 SET 2009
GUSTAVO SAMPER RODRIGUEZ
NOTARIO VEINTISEIS

DORA DUQUE DE BERNAL
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
RES. 02755/68 - 01144/97 - MINJUSTICIA
REP. DE COLOMBIA

Delegado

APOSTILLA

(Convención de La Haya de octubre 5, 1961)

1. País: Estados Unidos de América

2. Este documento público ha sido firmado por CARLA N. BROWN

3. actuando en su carácter de Delegado del Registrador de Escrituras

4. lleva el sello de Laura M. Riddick, Registrador de Escrituras

Condado de Wake, Carolina del Norte

CERTIFICADO

5. En Raleigh.Carolina del Norte

6. el día 1 de Abril de 2004

7. por el Secretario de Estado Delegado, Estado de Carolina del Norte

8. No. 8117

9. Sello: (sello en oblea ocre)

10. Firma

(fdo) Rodney S. Maddox

ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, a la cual me remito,

Bogotá, Abril 15, 2004

DORA DUQUE DE BERNAL
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
RES. 02755/68 Y 01144/97 - MINJUSTICIA
REP. DE COLOMBIA

Como Notaria Veintiséis del Circulo de Bogotá, hago constar que este copia coincide con original que se ha presentado
Bogotá D.C. Colombia.
-9 SET 2009
GUSTAVO SAMPER RODRIGUEZ
NOTARIO VEINTISEIS

EN BLANCO
NOTARIA VEINTISEIS

EN BLANCO
NOTARIA VEINTISEIS

EN BLANCO
NOTARIA VEINTISEIS

Como Notario Veintiséis del Círculo de Bogotá, hago constar que esta copia coincide con original que se ha presentado
Bogotá D.C. - Colombia.

-9 SET 2009

GUSTAVO SAMPER RODRIGUEZ
NOTARIO VEINTISEIS

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau

(43) International Publication Date
18 September 2008 (18.09.2008)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2008/110355 A1

(51) International Patent Classification:
A01N 43/42 (2006.01) *C07D 407/12* (2006.01)
C07D 215/20 (2006.01) *C07D 409/12* (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)

(21) International Application Number:
PCT/EP2008/001974

(22) International Filing Date: 12 March 2008 (12.03.2008)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
0704906.7 14 March 2007 (14.03.2007) GB

(71) Applicant *(for all designated States except US)*: **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG** [CH/CH]; Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel (CH).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants *(for US only)*: **MURPHY KESSABI, Fiona** [IE/CH]; Syngenta Corp Protection Münchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH). **BEAUDEGNIES, Renaud** [BE/CH]; Syngenta Corp Protection Münchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH). **QUARANTA, Laura** [IT/CH]; Syngenta Corp Protection Münchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH). **BRUNNER, Hans-Georg** [CH/CH]; Syngenta Corp Protection Münchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH). **CEDERBAUM, Fredrik** [CH/CH]; Syngenta Crop Protection Münchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH).

(74) Agent: **HÖLSCHER, Ingo**; Syngenta Crop Protection Münchwilen AG, Intellectual Property, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH).

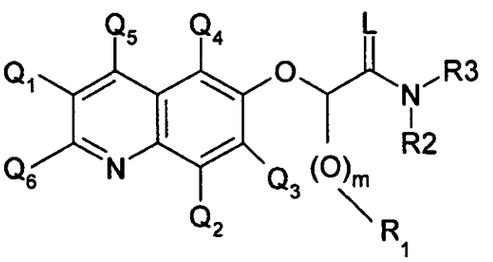
(81) Designated States *(unless otherwise indicated, for every kind of national protection available)*: AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM,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

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

Published:
— *with international search report*
— *before the expiration of the time limit for amending the claims and to be republished in the event of receipt of amendments*

(54) Title: QUINOLINE DERIVATIVES AS FUNGICIDES

(57) Abstract: Compounds of the general formula (I) wherein the substituents are as defined in claim 1, are useful as fungicides.



(I)

WO 2008/110355 A1

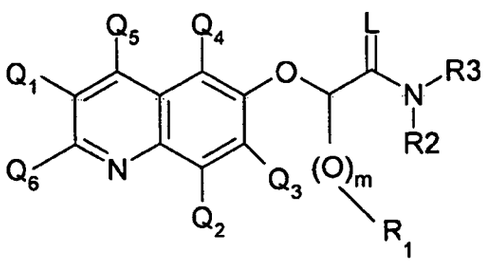
QUINOLINE DERIVATIVES AS FUNGICIDES

This invention relates to novel quinolinyloxyalkanoic acid amides, processes for preparing them, to compositions containing them and to methods of using them to combat fungi, especially fungal infections of plants.

Certain quinolinyloxyalkanoic acid amide derivatives and their use as agricultural and horticultural bactericides are disclosed, for example, in WO 04/047538 and JP 2001-89453.

The present invention is concerned with the provision of particular substituted quinoline-6-yloxyalkanoic acid amides for use mainly as plant fungicides.

Thus according to the present invention there is provided a compound of the general formula I



(I),

wherein

Q^1, Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6 independently of each other, are hydrogen, halogen, cyano, nitro, azido, optionally substituted C_{1-6} alkyl, optionally substituted C_{3-6} cycloalkyl, optionally substituted C_{3-6} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, optionally substituted C_{2-6} alkenyl, optionally substituted C_{2-6} alkynyl, optionally substituted C_{1-6} alkoxy, optionally substituted C_{2-6} alkenyloxy, optionally substituted C_{2-6} alkynyloxy, optionally substituted aryl, optionally substituted aryloxy, optionally substituted aryl(C_{1-6})alkyl, optionally substituted aryl(C_{1-6})alkoxy, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heteroaryloxy, optionally substituted heteroaryl(C_{1-6})alkyl, optionally substituted heteroaryl(C_{1-6})alkoxy, $-SF_5$ or $-S(O)_u(C_{1-6})$alkyl, wherein u is 0, 1 or 2 and the alkyl group is optionally substituted with halogen, or

Q^1, Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6, independently of each other, are $-OSO_2(C_{1-4})$alkyl, wherein the alkyl group is optionally substituted with halogen, or

Q^1, Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6, independently of each other, are $-CONR^uR^v$, $-COR^u$, $-CO_2R^u$, $-CR^u=NR^v$, $-NR^uR^v$, $-NR^uCOR^v$, $-NR^uCO_2R^v$, $-SO_2NR^uR^v$ or $-NR^uSO_2R^w$, wherein R^w is optionally substituted C_{1-6} alkyl and R^u and R^v, independently of each other, are hydrogen or C_{1-6} alkyl optionally substituted with halogen, or, in the case of $-CONR^uR^v$ or $-SO_2NR^uR^v$, R^uR^v may join to form a 5- or 6-membered carbocyclic or heterocyclic ring containing a heteroatom selected from sulfur, oxygen and NR^o, wherein R^o is hydrogen or optionally substituted C_{1-6}alkyl, or, in the case of $-CR^u=NR^v$, R^v is hydrogen, hydroxyl, or C_{1-6}alkoxy,

R^1 is C_{1-4} alkyl, C_{3-5} cycloalkyl, C_{2-4} alkenyl or C_{2-4} alkynyl in which the alkyl, alkenyl and alkynyl groups are optionally substituted on their terminal carbon atom with one, two or three halogen atoms, with a cyano group, with a C_{1-4} alkylcarbonyl group, with a C_{1-4} alkoxycarbonyl group or with a hydroxy group, or R_1 is alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, alkylsulphinylalkyl or alkylsulphonylalkyl in which the total number of carbon atoms is 2 or 3, or R_1 is a straight-chain C_{1-4} alkoxy group;

R^2 is hydrogen, C_{1-8} alkyl, C_{3-4} cycloalkyl, C_{2-8} alkenyl, cyano(C_{1-4})alkyl, C_{1-4} alkoxy(C_{1-4})-alkyl, C_{1-4} alkoxy(C_{1-4})alkoxy(C_{1-4})alkyl or benzyloxy(C_{1-4})alkyl, wherein the phenyl ring is optionally substituted with C_{1-4} alkoxy,

R^3 is $-(CR^aR^b)_p(CR^cR^d)_q(X)_r(CR^eR^f)_sR^4$, wherein

R^a, R^b, R^c, R^d, R^e and R^f, independently of each other, are hydrogen, C_{1-4} alkyl, halogen, cyano, hydroxy, C_{1-4} alkoxy or C_{1-4} alkoxycarbonyl, or

R^aR^b, R^cR^d or R^eR^f may join to form a 3 to 8 membered carbocyclic or heterocyclic ring containing a heteroatom selected from sulfur, oxygen and NR^o, wherein R^o is hydrogen or optionally substituted C_{1-6}alkyl,

X is (CO), (CO)O, O(CO), O, $S(O)_t$, wherein t is 0, 1 or 2, or X is NH or N(C_{1-6})alkyl,

p, r and s, independently of each other, are 0 or 1,

q is 0, 1 or 2,

R^4 is optionally substituted C_{1-6} alkyl, optionally substituted C_{2-6} alkenyl or

when at least one of p, q, r and s is 1, R^4 is $-CH_2-C\equiv C-R^5$, wherein

R^5 is hydrogen, C_{1-8} alkyl optionally substituted with halogen, hydroxy, C_{1-6} alkoxy, C_{1-3} alkoxy(C_{1-3})alkoxy, cyano, C_{1-4} alkylcarbonyloxy, aminocarbonyloxy, mono- or di(C_{1-4})-alkylaminocarbonyloxy, tri(C_{1-4})alkylsilyloxy or $-S(O)_g(C_{1-6})$alkyl, wherein g is 0, 1 or 2, or

R^5 is C_{3-6} cycloalkyl optionally substituted with halogen, hydroxy, C_{1-6} alkoxy, C_{1-3} alkoxy-(C_{1-3})alkoxy, cyano, C_{1-4} alkylcarbonyloxy, aminocarbonyloxy, mono- or di(C_{1-4})alkyl-aminocarbonyloxy, tri(C_{1-4})alkylsilyloxy or $-S(O)_g(C_{1-6})$alkyl, wherein g is 0, 1 or 2, or

R^5 is C_{3-6} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, wherein the alkyl and/or cycloalkyl moiety is optionally substituted with halogen, hydroxy, C_{1-6} alkoxy, C_{1-3} alkoxy(C_{1-3})alkoxy, cyano, C_{1-4} alkyl-

carbonyloxy, aminocarbonyloxy, mono- or di(C_{1-4})alkylaminocarbonyloxy, tri(C_{1-4})alkylsilyloxy or -S(O)$_g$(C_{1-6})alkyl, wherein g is 0, 1 or 2, or

R^5 is optionally substituted aryl, optionally substituted aryl(C_{1-4})alkyl, optionally substituted aryloxy(C_{1-4})alkyl, optionally substituted heteroaryl or optionally substituted heteroaryl(C_{1-4})alkyl or optionally substituted heteroaryloxy(C_{1-4})alkyl, or

R^4 is optionally substituted C_{3-6} cycloalkyl, optionally substituted C_{5-6} cycloalkenyl, optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl or an optionally substituted 5- to 8-membered ring optionally containing a heteroatom selected from sulfur, oxygen or NR^0, wherein R^0 is hydrogen or optionally substituted C_{1-6}alkyl, or

R^2 and R^3 may join to form a 5- or 6-membered ring optionally substituted with halogen, C_{1-4} alkyl, mono- or di-(C_{1-4})alkylaminocarbonyl, and optionally containing a heteroatom selected from sulphur, oxygen and NR^{00}, wherein R^{00} is C_{1-4} alkyl optionally substituted with halogen, C_{1-6} alkoxy or cyano, or R^{00} is phenyl optionally substituted with nitro, C_{1-4} alkyl, halo(C_{1-4})alkyl, C_{1-4} alkylcarbonyl or heteroaryl, or R^2 and R^3 may join to form an optionally substituted 6,6-membered bicycle,

L is sulfur or oxygen, and

m is 0 or 1; and

salts and N-oxides of the compounds of the formula I.

The compounds of the invention contain at least one asymmetric carbon atom and may exist as enantiomers (or as pairs of diastereoisomers) or as mixtures of such. Further, when n is 1, the compounds of the invention are sulphoxides, which can exists in two enantiomeric forms, and the adjacent carbon can also exists in two enantiomeric forms. Compounds of general formula (I) can therefore exist as racemates, diastereoisomers, or single enantiomers, and the invention includes all possible isomers or isomer mixtures in all proportions. It is to be expected that for any given compound, one isomer may be more fungicidally active than another.

N-oxides of the compounds of the formula I preferably denote the N-oxides formed by the quinoline moiety.

The salts which the compounds of the formula I can form are preferably those formed by interaction of these compounds with acids. The term "acid" comprises mineral acids such as hydrogen halides, sulphuric acid, phosphoric acid etc. as well as organic acids, preferably the commonly used alkanoic acids, for example formic acid, acetic acid and propionic acid.

Except where otherwise stated, alkyl groups and alkyl moieties of alkoxy, alkylthio, etc., suitably contain from 1 to 6, typically from 1 to 4, carbon atoms in the form of straight or branched chains. Examples are methyl, ethyl, *n*-and *iso*-propyl and *n*-, *sec*-, *iso*- and *tert*-butyl. Where alkyl moieties contain 5 or 6 carbon atoms, examples are *n*-pentyl and *n*-hexyl. Examples of suitable optional substituents of alkyl groups and moieties include halo, hydroxy, C_{1-4} alkoxy and C_{1-4} alkoxy(C_{1-4})alkoxy, cyano, optionally substituted aryl and optionally substituted heteroaryl. Where the optional substituent is halo, the haloalkyl group or moiety is typically monochloromethyl, monofluoromethyl, dichloromethyl, difluoromethyl, trichloromethyl or trifluoromethyl.

Except where otherwise stated, alkenyl and alkynyl moieties also suitably contain from 2 to 6, typically from 2 to 4, carbon atoms in the form of straight or branched chains. Examples are allyl, ethynyl and propargyl. Optional substituents include halo, alkoxy, optionally substituted aryl and optionally substituted heteroaryl.

Halo includes fluoro, chloro, bromo and iodo.

Aryl is usually phenyl but also includes naphthyl, anthryl and phenanthryl.

Heteroaryl is typically a 5- or 6-membered aromatic ring containing one or more sulphur, oxygen or NR moieties as heteroatoms, which may be fused to one or more other aromatic or heteroaromatic rings, such as a benzene ring. Examples are thienyl, furyl, pyrrolyl, isoxazolyl, oxazolyl, thiazolyl, oxadiazolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, isothiazolyl, tetrazolyl, thiadiazolyl, pyridyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, pyridazinyl, triazinyl, benzofuranyl, benzothienyl, dibenzofuranyl, dibenzothienyl, benzothiazolyl, benzoxazolyl, benzimidazolyl, indolyl, quinolyl, isoquinolyl, quinazolinyl and quinoxalinyl groups and, where appropriate, N-oxides and salts thereof. Any of the aryl or heteroaryl values are optionally substituted. Except where otherwise stated, substituents which may be present include one or more of the following: halo, hydroxy, mercapto, C_{1-6} alkyl (especially methyl and ethyl), C_{2-6} alkenyl (especially allyl), C_{2-6} alkynyl (especially propargyl), C_{1-6} alkoxy (especially methoxy), C_{2-6} alkenyloxy (especially allyloxy), C_{2-6} alkynyloxy (especially propargyloxy), halo(C_{1-6})alkyl (especially trifluoromethyl), halo(C_{1-6})alkoxy (especially trifluoromethoxy), -$S(O)_m$(C_{1-6})alkyl wherein m is 0, 1 or 2 and the alkyl is optionally substituted with halo, hydroxy(C_{1-6})alkyl, C_{1-4} alkoxy(C_{1-4})alkyl, C_{1-4}alkoxy(C_{1-4})alkoxy, C_{3-6} cycloalkyl, C_{3-6} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, optionally substituted aryl (especially optionally substituted phenyl), optionally substituted heteroaryl (especially optionally substituted pyridyl or pyrimidinyl), optionally substituted aryloxy

(especially optionally substituted phenoxy), optionally substituted heteroaryloxy (especially optionally substituted pyridyloxy or pyrimidinyloxy), optionally substituted -S(O)$_m$aryl wherein m is 0, 1 or 2 (especially optionally substituted phenylthio), optionally substituted -S(O)$_m$heteroaryl wherein m is 0, 1 or 2 (especially optionally substituted pyridylthio or pyrimidinylthio), optionally substituted aryl(C$_{1-4}$)alkyl (especially optionally substituted benzyl, optionally substituted phenethyl and optionally substituted phenyl *n*-propyl) in which the alkyl moiety is optionally substituted with hydroxy, optionally substituted heteroaryl(C$_{1-4}$)alkyl (especially optionally substituted pyridyl- or pyrimidinyl-(C$_{1-4}$)alkyl), optionally substituted aryl(C$_{2-4}$)alkenyl (especially optionally substituted phenylethenyl), optionally substituted heteroaryl(C$_{2-4}$)alkenyl (especially optionally substituted pyridylethenyl or pyrimidinylethenyl), optionally substituted aryl(C$_{1-4}$)alkoxy (especially optionally substituted benzyloxy and phenethyloxy), optionally substituted heteroaryl(C$_{1-4}$)alkoxy (especially optionally substituted pyridyl(C$_{1-4}$)alkoxy or pyrimidinyl(C$_{1-4}$)alkoxy), optionally substituted aryloxy(C$_{1-4}$)alkyl (especially phenoxymethyl), optionally substituted heteroaryloxy-(C$_{1-4}$)alkyl (especially optionally substituted pyridyloxy or pyrimidinyloxy(C$_{1-4}$)alkyl), optionally substituted -S(O)$_m$(C$_{1-4}$)alkylaryl wherein m is 0, 1 or 2 (especially optionally substituted benzylthio and phenethylthio), optionally substituted -S(O)$_m$(C$_{1-4}$)alkylheteroaryl wherein m is 0, 1 or 2 (especially optionally substituted pyridyl(C$_{1-4}$)alkylthio or pyrimidinyl(C$_{1-4}$)alkylthio), optionally substituted -(C$_{1-4}$)alkylS(O)$_m$aryl wherein m is 0, 1 or 2 (especially phenylthiomethyl), optionally substituted -(C$_{1-4}$)alkyl S(O)$_m$heteroaryl wherein m is 0, 1 or 2 (especially optionally substituted pyridylthio(C$_{1-4}$)alkyl or pyrimidinylthio(C$_{1-4}$)alkyl), acyloxy, including C$_{1-4}$ alkanoyloxy (especially acetyloxy) and benzoyloxy, cyano, isocyano, thiocyanato, isothiocyanato, nitro, NR^{g}R^h, -NHCOR^g, -NHCONR^{g}R^h, -CONR^{g}R^h, -CO$_2$R^g, -SO$_2$R^i, -OSO$_2$R^i, -COR^g, -CR^g=NR^h or -N=CR^{g}R^h in which R^i is C$_{1-4}$ alkyl, halo(C$_{1-4}$)alkyl, C$_{1-4}$ alkoxy, halo(C$_{1-4}$)alkoxy, C$_{1-4}$ alkylthio, C$_{3-6}$ cycloalkyl, C$_{3-6}$ cycloalkyl(C$_{1-4}$)alkyl, phenyl or benzyl, the phenyl and benzyl groups being optionally substituted with halogen, C$_{1-4}$ alkyl or C$_{1-4}$ alkoxy and R^g and R^h are independently hydrogen, C$_{1-4}$ alkyl, halo(C$_{1-4}$)alkyl, C$_{1-4}$ alkoxy, halo(C$_{1-4}$)alkoxy, C$_{1-4}$ alkylthio, C$_{3-6}$ cycloalkyl, C$_{3-6}$ cycloalkyl(C$_{1-4}$)alkyl, phenyl or benzyl, the phenyl and benzyl groups being optionally substituted with halogen, C$_{1-4}$ alkyl or C$_{1-4}$ alkoxy.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein Q^2 is hydrogen, C$_{1-4}$ alkyl or halogen, Q^1, Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6 are as defined above. Preferably, Q^2 is methyl or ethyl.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein Q^1 is halogen, aryl or heteroaryl, Q^2 is hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen and Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6 are as defined above. Preferably, Q^2 is methyl or ethyl.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein Q^1 is aryl, Q^2 is hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen and Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6 is as defined above. Preferably, Q^2 is methyl or ethyl.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein Q^1 is heteroaryl, Q^2 is hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen and Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6 is as defined above. Preferably, Q^2 is methyl or ethyl.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein Q^1 and Q^3, independently of each other, are hydrogen or halogen and Q^2, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen. Preferably, Q^1 and Q^3, independently of each other, are fluoro, chloro, bromo, or iodo. More preferably, Q^1 is chloro, bromo or iodo and Q^3 is fluoro or chloro.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein Q^1 is aryl or heteroaryl, Q^2, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen and Q^3 is hydrogen or halogen. Preferably, Q^1 is thiophen-2-yl, thiophen-3-yl, halo, or halo or alkoxy substituted phenyl or halo or alkoxy substituted pyridyl. It is also preferred that Q^3 is hydrogen, fluoro or chloro.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein Q^1, Q^2, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen and Q^3 is hydrogen, halogen or optionally substituted alkyl. Preferably, Q^3 is hydrogen, fluoro or chloro.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein Q^1 is halogen, Q^2, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen and Q^3 is hydrogen or optionally substituted alkyl. Preferably, Q^1 is chloro, bromo or iodo. It is also preferred that Q^3 is methyl.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein Q^1 and Q^2 are halogen and Q^3 is hydrogen or optionally substituted alkyl and Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen. Preferably, Q^1 is chloro, bromo or iodo. It is also preferred that Q^3 is methyl.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein Q^1 is bromo and Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6, independently of each other, are hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen. Preferably, Q^2 is halogen and Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen. It is also preferred that Q^2

is methyl or ethyl and Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen. Further, it is preferred that Q^3 is fluoro or chloro and Q^2, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein Q^1 is iodo and Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6, independently of each other, are hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen. Preferably, Q^2 is halogen and Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen. It is also preferred that Q^2 is methyl or ethyl and Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen. Further, it is preferred that Q^3 is fluoro or chloro and Q^2, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein Q^1 is chloro and Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6, independently of each other, are hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen. Preferably, Q^2 is halogen and Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen. It is also preferred that Q^2 is methyl or ethyl and Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen. Further, it is peferred that Q^3 is fluoro or chloro and Q^2, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein Q^1 is chloro, bromo or iodo.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein Q^1 is fluoro.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein Q^3 is hydrogen or halogen. Preferably, Q^3 is hydrogen, fluoro or chloro. More preferably, Q^3 is fluoro.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein Q^1 is bromo, Q^2, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen and Q^3 is hydrogen, fluoro or chloro. Preferably, Q^3 is fluoro. It is also preferred that Q^3 is chloro. Further, it is preferred that Q^3 is hydrogen.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein Q^1 is iodo, Q^2, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen and Q^3 is hydrogen, fluoro or chloro. Preferably, Q^1 is iodo, Q^2, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen and Q^3 is fluoro. It is also preferred that Q^1 is iodo, Q^2, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen and Q^3 is chloro. Further, it is preferred that Q^3 is hydrogen.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein Q^1 is hydrogen, halogen, optionally substituted C_{2-6} alkenyl, optionally substituted C_{2-6} alkynyl, optionally substituted aryl or optionally substituted heteroaryl.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein R^1 is C_{1-4} alkyl. Preferably, R^1 is methyl or ethyl. More preferably, R^1 is methyl. It is also preferred that R^1 is ethyl.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein R^1 is methyl or ethyl, Q^1 is hydrogen or halogen, Q^2 is hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen and Q^3 is hydrogen or halogen. Preferably, Q^1 is chloro, bromo or iodo, Q^2 is hydrogen, methyl, ethyl, chloro or bromo, and Q^3 is fluoro or bromo.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein R^2 is hydrogen or methyl. Preferably, R^2 is hydrogen.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein R^1 is methyl or ethyl, R^2 is hydrogen, Q^1 is hydrogen or halogen, Q^2 is hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen and Q^3 is hydrogen or halogen. Preferebly, Q^1 is chloro, bromo or iodo, Q^2 is hydrogen, methyl, ethyl, chloro or bromo, and Q^3 is hydrogen, fluoro or bromo.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein R^3 is tert-butyl, 1-halo-2-methylprop-2-yl, 1,1-dihalo-2-methylprop-2-yl, 1,1,1-trihalo-2-methylprop-2-yl, 1-alkoxy-2-methylprop-2-yl, 1-alkenyloxy-2-methylprop-2-yl, 1-alkynyloxy-2-methylprop-2-yl, 1-cyano-2-methyl-prop-2-yl, 1-alkoxyalkoxy-2-methyl-prop-2-yl, 1-halo-3-methylbut-3-yl, 1-alkoxy-3-methylbut-3-yl, 1-alkenyloxy-3-methylbut-3-yl, 1-alkynyloxy-3-methylbut-3-yl, 1-cyano-3-methylbut-3-yl, 2-cyanoprop-2-yl, 2-(C_{1-6})alkoxycarbonylprop-2-yl, 2-methoxycarbonylprop-2-yl or 2-methylaminocarbonylprop-2-yl, 1-alkylthio-2-methylprop-2-yl, 2-cyano-1-alkoxyprop-2-yl, 1-alkoxy-prop-2-yl, 1-halo-prop-2-yl, 1-cyanoalkyl-3-methylbut-3-yl, 1-haloalkyl-3-methylbut-3-yl, and R^1, R^2, Q^1, Q^2 and Q^3 are as defined above. Preferably, R^1 is methyl or ethyl, R^2 is hydrogen, Q^1 is hydrogen or halogen, Q^2 is hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen and Q^3 is hydrogen or halogen. More preferably, Q^1 is chloro, bromo or iodo, Q^2 is hydrogen, methyl, ethyl, chloro or bromo, and Q^3 is hydrogen, fluoro, chloro or bromo. It is also preferred that R^3 is tert-butyl, 1-halo-2-methylprop-2-yl, 1-methoxy-2-methylprop-2-yl, 1-ethoxy-2-methylprop-2-yl, 1-allyloxy-2-methylprop-2-yl, 1-(prop-2-ynyloxy)-2-methylprop-2-yl or 2-cyano-1-methoxyprop-2-yl, and R^1, R^2, Q^1, Q^2 and Q^3 are as defined above.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein R^4 is C_{1-6} alkyl optionally substituted with C_{1-4}alkoxy-(C_{1-4})alkoxy(C_{1-4})alkyl, wherein the alkyl group is optionally substituted with halo, mono- or di-(C_{1-6})alkylamino or tri(C_{1-4})alkylsilyl, or R^4 is

C_{1-6} alkyl optionally substituted with benzyloxy(C_{1-4})alkyl, wherein the alkyl group is optionally substituted with halo, mono- or di-(C_{1-6})alkylamino or tri(C_{1-4})alkylsilyl, or R^4 is C_{1-6} alkyl optionally substituted with C_{2-6} alkenyloxy, C_{2-6} alkynyloxy or -$S(O)_x(C_{1-6})$alkyl, wherein x is 0, 1 or 2 and the alkyl group is optionally substituted with halo, mono- or di-(C_{1-6})alkylamino, R^4 is $-CH_2-C\equiv C-R^5$, wherein R^5 is hydrogen, C_{1-6} alkyl optionally substituted with halogen, hydroxy, C_{1-6} alkoxy, C_{1-3} alkoxy(C_{1-3})alkoxy, cyano and R^1, R^2, Q^1, Q^2 and Q^3 are as defined above. Preferably, R^1 is methyl or ethyl, R^2 is hydrogen, Q^1 is hydrogen or halogen, Q^2 is hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen and Q^3 is hydrogen or halogen. More preferably, Q^1 is chloro, bromo or iodo, Q^2 is hydrogen, methyl, ethyl, chloro or bromo, and Q^3 is hydrogen, fluoro, chloro or bromo.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein the optionally substituted aryl and optionally substituted heteroaryl rings or moieties of the R_5 values are optionally substituted with halogen, cyano, nitro, azido, C_{1-6} alkyl, halo(C_{1-6})alkyl, C_{3-6} cycloalkyl, C_{3-6} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, C_{2-6} alkenyl, halo(C_{2-6})alkenyl, C_{2-6} alkynyl, halo(C_{2-6})alkynyl, C_{1-6} alkoxy, halo(C_{1-6})alkoxy, C_{2-6} alkenyloxy, halo(C_{2-6})alkenyloxy, C_{2-6} alkynyloxy, halo(C_{2-6})alkynyloxy, aryl, aryloxy, aryl(C_{1-6})alkyl, aryl(C_{1-6})alkoxy, heteroaryl, heteroaryloxy, heteroaryl(C_{1-6})alkyl, heteroaryl(C_{1-6})alkoxy, $-SF_5$, -$S(O)_g(C_{1-4})$alkyl wherein g is 0, 1 or 2 and the alkyl is optionally substituted with halo, or R^5 is optionally substituted with -$OSO_2(C_{1-4})$alkyl, wherein the alkyl group is optionally substituted with halo, or R^5 is optionally substituted with $-CONR^gR^h$, $-COR^g$, $-CO_2R^g$, $-R^{gg}=NR^h$, $-NR^gR^h$, $-NR^gCOR^h$, $-NR^gCO_2R^h$, $-SO_2NR^gR^h$ or $-NR^gSO_2R^i$, wherein R^i is C_{1-6} alkyl optionally substituted with halogen and R^{gg} is C_{1-6} alkylene, R^g and R^h, independently of each other, are hydrogen or C_{1-6} alkyl optionally substituted with halogen, or, in the case of $-CONR^gR^h$ or $-SO_2NR^gR^h$, R^gR^h may join to form a 5- or 6-membered carbocyclic or heterocyclic ring containing a heteroatom selected from sulphur, oxygen or NR^0, wherein R^0 is hydrogen or optionally substituted C_{1-6}alkyl and R^1, R^2, Q^1, Q^2 and Q^3 are as defined above. Preferably, R^1 is methyl or ethyl, R^2 is hydrogen, Q^1 is hydrogen or halogen, Q^2 is hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen and Q^3 is hydrogen or halogen. More preferably, Q^1 is chloro, bromo or iodo, Q^2 is hydrogen, methyl, ethyl, chloro or bromo, and Q^3 is hydrogen, fluoro, chloro or bromo.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein the optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl or optionally substituted 5- to 8-membered ring R^4 is optionally substituted with halogen, cyano, nitro, azido, C_{1-6} alkyl, halo(C_{1-6})alkyl, C_{3-6} cycloalkyl, C_{3-6} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, C_{2-6} alkenyl, halo(C_{2-6})alkenyl, C_{2-6} alkynyl, halo(C_{2-6})alkynyl, C_{1-6} alkoxy, halo(C_{1-6})alkoxy, C_{2-6} alkenyloxy, halo(C_{2-6})-

alkenyloxy, C_{2-6} alkynyloxy, halo(C_{2-6})alkynyloxy, $-SF_5$, $-S(O)_x(C_{1-6})$alkyl, wherein x is 0, 1 or 2 and the alkyl group is optionally substituted with halo, or R^4 is optionally substituted with $-OSO_2(C_{1-4})$alkyl, wherein the alkyl group is optionally substituted with halogen, $-CONR^xR^y$, $-CON(OR^x)R^y$, $-COR^x$, $-CO_2R^x$, $-CR^x=NR^y$, $-NR^xR^y$, $-NR^xCOR^y$, $-NR^xCO_2R^y$, $-SO_2NR^xR^y$ or $-NR^xSO_2R^z$, wherein R^z is C_{1-8} alkyl optionally substituted with halogen and R^x and R^y, independently of each other, are hydrogen or C_{1-6} alkyl optionally substituted with halogen and R^1, R^2, Q^1, Q^2 and Q^3 are as defined above. Preferably, R^1 is methyl or ethyl, R^2 is hydrogen, Q^1 is hydrogen or halogen, Q^2 is hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen and Q^3 is hydrogen or halogen. More preferably, Q^1 is chloro, bromo or iodo, Q^2 is hydrogen, methyl, ethyl, chloro or bromo, and Q^3 is hydrogen, fluoro, chloro or bromo.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein L is oxygen.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein m is 0.

Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein m is 1.

Compounds that form part of the invention are illustrated in Tables 1 to 160 below.

Table 1

The compounds in Table 1 are of the general formula (I) where Q1, Q2, Q3, Q4, Q5 and Q6 are hydrogen, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the Table.

Compound No.	R^2	R^3
1	H	CH_3
2	CH_3	CH_3
3	H	C_2H_5
4	C_2H_5	C_2H_5
5	H	prop-2-yl
6	CH_3	prop-2-yl
7	prop-2-yl	prop-2-yl
8	CH_3	*n*-butyl
9	H	but-2-yl
10	H	2-methyl-prop-1-yl

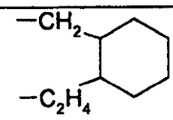
11	2-methyl-prop-1-yl	2-methyl-prop-1-yl
12	H	*tert*-C_4H_9
13	CH_3	*tert*-C_4H_9
14	H	pent-2-yl
15	H	pent-3-yl
16	H	2-methyl-but-2-yl
17	H	3-methyl-but-1-yl
18	H	3-methyl-pent-2-yl
19	H	4-methyl-pent-2-yl
20	H	3,3-dimethyl-but-2-yl
21	H	2-methyl-hex-2-yl
22	H	2,4-dimethyl-pent-2-yl
23	H	2,4,4-trimethyl-but-2-yl
24	H	2,4,4-trimethyl-pent-2-yl
25	H	Cl-*n*-C_3H_6-
26	H	Cl-$CH_2(CH_3)_2C$-
27	H	$F_3C(CH_3)_2C$-
28	H	NC-CH_2-
29	CH_3	NC-CH_2-
30	NC-CH_2-	NC-CH_2-
31	H	$(NC)_2CH$-
32	H	NC-C_2H_4-
33	CH_3	NC-C_2H_4-
34	NC-C_2H_4-	NC-C_2H_4-
35	H	$(CH_3)_2C(CN)$-
36	H	$C_2H_5(CH_3)C(CN)$-
37	H	$(C_2H_5)_2C(CN)$-
38	H	$(CH_3)_2CH(CH_3)C(CN)$-
39	H	HO-$CH_2(CH_3)_2C$-
40	H	HO-$C_2H_4(CH_3)_2C$-
41	H	1-hydroxy-2-(hydroxymethyl)-prop-2-yl
42	H	1-hydroxy-2-(methoxymethyl)prop-2-yl
43	H	1-methoxy-2-(methoxymethyl)prop-

		2-yl
44	H	1-hydroxy-2-(hydroxymethyl)-but-2-yl
45	$C_2H_5OC_2H_4$-	$C_2H_5OC_2H_4$-
46	CH_3	$(CH_3O)_2CHCH_2$-
47	H	CH_3O-$CH_2(CH_3)_2C$-
48	H	CH_3O-$C_2H_4(CH_3)_2C$-
49	H	C_2H_5O-$C_2H_4(CH_3)_2C$-
50	H	CH_3S-$CH_2(CH_3)_2C$-
51	H	NC-$(CH_3O)CH$-
52	H	$CH_3OCH_2(CH_3)C(CN)$-
53	H	$CH_3SCH_2(CH_3)C(CN)$-
54	H	$CH_3(CO)(CH_3)_2C$-
55	H	$CH_3CHBr(CO)(CH_3)_2C$-
56	H	$CH_3(CO)(OH)CH(CH_3)_2C$-
57	H	$CH_3OC_2H_4(CO)(CH_3)_2C$-
58	H	$CH_3(CO)CH_2(CH_3)_2C$-
59	H	$CH_3O(CO)(CH_3)CH$-
60	H	$CH_3O(CO)(CH_3)_2C$-
61	H	$C_2H_5O(CO)C_2H_4$-
62	H	$CH_3NH(CO)(CH_3)_2C$-
63	H	$(CH_3)_2N(CO)(CH_3)_2C$-
64	H	$(CH_3)_3SiCH_2$-
65	H	*tert*-$C_4H_9(CH_3)_2SiO$-$CH_2(CH_3)_2C$-
66	H	*tert*-$C_4H_9(CH_3)_2SiO$-$C_2H_4(CH_3)_2C$-
67	H	4-$FPhCH_2OCH_2(CH_3)_2C$-
68	H	$C_2H_5OCH_2(CH_3)_2C$-
69	H	$CH_3OCH_2CH_2OCH_2(CH_3)_2C$-
70	H	CH_2=$CHCH_2$-
71	CH_2=$CHCH_2$-	CH_2=$CHCH_2$-
72	H	CH_2=$C(CH_3)CH_2$-
73	H	CH_2=$CH(CH_3)CH$-
74	H	CH_2=$CH(CH_3)_2C$-
75	H	$CH_3(CO)CH$=CH-
76	CH_3	$CH_3(CO)CH$=CH-
77	H	pent-3-en-2-yl

78	H	2-methyl-hex-3-en-2-yl (E)
79	H	2-methyl-hex-3-en-2-yl (Z)
80	H	2-methyl-pent-4-en-3-on-2-yl
81	H	$CH_3O(CO)CH=(Cl)C(CH_3)_2C$-
82	H	C_6H_5-$C(CH_3)=CH(CH_3)_2C$-
83	H	$HC\equiv CCH_2CH_2$-
84	H	$HC\equiv CCH_2CH(CH_3)$-
85	H	$HC\equiv CCH_2C(CH_3)_2$-
86	H	cyclopropyl
87	NC-C_2H_4-	cyclopropyl
88	cycloprop-1-yl	cyclopropyl
89	H	1-cyano-cycloprop-1-yl
90	H	2-cyano-cycloprop-1-yl
91	H	1-methoxycarbonyl-cycloprop-1-yl
92	H	1-[*N*,*N*-dimethylaminocarbonyl]-cycloprop-1-yl
93	H	1-[*N*-methyl-*N*-methoxy-aminocarbonyl]-cycloprop-1-yl
94	H	1-cyano-1-cyclopropyl-eth-1-yl
95	H	cyclopentyl
96	H	1-cyano-cyclopent-1-yl
97	H	cyclohexyl
98	$CH_2=CHCH_2$-	cyclohexyl
99	H	4-cyano-cyclohex-1-yl
100	H	1-cyano-4-methyl-cyclohex-1-yl
101	H	4-*tert*-butyl-1-cyano-cyclohex-1-yl
102	H	2-methyl-3-cyanotetrahydro-furan-3-yl
103	H	5-methyl-1,3-dioxolan-5-yl
104	H	5-ethyl-1,3-dioxolan-5-yl
105	H	3,5-dimethyl-1,3-dioxolan-5-yl
106	H	N-ethoxycarbonyl-piperid-4-yl
107	H	morpholino
108	H	cyclohex-1-yl-methyl
109	H	4-cyano-cyclopenten-3-yl

110	H	5-*tert*-butyl-2*H*-1,3,4-thiadiazin-2-yl
111	H	2-(cyclohexen-1-yl)-eth-1-yl
112	H	fur-2-yl
113	H	5-methoxycarbonyl-fur-2-yl
114	H	thien-2-yl
115	H	2-methoxycarbonyl-thien-3-yl
116	H	4-methoxycarbonyl-thien-3-yl
117	H	oxazol-2-yl
118	H	5-methyl-isoxazol-3-yl
119	H	4-cyano-3-methyl-isoxazol-5-yl
120	H	thiazol-2-yl
121	H	5-ethylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl
122	H	fur-2-ylmethyl
123	H	cyanofur-1-ylmethyl
124	H	thien-2-ylmethyl
150	H	$C_6H_5CH_2$-
151	CH_3	$C_6H_5CH_2$-
152	H	2-F-$C_6H_4CH_2$-
153	H	2-Cl-$C_6H_4CH_2$-
154	CH_3	2-Cl-$C_6H_4CH_2$-
155	H	2-NO_2-$C_6H_4CH_2$-
156	H	2-CH_3-$C_6H_4CH_2$-
157	H	2-CH_3O-$C_6H_4CH_2$-
158	H	2-CHF_2O-$C_6H_4CH_2$-
159	H	2-CH_3S-$C_6H_4CH_2$-
160	H	2-CF_3S-$C_6H_4CH_2$-
161	H	3-Cl-$C_6H_4CH_2$-
162	H	3-I-$C_6H_4CH_2$-
163	H	3-CH_3-$C_6H_4CH_2$-
164	H	3-CH_3O-$C_6H_4CH_2$-
165	H	4-F-$C_6H_4CH_2$-
166	H	4-Cl-$C_6H_4CH_2$-
167	H	4-CH_3-$C_6H_4CH_2$-
168	H	4-CF_3-$C_6H_4CH_2$-
169	H	4-CH_3O-$C_6H_4CH_2$-

170	H	4-CF_3O-$C_6H_4CH_2$-
171	H	2,6-di-F-$C_6H_3CH_2$-
172	3-methyl-but-2-en-1-yl	2,5-di-F-$C_6H_3CH_2$-
173	H	2-F-4-Cl-$C_6H_3CH_2$-
174	H	2-F-6-Cl-$C_6H_3CH_2$-
175	H	2,6-di-Cl-$C_6H_3CH_2$-
176	4-methyl-pent-2-en-1-yl	3,4-di-Cl-$C_6H_3CH_2$-
177	H	2-F-6-CH_3O-$C_6H_3CH_2$-
178	H	2,4,5-tri-F-$C_6H_2CH_2$-
179	H	2,4-di-Cl-6-CH_3-$C_6H_2CH_2$-
180	H	3,4,5-tri-CH_3O-$C_6H_2CH_2$-
181	H	C_6H_5-$CH(CH_3)$-
182	H	4-F-C_6H_4-$CH(CH_3)$-
183	H	4-NO_2-C_6H_4-$CH(CH_3)$-
184	H	4-*n*-pentyl-C_6H_4-$CH(CH_3)$-
185	H	4-CH_3SO_2-C_6H_4-$CH(CH_3)$-
186	H	$C_6H_5(CO)CH_2$-
187	H	C_6H_5-CH(CN)-
188	H	C_6H_5-$(CH_3O)CH$-
189	H	C_6H_5-$(CH_3)_2C$-
190	H	*m*-Cl-C_6H_5-$(CH_3)_2C$-
191	H	3,5-di-Cl-C_6H_3-$(CH_3)_2C$-
192	H	C_6H_5-$(C_2H_5O(CO))CH$-
193	H	phenethyl
194	H	3-methoxy-4-propargyloxy-phenethyl
195	H	3-methoxy-4-(pent-2-yn-1-yloxy)-phenethyl
196	H	2-methyl-3-phenyl-prop-2-yl
197	H	C_6H_5O-C_2H_4-
198	H	4-F-C_6H_4-$CH_2OCH_2(CH_3)_2C$-
199	H	C_6H_5-$CH_2O(CO)C_2H_4$-
200	H	naphth-2-yl-$(CH_3)CH$-
201	NC-C_2H_4-	pyrid-3-ylmethyl
202	CH_3	2-pyrid-2-yleth-1-yl
203	H	2-(3-chloro-5-trifluoromethyl-pyrid-2-

		yl)oxyeth-1-yl
204	H	2-methyl-4-pyrazin-2-yl-but-3-on-2-yl
205	-$(CH_2)_4$-	
206	-$(CH_2)_5$-	
207	-$(CH_2)_4CH(C_2H_5)$-	
208	- $C_3H_8CH[(CO)N(C_2H_5)_2]CH_2$-	
209	-$CH(CH_3)CH=CHCH(CH_3)$-	
210		
211	-$C_2H_4OC_2H_4$-	
212	-$CH_2CH(CH_3)OCH(CH_3)CH_2$-	
213	-$C_2H_4SCH_2$-	
214	-$C_2H_4SC_2H_4$-	
215	-$(CH_2)_2NH(CH_2)_2$-	
216	-$(CH_2)_2N(p\text{-}NO_2\text{-}C_6H_4)(CH_2)_2$-	
217	-$(CH_2)_2N(m\text{-}CF_3\text{-}C_6H_4)(CH_2)_2$-	
218	-$(CH_2)_2N(p\text{-}CH_3CO\text{-}C_6H_4)(CH_2)_2$-	
219	-$(CH_2)_2N$(pyrid-2-yl)$(CH_2)_2$-	
220	H	$(H_2C=CHCH_2OCH_2)(CH_3)_2C$-
221	H	$(HCCHCH_2OCH_2)(CH_3)_2C$-
222	H	$(CH_3CH_2OCH_2)(CH_3)_2C$-
223	H	$((CH_3)_2CHOCH_2)(CH_3)_2C$-
224	H	$C_6H_5CH_2OCH_2(CH_3)_2C$-
225	H	$(CH_3CH_2OCH_2)(CH_3)_2C$-
226	H	4-F-C_6H_4-$CH_2(CH_3)C(CN)$-
227	H	4-Cl-C_6H_4-$CH_2(CH_3)C(CN)$-
228	H	4-CH_3O-C_6H_4-$CH_2CH_2(CH_3)C(CN)$-
229	H	2-Cl-C_6H_4-$CH_2(CH_3)C(CN)$-
230	H	$(CH_3)_2CH$-$CH_2(CH_3)C(CN)$-
231	H	1-methoxymethyl-cycloprop-1-yl
232	H	1-benzyloxymethyl-cycloprop-1-yl
233	H	1-methoxymethoxy-2- methyl-prop-2-yl
235	H	1-cyclopropyl-eth-1-yl
236	H	2-fluoro-eth-1-yl

237	H	2,2,2-trifluoro-1-methyl-eth-1-yl
261	H	$(H_2C=CHCH_2OCH_2)(CH_3)CH$-
262	H	$(HC\equiv CHCH_2OCH_2)(CH_3)CH$-
263	H	$(CH_3CH_2OCH_2)(CH_3)CH$-
264	H	$(CH_3OCH_2)(CH_3)CH$-
265	H	$((CH_3)_2CHOCH_2)(CH_3)CH$-
266	H	$C_6H_5CH_2OCH_2(CH_3)CH$-
267	H	$(CH_3CH_2OCH_2)(CH_3)CH$-
268	H	$(cC_4H_7)CH2$-
269	H	$(cC_4H_7)CH_3CH$-
270	H	$FCH_2(CH_3)CH$-
271	H	$ClCH_2(CH_3)CH$-
272	H	$FCH_2CH_2(CH_3)CH$-
273	H	$ClCH_2CH_2(CH_3)CH$-
274	H	$FCH_2(CH_3)_2C$-
275	H	$FCH_2CH_2(CH_3)_2C$-
276	H	$ClCH_2CH_2(CH_3)_2C$-
278	H	tetrahydro-furan-2-ylmethyl
279	H	1-(tetrahydro-furan-2-yl)ethyl
280	H	1-methyl-1-(tetrahydro-furan-2-yl)ethyl
281	H	2-[1,3]dioxolan-2-yl-ethyl
282	H	2-[1,3]dioxolan-2-yl-1-methyl-ethyl
283	H	2-[1,3]dioxolan-2-yl-1,1-dimethyl-ethyl
284	H	prop-1-yl
285	CH_3	prop-1-yl
286	H	thiophen-3-ylmethyl
287	H	1-(thiophen-3-yl)-eth-1-yl
289	H	1-methyl-1-(thiophen-3-yl)-eth-1-yl
290	H	cyclobutyl
291	H	1-methyl-cyclobut-1-yl
292	H	$3\text{-}F\text{-}C_6H_4\text{-}CH(CH_3)$-
293	H	$3\text{-}F\text{-}C_6H_4\text{-}C(CH_3)_2$-
294	H	1-cyano-cyclobut-1-yl
295	H	$(O)HC(CH_3)_2C$-
296	H	$(MeO)_2C(CH_3)_2C$-

297	H	$(EtO)_2C(CH_3)_2C$-
298	H	$(O(CH_2)_2O)C(CH_3)_2C$-
299	H	$(O(CH_2)_3O)C(CH_3)_2C$-

Table 2

The compounds in Table 2 are of the general formula (I) where Q1, Q2, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 2 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 2, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 2 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 2, R^1 is ethyl.

Table 3

The compounds in Table 3 are of the general formula (I) where Q1, Q2, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 3 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 3, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 3 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 3, m is 1.

Table 4

The compounds in Table 4 are of the general formula (I) where Q1, Q2, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 4 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 4, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 4 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 4, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 5

The compounds in Table 5 are of the general formula (I) where Q1, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is methyl, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 5 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 5, Q2 is methyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 5 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 4, Q2 is methyl.

Table 6

The compounds in Table 6 are of the general formula (I) where Q1, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is methyl, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 6 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 6, Q2 is methyl, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 6 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 6, Q2 is methyl, R^1 is ethyl.

Table 7

The compounds in Table 7 are of the general formula (I) where Q1, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is methyl, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 7 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 7, Q2 is methyl, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 7 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 7, Q2 is methyl, m is 1.

Table 8

The compounds in Table 8 are of the general formula (I) where Q1, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is methyl, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 8 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 8, Q2 is methyl, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 8 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 8, Q2 is methyl, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 9

The compounds in Table 9 are of the general formula (I) where Q1, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is chloro, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 9 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 9, Q2 is chloro. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 9 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 9, Q2 is chloro.

Table 10

The compounds in Table 10 are of the general formula (I) where Q1, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is chloro, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values

given in the table. Thus, compound 1 of Table 10 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 10, Q2 is chloro, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 10 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 10, Q2 is chloro, R^1 is ethyl.

Table 11

The compounds in Table 11 are of the general formula (I) where Q1, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is chloro, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 11 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 11, Q2 is chloro, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 11 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 11, Q2 is chloro, m is 1.

Table 12

The compounds in Table 12 are of the general formula (I) where Q1, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is chloro, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 12 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 12, Q2 is chloro, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 12 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 12, Q2 is chloro, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 13

The compounds in Table 13 are of the general formula (I) where Q1, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is bromine, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 13 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 13, Q2 is bromine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 13 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 13, Q2 is bromine.

Table 14

The compounds in Table 14 are of the general formula (I) where Q1, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is bromine, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 14 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 14, Q2 is bromine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 14 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 14, Q2 is bromine, R^1 is ethyl.

Table 15

The compounds in Table 15 are of the general formula (I) where Q1, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is bromine, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 15 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 15, Q2 is bromine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 15 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 15, Q2 is bromine, m is 1.

Table 16

The compounds in Table 16 are of the general formula (I) where Q1, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is bromine, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 16 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 16, Q2 is bromine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 16 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 16, Q2 is bromine, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 17

The compounds in Table 17 are of the general formula (I) where Q1, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is fluoro, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 17 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 17, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 17 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 17, Q3 is fluoro.

Table 18

The compounds in Table 18 are of the general formula (I) where Q1, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is fluoro, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 18 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 18, Q3 is fluoro, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 18 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 18, Q3 is fluoro, R^1 is ethyl.

Table 19

The compounds in Table 19 are of the general formula (I) where Q1, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is fluoro, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 19 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 19, Q3 is fluoro, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 19 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 19, Q3 is fluoro, m is 1.

Table 20

The compounds in Table 20 are of the general formula (I) where Q1, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is fluoro, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 20 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 20, Q3 is fluoro, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 20 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 20, Q3 is fluoro, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 21

The compounds in Table 21 are of the general formula (I) where Q1, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is chloro, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 21 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 21, Q3 is chloro. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 21 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 21, Q3 is chloro.

Table 22

The compounds in Table 22 are of the general formula (I) where Q1, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is chloro, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 22 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 22, Q3 is chloro, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 22 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 22, Q3 is chloro, R^1 is ethyl.

Table 23

The compounds in Table 23 are of the general formula (I) where Q1, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is chloro, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 23 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 23, Q3 is chloro, m is 1. Similarly, compounds 2 to

299 of Table 23 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 23, Q3 is chloro, m is 1.

Table 24

The compounds in Table 24 are of the general formula (I) where Q1, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is chloro, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 24 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 24, Q3 is chloro, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 24 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 24, Q3 is chloro, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 25

The compounds in Table 25 are of the general formula (I) where Q1, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is bromine, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 25 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 25, Q3 is bromine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 25 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 25, Q3 is bromine.

Table 26

The compounds in Table 26 are of the general formula (I) where Q1, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is bromine, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 26 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 26, Q3 is bromine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 26 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 26, Q3 is bromine, R^1 is ethyl.

Table 27

The compounds in Table 27 are of the general formula (I) where Q1, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is bromine, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 27 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 27, Q3 is bromine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 27 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 27, Q3 is bromine, m is 1.

Table 28

The compounds in Table 28 are of the general formula (I) where Q1, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is bromine, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 28 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 28, Q3 is bromine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 28 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 28, Q3 is bromine, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 29

The compounds in Table 29 are of the general formula (I) where Q1, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is methyl, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 29 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 29, Q3 is methyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 29 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 29, Q3 is methyl.

Table 30

The compounds in Table 30 are of the general formula (I) where Q1, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is methyl, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 30 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 30, Q3 is methyl, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 30 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 30, Q3 is methyl, R^1 is ethyl.

Table 31

The compounds in Table 31 are of the general formula (I) where Q1, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is methyl, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 31 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 31, Q3 is methyl, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 31 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 31, Q3 is methyl, m is 1.

Table 32

The compounds in Table 32 are of the general formula (I) where Q1, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is methyl, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 32 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 32, Q3 is methyl, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 32 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 32, Q3 is methyl, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 33

The compounds in Table 33 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is methyl, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 33 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 33, Q1 is chlorine, Q2 is methyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 33 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 33, Q1 is chlorine, Q2 is methyl.

Table 34

The compounds in Table 34 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is methyl, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 34 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 34, Q1 is chlorine, Q2 is methyl, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 34 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 34, Q1 is chlorine, Q2 is methyl, R^1 is ethyl.

Table 35

The compounds in Table 35 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is methyl, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 35 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 35, Q1 is chlorine, Q2 is methyl, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 35 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 35, Q1 is chlorine, Q2 is methyl, m is 1.

Table 36

The compounds in Table 36 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is methyl, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 36 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 36, Q1 is chlorine, Q2 is methyl, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 36 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 36, Q1 is chlorine, Q2 is methyl, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 37

The compounds in Table 37 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is chlorine, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 37 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 37, Q1 is chlorine, Q2 is chlorine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 37 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 37, Q1 is chlorine, Q2 is chlorine.

Table 38

The compounds in Table 38 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is chlorine, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 38 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 38, Q1 is chlorine, Q2 is chlorine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 38 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 38, Q1 is chlorine, Q2 is chlorine, R^1 is ethyl.

Table 39

The compounds in Table 39 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is chlorine, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 39 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 39, Q1 is chlorine, Q2 is chlorine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 39 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 39, Q1 is chlorine, Q2 is chlorine, m is 1.

Table 40

The compounds in Table 40 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is chlorine, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 40 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 40, Q1 is chlorine, Q2 is chlorine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 40 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 40, Q1 is chlorine, Q2 is chlorine, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 41

The compounds in Table 41 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is bromine, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 41 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 41, Q1 is chlorine, Q2 is bromine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 41 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 41, Q1 is chlorine, Q2 is bromine.

Table 42

The compounds in Table 42 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is bromine, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 42 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 42, Q1 is chlorine, Q2 is bromine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 42 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 42, Q1 is chlorine, Q2 is bromine, R^1 is ethyl.

Table 43

The compounds in Table 43 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is bromine, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 43 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 43, Q1 is chlorine, Q2 is bromine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 43 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 43, Q1 is chlorine, Q2 is bromine, m is 1.

Table 44

The compounds in Table 44 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is bromine, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 44 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 44, Q1 is chlorine, Q2 is bromine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 44 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 44, Q1 is chlorine, Q2 is bromine, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 45

The compounds in Table 45 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is fluoro, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 45 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 45, Q1 is chlorine, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 45 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 45, Q1 is chlorine, Q3 is fluoro.

Table 46

The compounds in Table 46 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is fluoro, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 46 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 46, Q1 is chlorine, Q3 is fluoro, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 46 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 46, Q1 is chlorine, Q3 is fluoro, R^1 is ethyl.

Table 47

The compounds in Table 47 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is fluoro, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 47 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 47, Q1 is chlorine, Q3 is fluoro, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 47 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 47, Q1 is chlorine, Q3 is fluoro, m is 1.

Table 48

The compounds in Table 48 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is fluoro, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 48 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 48, Q1 is chlorine, Q3 is fluoro, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 48 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 48, Q1 is chlorine, Q3 is fluoro, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 49

The compounds in Table 49 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is chlorine, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 49 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 49, Q1 is chlorine, Q3 is chlorine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 49 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 49, Q1 is chlorine, Q3 is chlorine.

Table 50

The compounds in Table 50 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is chlorine, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 50 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 50, Q1 is chlorine, Q3 is chlorine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 50 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 50, Q1 is chlorine, Q3 is chlorine, R^1 is ethyl.

Table 51

The compounds in Table 51 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is chlorine, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 51 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 51, Q1 is chlorine, Q3 is chlorine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 51 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 51, Q1 is chlorine, Q3 is chlorine, m is 1.

Table 52

The compounds in Table 52 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is chlorine, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 52 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 52, Q1 is chlorine, Q3 is chlorine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 52 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 52, Q1 is chlorine, Q3 is chlorine, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 53

The compounds in Table 53 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is bromine, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 53 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 53, Q1 is chlorine, Q3 is bromine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 53 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 53, Q1 is chlorine, Q3 is bromine.

Table 54

The compounds in Table 54 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is bromine, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 54 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 54, Q1 is chlorine, Q3 is bromine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 54 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 54, Q1 is chlorine, Q3 is bromine, R^1 is ethyl.

Table 55

The compounds in Table 55 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is bromine, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 55 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 55, Q1 is chlorine, Q3 is bromine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 55 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 55, Q1 is chlorine, Q3 is bromine, m is 1.

Table 56

The compounds in Table 56 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is bromine, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 56 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 56, Q1 is chlorine, Q3 is bromine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 56 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 56, Q1 is chlorine, Q3 is bromine, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 57

The compounds in Table 57 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is methyl, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 57 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 57, Q1 is chlorine, Q3 is methyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 57 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 57, Q1 is chlorine, Q3 is methyl.

Table 58

The compounds in Table 58 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is methyl, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 58 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 58, Q1 is chlorine, Q3 is methyl, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 58 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 58, Q1 is chlorine, Q3 is methyl, R^1 is ethyl.

Table 59

The compounds in Table 59 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is methyl, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 59 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 59, Q1 is chlorine, Q3 is methyl, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 59 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 59, Q1 is chlorine, Q3 is methyl, m is 1.

Table 60

The compounds in Table 60 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is methyl, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 60 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 60, Q1 is chlorine, Q3 is methyl, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 60 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 60, Q1 is chlorine, Q3 is methyl, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 61

The compounds in Table 61 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is methyl, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 61 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 61, Q1 is fluorine, Q2 is methyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 61 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 61, Q1 is fluorine, Q2 is methyl.

Table 62

The compounds in Table 62 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is methyl, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 62 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 62, Q1 is fluorine, Q2 is methyl, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 62 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 62, Q1 is fluorine, Q2 is methyl, R^1 is ethyl.

Table 63

The compounds in Table 63 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is methyl, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 63 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 63, Q1 is fluorine, Q2 is methyl, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 63 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 63, Q1 is fluorine, Q2 is methyl, m is 1.

Table 64

The compounds in Table 64 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is methyl, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 64 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 64, Q1 is fluorine, Q2 is methyl, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 64 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 64, Q1 is fluorine, Q2 is methyl, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 65

The compounds in Table 65 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is chlorine, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 65 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 65, Q1 is fluorine, Q2 is chlorine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 65 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 65, Q1 is fluorine, Q2 is chlorine.

Table 66

The compounds in Table 66 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is chlorine, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 66 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 66, Q1 is fluorine, Q2 is chlorine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 66 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 66, Q1 is fluorine, Q2 is chlorine, R^1 is ethyl.

Table 67

The compounds in Table 67 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is chlorine, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 67 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 67, Q1 is fluorine, Q2 is chlorine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 67 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 67, Q1 is fluorine, Q2 is chlorine, m is 1.

Table 68

The compounds in Table 68 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is chlorine, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 68 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 68, Q1 is fluorine, Q2 is chlorine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 68 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 68, Q1 is fluorine, Q2 is chlorine, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 69

The compounds in Table 69 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is bromine, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 69 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 69, Q1 is fluorine, Q2 is bromine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 69 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 69, Q1 is fluorine, Q2 is bromine.

Table 70

The compounds in Table 70 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is bromine, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 70 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 70, Q1 is fluorine, Q2 is bromine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 70 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 70, Q1 is fluorine, Q2 is bromine, R^1 is ethyl.

Table 71

The compounds in Table 71 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is bromine, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 71 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 71, Q1 is fluorine, Q2 is bromine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 71 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 71, Q1 is fluorine, Q2 is bromine, m is 1.

Table 72

The compounds in Table 72 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is bromine, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 72 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 72, Q1 is fluorine, Q2 is bromine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 72 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 72, Q1 is fluorine, Q2 is bromine, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 73

The compounds in Table 73 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is fluoro, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 73 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 73, Q1 is fluorine, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 73 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 73, Q1 is fluorine, Q3 is fluoro.

Table 74

The compounds in Table 74 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is fluoro, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 74 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 74, Q1 is fluorine, Q3 is fluoro, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 74 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 74, Q1 is fluorine, Q3 is fluoro, R^1 is ethyl.

Table 75

The compounds in Table 75 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is fluoro, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 75 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 75, Q1 is fluorine, Q3 is fluoro, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 75 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 75, Q1 is fluorine, Q3 is fluoro, m is 1.

Table 76

The compounds in Table 76 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is fluoro, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 76 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 76, Q1 is fluorine, Q3 is fluoro, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 76 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 76, Q1 is fluorine, Q3 is fluoro, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 77

The compounds in Table 77 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is chlorine, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 77 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 77, Q1 is fluorine, Q3 is chlorine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 77 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 77, Q1 is fluorine, Q3 is chlorine.

Table 78

The compounds in Table 78 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is chlorine, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 78 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 78, Q1 is fluorine, Q3 is chlorine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 78 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 78, Q1 is fluorine, Q3 is chlorine, R^1 is ethyl.

Table 79

The compounds in Table 79 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is chlorine, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 79 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 79, Q1 is fluorine, Q3 is chlorine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 79 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 79, Q1 is fluorine, Q3 is chlorine, m is 1.

Table 80

The compounds in Table 80 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is chlorine, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 80 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 80, Q1 is fluorine, Q3 is chlorine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 80 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 80, Q1 is fluorine, Q3 is chlorine, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 81

The compounds in Table 81 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is bromine, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 81 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 81, Q1 is fluorine, Q3 is bromine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 81 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 81, Q1 is fluorine, Q3 is bromine.

Table 82

The compounds in Table 82 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is bromine, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 82 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 82, Q1 is fluorine, Q3 is bromine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 82 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 82, Q1 is fluorine, Q3 is bromine, R^1 is ethyl.

Table 83

The compounds in Table 83 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is bromine, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 83 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 83, Q1 is fluorine, Q3 is bromine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 83 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 83, Q1 is fluorine, Q3 is bromine, m is 1.

Table 84

The compounds in Table 84 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is bromine, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 84 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 84, Q1 is fluorine, Q3 is bromine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 84 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 84, Q1 is fluorine, Q3 is bromine, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 85

The compounds in Table 85 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is methyl, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 85 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 85, Q1 is fluorine, Q3 is methyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 85 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 85, Q1 is fluorine, Q3 is methyl.

Table 86

The compounds in Table 86 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is methyl, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 86 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 86, Q1 is fluorine, Q3 is methyl, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 86 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 86, Q1 is fluorine, Q3 is methyl, R^1 is ethyl.

Table 87

The compounds in Table 87 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is methyl, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 87 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 87, Q1 is fluorine, Q3 is methyl, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 87 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 87, Q1 is fluorine, Q3 is methyl, m is 1.

Table 88

The compounds in Table 88 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is methyl, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 88 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 88, Q1 is fluorine, Q3 is methyl, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 88 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 88, Q1 is fluorine, Q3 is methyl, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 89

The compounds in Table 89 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is methyl, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 89 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 89, Q1 is bromine, Q2 is methyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 89 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 89, Q1 is bromine, Q2 is methyl.

Table 90

The compounds in Table 90 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is methyl, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 90 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 90, Q1 is bromine, Q2 is methyl, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 90 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 90, Q1 is bromine, Q2 is methyl, R^1 is ethyl.

Table 91

The compounds in Table 91 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is methyl, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 91 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 91, Q1 is bromine, Q2 is methyl, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 91 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 91, Q1 is bromine, Q2 is methyl, m is 1.

Table 92

The compounds in Table 92 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is methyl, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 92 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 92, Q1 is bromine, Q2 is methyl, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 92 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 92, Q1 is bromine, Q2 is methyl, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 93

The compounds in Table 93 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is chlorine, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 93 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 93, Q1 is bromine, Q2 is chlorine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 93 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 93, Q1 is bromine, Q2 is chlorine.

Table 94

The compounds in Table 94 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is chlorine, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 94 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 94, Q1 is bromine, Q2 is chlorine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 94 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 94, Q1 is bromine, Q2 is chlorine, R^1 is ethyl.

Table 95

The compounds in Table 95 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is chlorine, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 95 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 95, Q1 is bromine, Q2 is chlorine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 95 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 95, Q1 is bromine, Q2 is chlorine, m is 1.

Table 96

The compounds in Table 96 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is chlorine, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 96 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 96, Q1 is bromine, Q2 is chlorine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 96 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 96, Q1 is bromine, Q2 is chlorine, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 97

The compounds in Table 97 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is bromine, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 97 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 97, Q1 is bromine, Q2 is bromine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 97 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 97, Q1 is bromine, Q2 is bromine.

Table 98

The compounds in Table 98 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is bromine, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 98 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 98, Q1 is bromine, Q2 is bromine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 98 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 98, Q1 is bromine, Q2 is bromine, R^1 is ethyl.

Table 99

The compounds in Table 99 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is bromine, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 99 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 99, Q1 is bromine, Q2 is bromine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 99 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 99, Q1 is bromine, Q2 is bromine, m is 1.

Table 100

The compounds in Table 100 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is bromine, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 100 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 100, Q1 is bromine, Q2 is bromine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 100 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 100, Q1 is bromine, Q2 is bromine, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 101

The compounds in Table 101 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is fluoro, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 101 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 101, Q1 is bromine, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 101 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 101, Q1 is bromine, Q3 is fluoro.

Table 102

The compounds in Table 102 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is fluoro, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 102 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 102, Q1 is bromine, Q3 is fluoro, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 102 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 102, Q1 is bromine, Q3 is fluoro, R^1 is ethyl.

Table 103

The compounds in Table 103 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is fluoro, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 103 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 103, Q1 is bromine, Q3 is fluoro, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 103 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 103, Q1 is bromine, Q3 is fluoro, m is 1.

Table 104

The compounds in Table 104 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is fluoro, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 104 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 104, Q1 is bromine, Q3 is fluoro, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 104 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 104, Q1 is bromine, Q3 is fluoro, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 105

The compounds in Table 105 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is chlorine, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 105 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 105, Q1 is bromine, Q3 is chlorine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 105 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 105, Q1 is bromine, Q3 is chlorine.

Table 106

The compounds in Table 106 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is chlorine, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 106 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 106, Q1 is bromine, Q3 is chlorine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 106 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 106, Q1 is bromine, Q3 is chlorine, R^1 is ethyl.

Table 107

The compounds in Table 107 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is chlorine, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 107 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 107, Q1 is bromine, Q3 is chlorine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 107 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 107, Q1 is bromine, Q3 is chlorine, m is 1.

Table 108

The compounds in Table 108 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is chlorine, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 108 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 108, Q1 is bromine, Q3 is chlorine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 108 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 108, Q1 is bromine, Q3 is chlorine, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 109

The compounds in Table 109 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is bromine, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 109 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 109, Q1 is bromine, Q3 is bromine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 109 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 109, Q1 is bromine, Q3 is bromine.

Table 110

The compounds in Table 110 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is bromine, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 110 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 110, Q1 is bromine, Q3 is bromine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 110 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 110, Q1 is bromine, Q3 is bromine, R^1 is ethyl.

Table 111

The compounds in Table 111 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is bromine, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 111 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 111, Q1 is bromine, Q3 is bromine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 111 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 111, Q1 is bromine, Q3 is bromine, m is 1.

Table 112

The compounds in Table 112 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is bromine, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 112 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 112, Q1 is bromine, Q3 is bromine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 112 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 112, Q1 is bromine, Q3 is bromine, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 113

The compounds in Table 113 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is methyl, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 113 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 113, Q1 is bromine, Q3 is methyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 113 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 113, Q1 is bromine, Q3 is methyl.

Table 114

The compounds in Table 114 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is methyl, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 114 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 114, Q1 is bromine, Q3 is methyl, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 114 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 114, Q1 is bromine, Q3 is methyl, R^1 is ethyl.

Table 115

The compounds in Table 115 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is methyl, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 115 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 115, Q1 is bromine, Q3 is methyl, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 115 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 115, Q1 is bromine, Q3 is methyl, m is 1.

Table 116

The compounds in Table 116 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is methyl, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 116 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 116, Q1 is bromine, Q3 is methyl, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 116 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 116, Q1 is bromine, Q3 is methyl, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 117

The compounds in Table 117 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is methyl, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 117 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 117, Q1 is iodine, Q2 is methyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 117 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 117, Q1 is iodine, Q2 is methyl.

Table 118

The compounds in Table 118 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is methyl, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 118 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 118, Q1 is iodine, Q2 is methyl, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 118 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 118, Q1 is iodine, Q2 is methyl, R^1 is ethyl.

Table 119

The compounds in Table 119 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is methyl, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 119 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 119, Q1 is iodine, Q2 is methyl, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 119 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 119, Q1 is iodine, Q2 is methyl, m is 1.

Table 120

The compounds in Table 120 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is methyl, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 120 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 120, Q1 is iodine, Q2 is methyl, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 120 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 120, Q1 is iodine, Q2 is methyl, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 121

The compounds in Table 121 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is chlorine, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 121 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 121, Q1 is iodine, Q2 is chlorine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 121 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 121, Q1 is iodine, Q2 is chlorine.

Table 122

The compounds in Table 122 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is chlorine, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 122 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 122, Q1 is iodine, Q2 is chlorine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 122 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 122, Q1 is iodine, Q2 is chlorine, R^1 is ethyl.

Table 123

The compounds in Table 123 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is chlorine, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 123 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 123, Q1 is iodine, Q2 is chlorine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 123 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 123, Q1 is iodine, Q2 is chlorine, m is 1.

Table 124

The compounds in Table 124 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is chlorine, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 124 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 124, Q1 is iodine, Q2 is chlorine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 124 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 124, Q1 is iodine, Q2 is chlorine, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 125

The compounds in Table 125 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is bromine, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 125 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 125, Q1 is iodine, Q2 is bromine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 125 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 125, Q1 is iodine, Q2 is bromine.

Table 126

The compounds in Table 126 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is bromine, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 126 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 126, Q1 is iodine, Q2 is bromine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 126 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 126, Q1 is iodine, Q2 is bromine, R^1 is ethyl.

Table 127

The compounds in Table 127 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is bromine, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 127 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 127, Q1 is iodine, Q2 is bromine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 127 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 127, Q1 is iodine, Q2 is bromine, m is 1.

Table 128

The compounds in Table 128 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q2 is bromine, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 128 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 128, Q1 is iodine, Q2 is bromine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 128 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 128, Q1 is iodine, Q2 is bromine, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 129

The compounds in Table 129 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is fluoro, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 129 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 129, Q1 is iodine, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 129 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 129, Q1 is iodine, Q3 is fluoro.

Table 130

The compounds in Table 130 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is fluoro, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 130 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 130, Q1 is iodine, Q3 is fluoro, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 130 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 130, Q1 is iodine, Q3 is fluoro, R^1 is ethyl.

Table 131

The compounds in Table 131 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is fluoro, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 131 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 131, Q1 is iodine, Q3 is fluoro, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 131 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 131, Q1 is iodine, Q3 is fluoro, m is 1.

Table 132

The compounds in Table 132 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is fluoro, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 132 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 132, Q1 is iodine, Q3 is fluoro, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 132 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 132, Q1 is iodine, Q3 is fluoro, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 133

The compounds in Table 133 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is chlorine, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 133 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 133, Q1 is iodine, Q3 is chlorine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 133 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 133, Q1 is iodine, Q3 is chlorine.

Table 134

The compounds in Table 134 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is chlorine, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 134 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 134, Q1 is iodine, Q3 is chlorine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 134 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 134, Q1 is iodine, Q3 is chlorine, R^1 is ethyl.

Table 135

The compounds in Table 135 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is chlorine, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 135 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 135, Q1 is iodine, Q3 is chlorine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 135 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 135, Q1 is iodine, Q3 is chlorine, m is 1.

Table 136

The compounds in Table 136 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is chlorine, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 136 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 136, Q1 is iodine, Q3 is chlorine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 136 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 136, Q1 is iodine, Q3 is chlorine, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 137

The compounds in Table 137 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is bromine, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 137 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 137, Q1 is iodine, Q3 is bromine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 137 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 137, Q1 is iodine, Q3 is bromine.

Table 138

The compounds in Table 138 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is bromine, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 138 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 138, Q1 is iodine, Q3 is bromine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 138 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 138, Q1 is iodine, Q3 is bromine, R^1 is ethyl.

Table 139

The compounds in Table 139 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is bromine, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 139 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 139, Q1 is iodine, Q3 is bromine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 139 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 139, Q1 is iodine, Q3 is bromine, m is 1.

Table 140

The compounds in Table 140 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is bromine, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 140 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 140, Q1 is iodine, Q3 is bromine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 140 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 140, Q1 is iodine, Q3 is bromine, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 141

The compounds in Table 141 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is methyl, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 141 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 141, Q1 is iodine, Q3 is methyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 141 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 141, Q1 is iodine, Q3 is methyl.

Table 142

The compounds in Table 142 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is methyl, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 142 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 142, Q1 is iodine, Q3 is methyl, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 142 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 142, Q1 is iodine, Q3 is methyl, R^1 is ethyl.

Table 143

The compounds in Table 143 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is methyl, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 143 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 143, Q1 is iodine, Q3 is methyl, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 143 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 143, Q1 is iodine, Q3 is methyl, m is 1.

Table 144

The compounds in Table 144 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q2, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, Q3 is methyl, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 144 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 144, Q1 is iodine, Q3 is methyl, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 144 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 144, Q1 is iodine, Q3 is methyl, m is 1, R^1 is ethyl.

Table 145

The compounds in Table 145 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine. Q2, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 145 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 145, Q1 is fluorine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 145 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 145, Q1 is fluorine.

Table 146

The compounds in Table 146 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q2, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 146 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 146, Q1 is fluorine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 146 to 299 of Table 146 are the same as compounds 146 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 146, Q1 is fluorine, R^1 is ethyl.

Table 147

The compounds in Table 147 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q2, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 147 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 147, Q1 is fluorine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 147 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 147, Q1 is fluorine, m is 1.

Table 148

The compounds in Table 148 are of the general formula (I) where Q1 is fluorine, Q2, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 148 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 148, Q1 is fluorine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 148 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 148, Q1 is fluorine , m is 1, R^1 is ethyl.

Table 149

The compounds in Table 149 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine. Q2, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 149 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 149, Q1 is chlorine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 149 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 149, Q1 is chlorine.

Table 150

The compounds in Table 150 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q2, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 150 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 150, Q1 is chlorine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 150 to 299 of Table 150 are the same as compounds 150 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 150, Q1 is chlorine, R^1 is ethyl.

Table 151

The compounds in Table 151 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q2, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 151 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 151, Q1 is chlorine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 151 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 151, Q1 is chlorine, m is 1.

Table 152

The compounds in Table 152 are of the general formula (I) where Q1 is chlorine, Q2, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 152 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 152, Q1 is chlorine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 152 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 152, Q1 is chlorine , m is 1, R^1 is ethyl.

Table 153

The compounds in Table 153 are of the general formula (I) where Q1 is bromine. Q2, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 153 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 153, Q1 is bromine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 153 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 153, Q1 is bromine.

Table 154

The compounds in Table 154 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q2, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 154 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 154, Q1 is bromine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 154 to 299 of Table 154 are the same as compounds 154 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 154, Q1 is bromine, R^1 is ethyl.

Table 155

The compounds in Table 155 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q2, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 155 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 155, Q1 is bromine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 155 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 155, Q1 is bromine, m is 1.

Table 156

The compounds in Table 156 are of the general formula (I) where Q1 is bromine, Q2, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 156 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 156, Q1 is bromine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 156 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 156, Q1 is bromine , m is 1, R^1 is ethyl.

Table 157

The compounds in Table 157 are of the general formula (I) where Q1 is iodine. Q2, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, m is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 157 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 157, Q1 is iodine. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 157 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 157, Q1 is iodine.

Table 158

The compounds in Table 158 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q2, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, m is 0, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 158 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 158, Q1 is iodine, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 158 to 299 of Table 158 are the same as compounds 158 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 158, Q1 is iodine, R^1 is ethyl.

Table 159

The compounds in Table 159 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q2, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, m is 1, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 159 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 159, Q1 is iodine, m is 1. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 159 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 159, Q1 is iodine, m is 1.

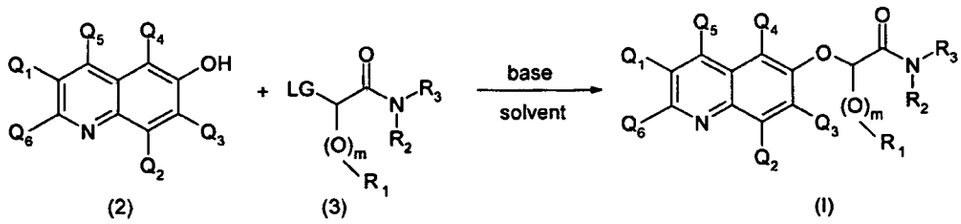
Table 160

The compounds in Table 160 are of the general formula (I) where Q1 is iodine, Q2, Q3, Q4, Q5 & Q6 are hydrogen, m is 1, L is O, R^1 is ethyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table. Thus, compound 1 of Table 160 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 160, Q1 is iodine, m is 1, R^1 is ethyl. Similarly, compounds 2 to 299 of Table 160 are the same as compounds 2 to 299 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 160, Q1 is iodine , m is 1, R^1 is ethyl.

The compounds of general formula (I) may be prepared as outlined in Schemes 1 to 9 below in which Q_1, Q_2, Q_3, Q_4, Q_5, Q_6, R_1, R_2, R_3, m and L have the meanings given above, R^6 is H or C_{1-4} alkyl, as indicated, R^7, R^8, R^{12}, R^{13} and R^{14} are independently H or C_{1-4} alkyl, R^9 and R^{10} are independently H or C_{1-4} alkyl where R^9 and R^{10} are not simultaneously H, R^{13} and R^{14} are independently H or optionally substituted C_{1-4} alkyl, R^{11} is C_{1-6} alkyl, optionally substituted benzyl, optionally substituted C_{2-6} alkenyl, optionally substituted C_{2-4} alkynyl, n is 0, 1 or 2 unless otherwise indicated. DMF is *N,N*-dimethylformamide, NBS is *N*-bromosuccinimide. Other abbreviations are defined in the text. Where typical or preferred process conditions (reaction temperature, time, solvent, mole ratios of reactants) are given, unless otherwise stated other process conditions can also be used. While optimum reaction conditions may vary with the particular reactants or solvents used, such conditions can be determined by routine optimisation procedures by one skilled in the art.

As shown in Scheme 1, the compounds of general formula (1) may be prepared by reacting a compound of the general formula (2) with a compound of the general formula (3) in the presence of a base in a suitable solvent. Typical solvents include *N,N*-dimethylformamide and *N*-methylpyrrolidin-2-one. Suitable bases include potassium carbonate, calcium carbonate, sodium hydride or di*iso*propylethylamine.

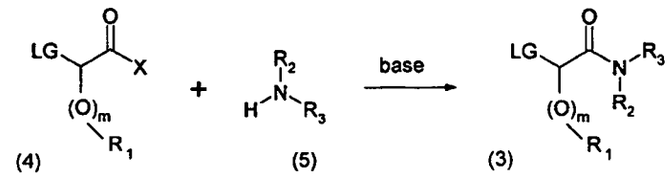
Scheme 1



(2) (3) (I)

As shown in Scheme 2, compounds of the general formula (3) may be prepared by reacting an amine of the general formula (5) with an activated carboxylic acid such as an acid halide or the corresponding acid anhydride of the general formula (4), in the presence of a suitable inorganic or organic base, such as potassium carbonate or di*iso*propylethylamine, in a solvent such as dichloromethane, tetrahydrofuran or N.N-dimethylformamide.

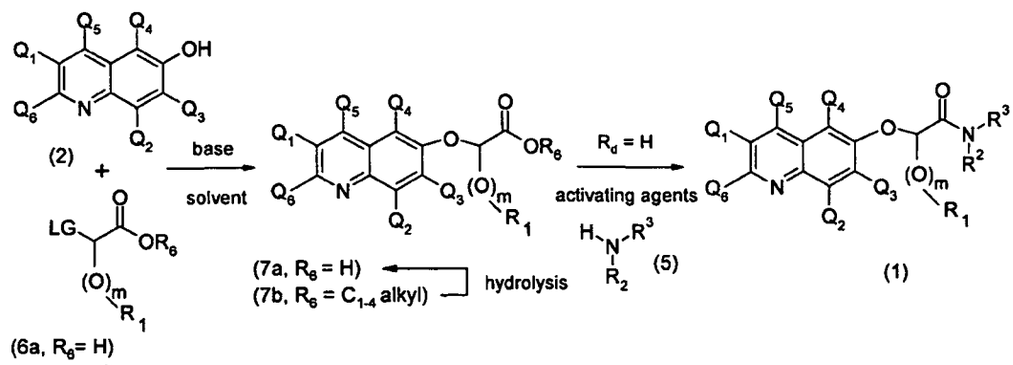
Scheme 2



LG = leaving group

Alternatively, as shown in Scheme 3, compounds of the general formula (1) may be prepared by condensing a compound of the general formula (7a), wherein R_6 is H with an amine of the general formula (5) using suitable activating reagents such as 1-hydroxybenzotriazole (HOBt), (benzotriazol-1-yloxy)-tris-(dimethylamino)-phosphonium-hexa-fluorophosphate (BOP), 1-hydroxy-7-azabenzotriazole (HOAT) or, *N*-(3-dimethylamino-propyl)-*N'*-ethyl-carbodiimide hydrochloride (EDC).

Scheme 3

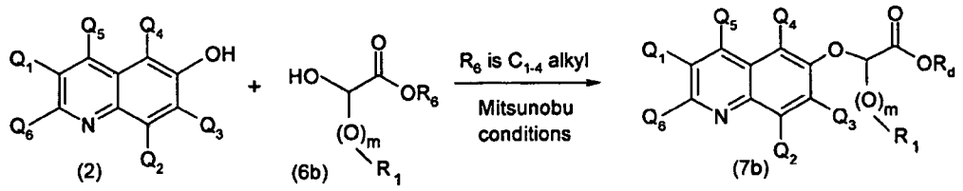


Compounds of the general formula (7a), wherein R_6 is H, may be prepared *via* the intermediacy of compounds of general formula (7b), wherein R_6 is C_{1-4} alkyl as shown in Scheme 3. The esters of the general formula (7b), wherein R_6 is C_{1-4} alkyl, may be prepared by reacting a compound of the general formula (2) with an ester of the general formula (6a) in the presence of a suitable base, such as potassium carbonate or sodium

hydride, in a suitable solvent, such as *N,N*-dimethylformamide. Alternatively, compounds of the general formula (7a) wherein R_6 is H, may be prepared directly by reacting a compound of the general formula (2) with an acid of the general formula (6a) wherein R_6 is H. The esters or acids of the general formulae, (6a) and (6b) respectively, are either commercially available or may be prepared by standard literature methods from commercially available materials.

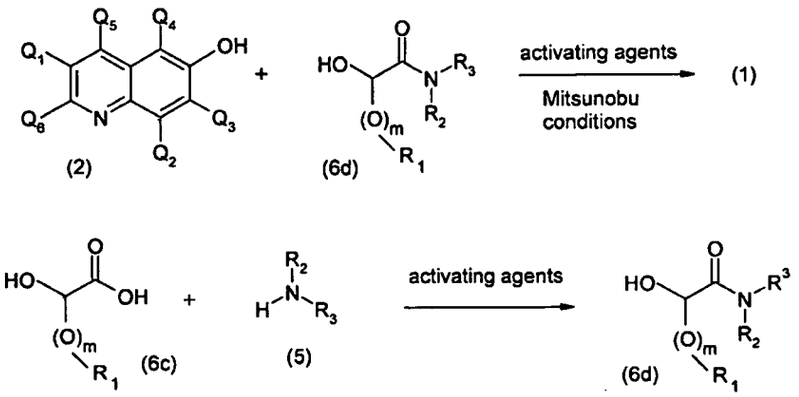
Alternatively, as shown in Scheme 4, compounds of the general formula (7b) may be prepared under Mitsunobu conditions by reacting a compound of the general formula (2) with a compound of the general formula (6b), wherein R_6 is C_{1-4} alkyl, using a phosphine, such as triphenyl phosphine, and an azoester, such as diethyl azodicarboxylate.

Scheme 4



In another approach towards the preparation of compounds of the general formula (1) shown in Scheme 5, compound of general formula (6d) may be reacted with a compound of the general formula (2) under Mitsunobu conditions using a phosphine, such as triphenyl phosphine, and an azoester, such as diethyl azodicarboxylate. Compounds of general formula (6d) may be prepared from a compound of general formula (6c) and an amine of general formula (5) using suitable activating reagents such as 1-hydroxybenzotriazole and *N*-(3-dimethylaminopropyl)-*N'*-ethyl-carbodiimide hydrochloride.

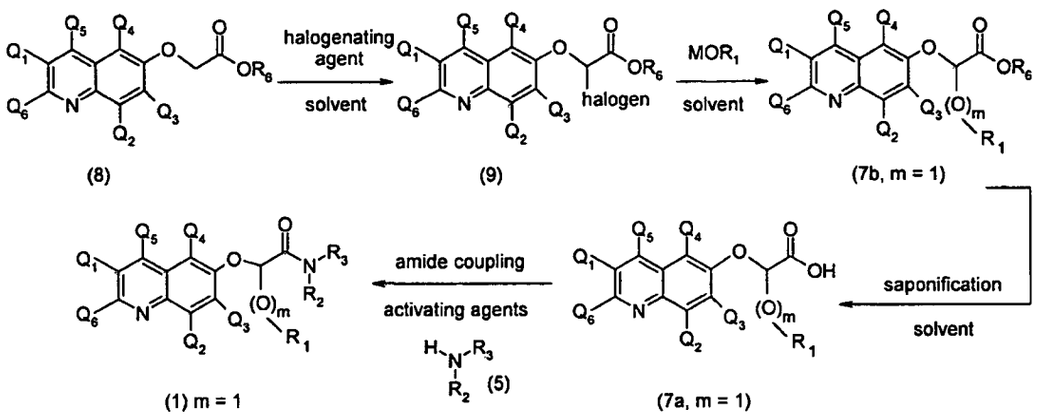
Scheme 5



Compounds of general formula (6c) are either known compounds or may be prepared from commercially available and/or known compounds according to methods known to those skilled in the art.

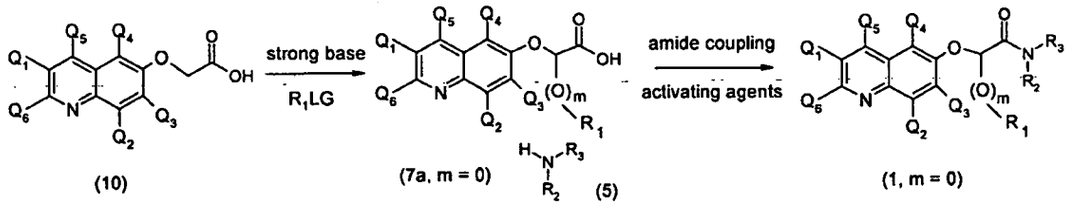
In addition, compounds of the general formula (1) wherein m is 1, may be prepared as shown in Scheme 6. Thus, esters of the formula (8) may be halogenated to give haloesters of the general formula (9), by treatment with a suitable halogenating agent, such as N-bromosuccinimide, in a suitable solvent such as carbon tetrachloride, at between ambient temperature and the reflux temperature of the solvent. The haloesters of the general formula (9) can be reacted with an alkali metal compound MOR, where M is a metal such as sodium or potassium in solvent such as methanol or ethanol, between 0°C and reflux, preferably at ambient temperature, to give compounds of the general formula (7b). The esters (7b) can be hydrolysed to acids of the general formula (7a), by treatment with an alkali metal hydroxide, such as sodium hydroxide, in aqueous alcohol, between ambient temperature and reflux. A carboxylic acid of the general formula (7a) can be condensed with an amine of the general formula (5) to give a compound of the general formula (1), where m is 1 and R_1 is as defined above, using suitable activating reagents such as 1-hydroxybenzotriazole and *N*-(3-dimethylaminopropyl)-*N'*-ethylcarbodiimide hydrochloride.

Scheme 6



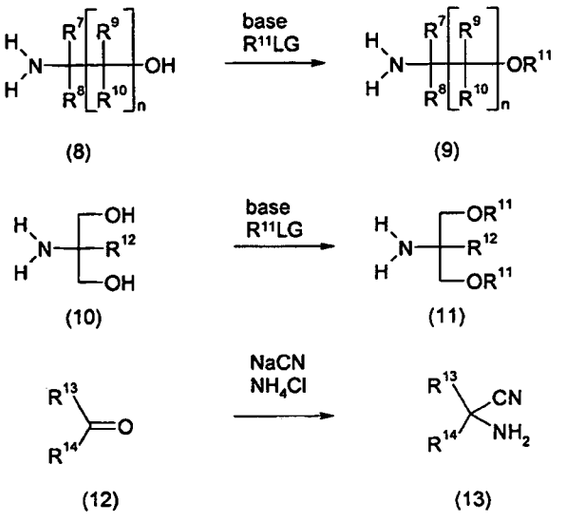
Compounds of the general formula (1), wherein m is 0, R_1 is C_{1-4} alkyl, C_{3-4} alkenyl, C_{3-4} alkynyl, or an alkoxyalkyl group, may be prepared as shown in Scheme 7. Thus, the substituted acetic acid derivative (10) may be treated with at least two equivalents of a base, such as lithium di*iso*propylamide, in a suitable solvent such as tetrahydrofuran, at a temperature between –78°C and ambient temperature, with an alkylating agent such as R_1L to give carboxylic acids of the general formula (7a) upon acidification.

Scheme 7



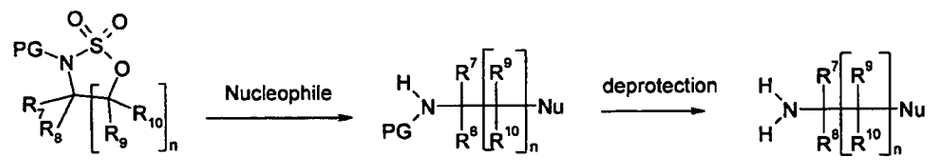
As shown in Scheme 8, amines of the general formula (9) or (11), which are examples of amines of the general formula (5) wherein R^2 is H, may be prepared by alkylation of an aminoalcohol of the general formula (8) or (10) using a suitable base, such as *n*-butyl lithium or sodium hydride, followed by reaction with a suitable alkylating reagent $R^{11}LG$, such as an alkyl iodide, for example, methyl iodide, to form an alkylated compound of the general formula (9) or (11), respectively. A carbonyl derivative $R^{13}COR^{14}$ (12), for example formaldehyde, can be reacted with ammonia, usually in form of ammonium chloride, and cyanide, conveniently in form of an aqueous solution sodium cyanide, to provide an α-cyanoamine (13) (Strecker synthesis).

Scheme 8



Alternatively, as shown in Scheme 9, amines of the general formula (16), which are examples of amines of the general formula (5) wherein R^2 is H, may be prepared by nucleophilic opening of cyclic sulphamidates of the general formula (14), where PG is a protecting group such as *tert*-butyl carbamate (BOC) or 4-methoxy benzyl (PMB), using a variety of nucleophiles, such as the tetra n-butyl ammonium fluoride (TBAF) and sodium cyanide followed by deprotection using standard conditions (such as HCl for removal of the BOC group or hydrogen and a palladium-based catalyst for the removal of the PMB group).

Scheme 9



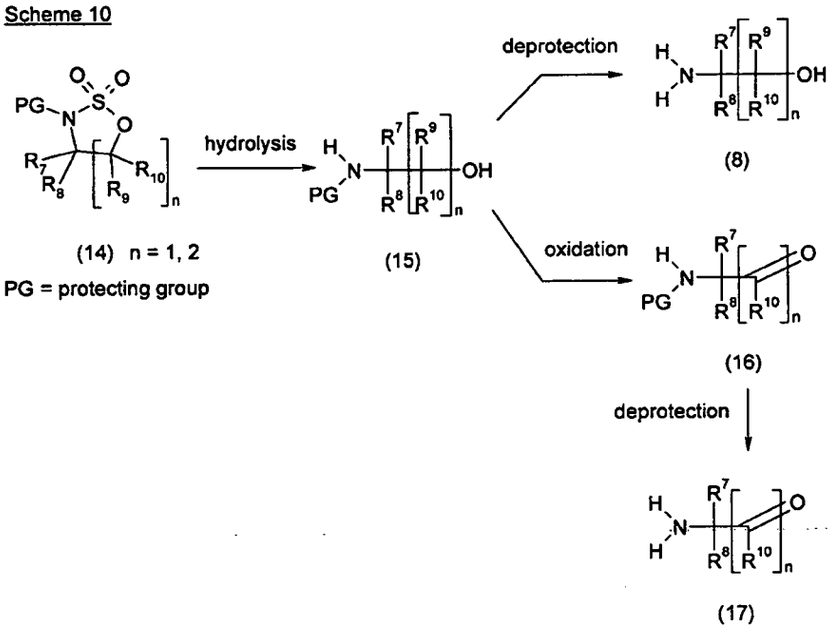
PG = protecting group

Compounds of the formula (14) may be prepared by methods known to those skilled in the art (for example as described in the *Journal of the American Chemical Society*, 2001, pages 6935-6936).

In addition, as shown in Scheme 10, hydrolysis of the cyclic sulphamidate (14) provides the N-protected amino alcohol (15) which can be further modified by methods known to those skilled in the art. For example, deprotection of compounds of the general formula (15) using standard conditions (such as HCl for removal of the BOC group or hydrogen and a palladium-based catalyst for the removal of the PMB group) provides amino

alocohols of the general formula (8) which are examples of amines of the general formula (5) wherein R^2 is H. Alternatively, when one of R^9 and R^{10} is hydrogen, oxidation of compounds of the formula (15) with oxidants such as hypervalent iodine reagents, for example Dess-Martin periodinane provides oxidised compounds of the formula (17) which are examples of amines of the general formula (5) wherein R^2 is H after deprotection of compounds of the formula (16) using standard conditions known to those skilled in the art.

Scheme 10



Other derivatives of the amines of the general formula (5) may be prepared by derivatisation of the compounds of the general formulae (15) and (16) using standard procedures known to those skilled in the art.

Other amines of the general formula (5) are either commercially available or may be prepared by standard literature methods or standard modifications known to those skilled in the art.

Thioamides (Compounds of the general formula (1) where L = S) may be prepared from the corresponding amides using thionating agents such as phosphorous pentasulphide, Lawesson's or Davy's reagents or prepared from the corresponding thionoacids or thionoesters using standard literature methods or standard modifications.

Quinolines are commercially available or may be prepared using methods known to those skilled in the art that are well described in standard textbooks of heterocyclic chemistry and in the literature. For example, two references describe the synthesis of 3 and/or 8 substituted quinolines: Journal of the American Chemical Society (1955), 77, 4175 and Journal of the American Chemical Society (1950), 72 393. Numerous

synthetic routes to the 6-hydroxy quinolines of the general formula (2) of the present invention can thus be devised by any person skilled in the art. Specific examples of such reactions are provided in Examples 1, 5 and 6 so as to allow one skilled in the art to make and use of quinolines of the invention. It is understood that these examples serve in no way to limit the true scope of this invention but rather are presented for illustrative purposes.

Other compounds of the invention may be prepared by transforming the substituents in the compounds of the general formula (1) using standard procedures known to those skilled in the art.

The compounds of formula (I) are active fungicides and may be used to control one or more of the following pathogens: *Pyricularia oryzae* (*Magnaporthe grisea*) on rice and wheat and other *Pyricularia* spp. on other hosts; *Puccinia triticina* (or *recondita*), *Puccinia striiformis* and other rusts on wheat, *Puccinia hordei*, *Puccinia striiformis* and other rusts on barley, and rusts on other hosts (for example turf, rye, coffee, pears, apples, peanuts, sugar beet, vegetables and ornamental plants); *Erysiphe cichoracearum* on cucurbits (for example melon); *Blumeria* (or *Erysiphe*) *graminis* (powdery mildew) on barley, wheat, rye and turf and other powdery mildews on various hosts, such as *Sphaerotheca macularis* on hops, *Sphaerotheca fusca (Sphaerotheca fuliginea)* on cucurbits (for example cucumber), *Leveillula taurica* on tomatoes, aubergine and green pepper, *Podosphaera leucotricha* on apples and *Uncinula necator* on vines; *Cochliobolus* spp., *Helminthosporium* spp., *Drechslera* spp. (*Pyrenophora* spp.), *Rhynchosporium* spp., *Mycosphaerella graminicola* (*Septoria tritici)* and *Phaeosphaeria nodorum* (*Stagonospora nodorum* or *Septoria nodorum*), *Pseudocercosporella herpotrichoides* and *Gaeumannomyces graminis* on cereals (for example wheat, barley, rye), turf and other hosts; *Cercospora arachidicola* and *Cercosporidium personatum* on peanuts and other *Cercospora* spp. on other hosts, for example sugar beet, bananas, soya beans and rice; *Botrytis cinerea* (grey mould) on tomatoes, strawberries, vegetables, vines and other hosts and other *Botrytis* spp. on other hosts; *Alternaria* spp. on vegetables (for example carrots), oil-seed rape, apples, tomatoes, potatoes, cereals (for example wheat) and other hosts; *Venturia* spp. (including *Venturia inaequalis* (scab)) on apples, pears, stone fruit, tree nuts and other hosts; *Cladosporium* spp. on a range of hosts including cereals (for example wheat) and tomatoes; *Monilinia* spp. on stone fruit, tree nuts and other hosts; *Didymella* spp. on tomatoes, turf, wheat, cucurbits and other hosts; *Phoma* spp. on oil-seed rape, turf, rice, potatoes, wheat and other hosts; *Aspergillus* spp. and *Aureobasidium* spp. on wheat,

lumber and other hosts; *Ascochyta* spp. on peas, wheat, barley and other hosts; *Stemphylium* spp. (*Pleospora* spp.) on apples, pears, onions and other hosts; summer diseases (for example bitter rot (*Glomerella cingulata*), black rot or frogeye leaf spot (*Botryosphaeria obtusa*), Brooks fruit spot (*Mycosphaerella pomi*), Cedar apple rust (*Gymnosporangium juniperi-virginianae*), sooty blotch (*Gloeodes pomigena*), flyspeck (*Schizothyrium pomi*) and white rot (*Botryosphaeria dothidea*)) on apples and pears; *Plasmopara viticola* on vines; other downy mildews, such as *Bremia lactucae* on lettuce, *Peronospora* spp. on soybeans, tobacco, onions and other hosts, *Pseudoperonospora humuli* on hops and *Pseudoperonospora cubensis* on cucurbits; *Pythium* spp. (including *Pythium ultimum*) on turf and other hosts; *Phytophthora infestans* on potatoes and tomatoes and other *Phytophthora* spp. on vegetables, strawberries, avocado, pepper, ornamentals, tobacco, cocoa and other hosts; *Thanatephorus cucumeris* on rice and turf and other *Rhizoctonia* spp. on various hosts such as wheat and barley, peanuts, vegetables, cotton and turf; *Sclerotinia* spp. on turf, peanuts, potatoes, oil-seed rape and other hosts; *Sclerotium* spp. on turf, peanuts and other hosts; *Gibberella fujikuroi* on rice; *Colletotrichum* spp. on a range of hosts including turf, coffee and vegetables; *Laetisaria fuciformis* on turf; *Mycosphaerella* spp. on bananas, peanuts, citrus, pecans, papaya and other hosts; *Diaporthe* spp. on citrus, soybean, melon, pears, lupin and other hosts; *Elsinoe* spp. on citrus, vines, olives, pecans, roses and other hosts; *Verticillium* spp. on a range of hosts including hops, potatoes and tomatoes; *Pyrenopeziza* spp. on oil-seed rape and other hosts; *Oncobasidium theobromae* on cocoa causing vascular streak dieback; *Fusarium* spp., *Typhula* spp., *Microdochium nivale*, *Ustilago* spp., *Urocystis* spp., *Tilletia* spp. and *Claviceps purpurea* on a variety of hosts but particularly wheat, barley, turf and maize; *Ramularia* spp. on sugar beet, barley and other hosts; post-harvest diseases particularly of fruit (for example *Penicillium digitatum*, *Penicillium italicum* and *Trichoderma viride* on oranges, *Colletotrichum musae* and *Gloeosporium musarum* on bananas and *Botrytis cinerea* on grapes); other pathogens on vines, notably *Eutypa lata*, *Guignardia bidwellii*, *Phellinus igniarus*, *Phomopsis viticola*, *Pseudopeziza tracheiphila* and *Stereum hirsutum*; other pathogens on trees (for example *Lophodermium seditiosum*) or lumber, notably *Cephaloascus fragrans*, *Ceratocystis* spp., *Ophiostoma piceae*, *Penicillium* spp., *Trichoderma pseudokoningii*, *Trichoderma viride*, *Trichoderma harzianum*, *Aspergillus niger*, *Leptographium lindbergi* and *Aureobasidium pullulans*; and fungal vectors of viral diseases (for example *Polymyxa graminis* on cereals as the vector of barley yellow mosaic virus (BYMV) and *Polymyxa betae* on sugar beet as the vector of rhizomania).

A compound of formula (I) may move acropetally, basipetally or locally in plant tissue to be active against one or more fungi. Moreover, a compound of formula (I) may be volatile enough to be active in the vapour phase against one or more fungi on the plant.

The invention therefore provides a method of combating or controlling phytopathogenic fungi which comprises applying a fungicidally effective amount of a compound of formula (I), or a composition containing a compound of formula (I), to a plant, to a seed of a plant, to the locus of the plant or seed or to soil or any other plant growth medium, e.g. nutrient solution.

The term "plant" as used herein includes seedlings, crops of useful plants, bushes and trees. Furthermore, the fungicidal method of the invention includes protectant, curative, systemic, eradicant and antisporulant treatments.

Crops of useful plants in which the compositions according to the invention can be used include especially cereals, maize, rice, rape, sugar beet, sugar cane, plantations, cotton, soybeans, vegetables and flowers. The term "crops" is to be understood as also including crops that have been rendered tolerant to herbicides or classes of herbicides (for example ALS, GS, EPSPS, PPO and HPPD inhibitors) as a result of conventional methods of breeding or genetic engineering. An example of a crop that has been rendered tolerant e.g. to imidazolinones, such as imazamox, by conventional methods of breeding is Clearfield® summer rape (Canola). Examples of crops that have been rendered tolerant to herbicides by genetic engineering methods include e.g. glyphosate- and glufosinate-resistant maize varieties commercially available under the trade names RoundupReady® and LibertyLink®. The weeds to be controlled may be both monocotyledonous and dicotyledonous weeds, such as, for example, Stellaria, Nasturtium, Agrostis, Digitaria, Avena, Setaria, Sinapis, Lolium, Solanum, Echinochloa, Scirpus, Monochoria, Sagittaria, Bromus, Alopecurus, Sorghum, Rottboellia, Cyperus, Abutilon, Sida, Xanthium, Amaranthus, Chenopodium, Ipomoea, Chrysanthemum, Galium, Viola and Veronica.

Crops are also to be understood as being those which have been rendered resistant to harmful insects by genetic engineering methods, for example Bt maize (resistant to European corn borer), Bt cotton (resistant to cotton boll weevil) and also Bt potatoes (resistant to Colorado beetle). Examples of Bt maize are the Bt-176 maize hybrids of NK® (Syngenta Seeds). The Bt toxin is a protein that is formed naturally by *Bacillus thuringiensis* soil bacteria. Examples of toxins and transgenic plants able to synthesise

such toxins are described in EP-A-451 878, EP-A-374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, WO 03/052073 and EP-A-427 529. Examples of transgenic plants that contain one or more genes which code for an insecticidal resistance and express one or more toxins are KnockOut® (maize), Yield Gard® (maize), NuCOTIN33B® (cotton), Bollgard® (cotton), NewLeaf® (potatoes), NatureGard® and Protexcta®. Plant crops and their seed material can be resistant to herbicides and at the same time also to insect feeding ("stacked" transgenic events). Seed can, for example, have the ability to express an insecticidally active Cry3 protein and at the same time be glyphosate-tolerant. The term "crops" is to be understood as also including crops obtained as a result of conventional methods of breeding or genetic engineering which contain so-called output traits (e.g. improved flavour, storage stability, nutritional content).

Areas under cultivation are to be understood as including land where the crop plants are already growing as well as land intended for the cultivation of those crop plants.

The compounds of formula (I) are preferably used for agricultural, horticultural and turfgrass purposes in the form of a composition.

In order to apply a compound of formula (I) to a plant, to a seed of a plant, to the locus of the plant or seed or to soil or any other growth medium, a compound of formula (I) is usually formulated into a composition which includes, in addition to the compound of formula (I), a suitable inert diluent or carrier and, optionally, a surface active agent (SFA). SFAs are chemicals that are able to modify the properties of an interface (for example, liquid/solid, liquid/air or liquid/liquid interfaces) by lowering the interfacial tension and thereby leading to changes in other properties (for example dispersion, emulsification and wetting). It is preferred that all compositions (both solid and liquid formulations) comprise, by weight, 0.0001 to 95%, more preferably 1 to 85%, for example 5 to 60%, of a compound of formula (I). The composition is generally used for the control of fungi such that a compound of formula (I) is applied at a rate of from 0.1g to 10kg per hectare, preferably from 1g to 6kg per hectare, more preferably from 1g to 1kg per hectare.

When used in a seed dressing, a compound of formula (I) is used at a rate of 0.0001g to 10g (for example 0.001g or 0.05g), preferably 0.005g to 10g, more preferably 0.005g to 4g, per kilogram of seed.

In another aspect the present invention provides a fungicidal composition comprising a fungicidally effective amount of a compound of formula (I) and a suitable carrier or diluent therefor.

In a still further aspect the invention provides a method of combating and controlling fungi at a locus, which comprises treating the fungi, or the locus of the fungi with a fungicidally effective amount of a composition comprising a compound of formula (I). The compositions can be chosen from a number of formulation types, including dustable powders (DP), soluble powders (SP), water soluble granules (SG), water dispersible granules (WG), wettable powders (WP), granules (GR) (slow or fast release), soluble concentrates (SL), oil miscible liquids (OL), ultra low volume liquids (UL), emulsifiable concentrates (EC), dispersible concentrates (DC), emulsions (both oil in water (EW) and water in oil (EO)), micro-emulsions (ME), suspension concentrates (SC), aerosols, fogging/smoke formulations, capsule suspensions (CS) and seed treatment formulations. The formulation type chosen in any instance will depend upon the particular purpose envisaged and the physical, chemical and biological properties of the compound of formula (I).

Dustable powders (DP) may be prepared by mixing a compound of formula (I) with one or more solid diluents (for example natural clays, kaolin, pyrophyllite, bentonite, alumina, montmorillonite, kieselguhr, chalk, diatomaceous earths, calcium phosphates, calcium and magnesium carbonates, sulphur, lime, flours, talc and other organic and inorganic solid carriers) and mechanically grinding the mixture to a fine powder.

Soluble powders (SP) may be prepared by mixing a compound of formula (I) with one or more water-soluble inorganic salts (such as sodium bicarbonate, sodium carbonate or magnesium sulphate) or one or more water-soluble organic solids (such as a polysaccharide) and, optionally, one or more wetting agents, one or more dispersing agents or a mixture of said agents to improve water dispersibility/solubility. The mixture is then ground to a fine powder. Similar compositions may also be granulated to form water soluble granules (SG).

Wettable powders (WP) may be prepared by mixing a compound of formula (I) with one or more solid diluents or carriers, one or more wetting agents and, preferably, one or more dispersing agents and, optionally, one or more suspending agents to facilitate the dispersion in liquids. The mixture is then ground to a fine powder. Similar compositions may also be granulated to form water dispersible granules (WG).

Granules (GR) may be formed either by granulating a mixture of a compound of formula (I) and one or more powdered solid diluents or carriers, or from pre-formed blank granules by absorbing a compound of formula (I) (or a solution thereof, in a suitable agent) in a porous granular material (such as pumice, attapulgite clays, fuller's earth, kieselguhr, diatomaceous earths or ground corn cobs) or by adsorbing a compound of formula (I) (or a solution thereof, in a suitable agent) on to a hard core material (such as sands, silicates, mineral carbonates, sulphates or phosphates) and drying if necessary. Agents which are commonly used to aid absorption or adsorption include solvents (such as aliphatic and aromatic petroleum solvents, alcohols, ethers, ketones and esters) and sticking agents (such as polyvinyl acetates, polyvinyl alcohols, dextrins, sugars and vegetable oils). One or more other additives may also be included in granules (for example an emulsifying agent, wetting agent or dispersing agent).

Dispersible Concentrates (DC) may be prepared by dissolving a compound of formula (I) in water or an organic solvent, such as a ketone, alcohol or glycol ether. These solutions may contain a surface active agent (for example to improve water dilution or prevent crystallisation in a spray tank).

Emulsifiable concentrates (EC) or oil-in-water emulsions (EW) may be prepared by dissolving a compound of formula (I) in an organic solvent (optionally containing one or more wetting agents, one or more emulsifying agents or a mixture of said agents). Suitable organic solvents for use in ECs include aromatic hydrocarbons (such as alkylbenzenes or alkylnaphthalenes, exemplified by SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 and SOLVESSO 200; SOLVESSO is a Registered Trade Mark), ketones (such as cyclohexanone or methylcyclohexanone), alcohols (such as benzyl alcohol, furfuryl alcohol or butanol), *N*-alkylpyrrolidones (such as *N*-methylpyrrolidone or *N*-octyl-pyrrolidone), dimethyl amides of fatty acids (such as C_8-C_{10} fatty acid dimethylamide) and chlorinated hydrocarbons. An EC product may spontaneously emulsify on addition to water, to produce an emulsion with sufficient stability to allow spray application through appropriate equipment. Preparation of an EW involves obtaining a compound of formula (I) either as a liquid (if it is not a liquid at ambient temperature, it may be melted at a reasonable temperature, typically below 70°C) or in solution (by dissolving it in an appropriate solvent) and then emulsifying the resultant liquid or solution into water containing one or more SFAs, under high shear, to produce an emulsion. Suitable solvents for use in EWs include vegetable oils, chlorinated hydrocarbons (such as

chlorobenzenes), aromatic solvents (such as alkylbenzenes or alkylnaphthalenes) and other appropriate organic solvents that have a low solubility in water.

Microemulsions (ME) may be prepared by mixing water with a blend of one or more solvents with one or more SFAs, to produce spontaneously a thermodynamically stable isotropic liquid formulation. A compound of formula (I) is present initially in either the water or the solvent/SFA blend. Suitable solvents for use in MEs include those hereinbefore described for use in ECs or in EWs. An ME may be either an oil-in-water or a water-in-oil system (which system is present may be determined by conductivity measurements) and may be suitable for mixing water-soluble and oil-soluble pesticides in the same formulation. An ME is suitable for dilution into water, either remaining as a microemulsion or forming a conventional oil-in-water emulsion.

Suspension concentrates (SC) may comprise aqueous or non-aqueous suspensions of finely divided insoluble solid particles of a compound of formula (I). SCs may be prepared by ball or bead milling the solid compound of formula (I) in a suitable medium, optionally with one or more dispersing agents, to produce a fine particle suspension of the compound. One or more wetting agents may be included in the composition and a suspending agent may be included to reduce the rate at which the particles settle. Alternatively, a compound of formula (I) may be dry milled and added to water, containing agents hereinbefore described, to produce the desired end product.

Aerosol formulations comprise a compound of formula (I) and a suitable propellant (for example *n*-butane). A compound of formula (I) may also be dissolved or dispersed in a suitable medium (for example water or a water miscible liquid, such as *n*-propanol) to provide compositions for use in non-pressurised, hand-actuated spray pumps.

A compound of formula (I) may be mixed in the dry state with a pyrotechnic mixture to form a composition suitable for generating, in an enclosed space, a smoke containing the compound.

Capsule suspensions (CS) may be prepared in a manner similar to the preparation of EW formulations but with an additional polymerisation stage such that an aqueous dispersion of oil droplets is obtained, in which each oil droplet is encapsulated by a polymeric shell and contains a compound of formula (I) and, optionally, a carrier or diluent therefor. The polymeric shell may be produced by either an interfacial polycondensation reaction or by a coacervation procedure. The compositions may

provide for controlled release of the compound of formula (I) and they may be used for seed treatment. A compound of formula (I) may also be formulated in a biodegradable polymeric matrix to provide a slow, controlled release of the compound.

A composition may include one or more additives to improve the biological performance of the composition (for example by improving wetting, retention or distribution on surfaces; resistance to rain on treated surfaces; or uptake or mobility of a compound of formula (I)). Such additives include surface active agents, spray additives based on oils, for example certain mineral oils or natural plant oils (such as soy bean and rape seed oil), and blends of these with other bio-enhancing adjuvants (ingredients which may aid or modify the action of a compound of formula (I)).

A compound of formula (I) may also be formulated for use as a seed treatment, for example as a powder composition, including a powder for dry seed treatment (DS), a water soluble powder (SS) or a water dispersible powder for slurry treatment (WS), or as a liquid composition, including a flowable concentrate (FS), a solution (LS) or a capsule suspension (CS). The preparations of DS, SS, WS, FS and LS compositions are very similar to those of, respectively, DP, SP, WP, SC and DC compositions described above. Compositions for treating seed may include an agent for assisting the adhesion of the composition to the seed (for example a mineral oil or a film-forming barrier). Wetting agents, dispersing agents and emulsifying agents may be SFAs of the cationic, anionic, amphoteric or non-ionic type.

Suitable SFAs of the cationic type include quaternary ammonium compounds (for example cetyltrimethyl ammonium bromide), imidazolines and amine salts.
Suitable anionic SFAs include alkali metals salts of fatty acids, salts of aliphatic monoesters of sulphuric acid (for example sodium lauryl sulphate), salts of sulphonated aromatic compounds (for example sodium dodecylbenzenesulphonate, calcium dodecylbenzenesulphonate, butylnaphthalene sulphonate and mixtures of sodium di-*iso*propyl- and tri-*iso*propyl-naphthalene sulphonates), ether sulphates, alcohol ether sulphates (for example sodium laureth-3-sulphate), ether carboxylates (for example sodium laureth-3-carboxylate), phosphate esters (products from the reaction between one or more fatty alcohols and phosphoric acid (predominately mono-esters) or phosphorus pentoxide (predominately di-esters), for example the reaction between lauryl alcohol and tetraphosphoric acid; additionally these products may be ethoxylated), sulphosuccinamates, paraffin or olefin sulphonates, taurates and lignosulphonates.
Suitable SFAs of the amphoteric type include betaines, propionates and glycinates.

Suitable SFAs of the non-ionic type include condensation products of alkylene oxides, such as ethylene oxide, propylene oxide, butylene oxide or mixtures thereof, with fatty alcohols (such as oleyl alcohol or cetyl alcohol) or with alkylphenols (such as octylphenol, nonylphenol or octylcresol); partial esters derived from long chain fatty acids or hexitol anhydrides; condensation products of said partial esters with ethylene oxide; block polymers (comprising ethylene oxide and propylene oxide); alkanolamides; simple esters (for example fatty acid polyethylene glycol esters); amine oxides (for example lauryl dimethyl amine oxide); and lecithins.

Suitable suspending agents include hydrophilic colloids (such as polysaccharides, polyvinylpyrrolidone or sodium carboxymethylcellulose) and swelling clays (such as bentonite or attapulgite).

A compound of formula (I) may be applied by any of the known means of applying fungicidal compounds. For example, it may be applied, formulated or unformulated, to any part of the plant, including the foliage, stems, branches or roots, to the seed before it is planted or to other media in which plants are growing or are to be planted (such as soil surrounding the roots, the soil generally, paddy water or hydroponic culture systems), directly or it may be sprayed on, dusted on, applied by dipping, applied as a cream or paste formulation, applied as a vapour or applied through distribution or incorporation of a composition (such as a granular composition or a composition packed in a water-soluble bag) in soil or an aqueous environment.

A compound of formula (I) may also be injected into plants or sprayed onto vegetation using electrodynamic spraying techniques or other low volume methods, or applied by land or aerial irrigation systems.

Compositions for use as aqueous preparations (aqueous solutions or dispersions) are generally supplied in the form of a concentrate containing a high proportion of the active ingredient, the concentrate being added to water before use. These concentrates, which may include DCs, SCs, ECs, EWs, MEs, SGs, SPs, WPs, WGs and CSs, are often required to withstand storage for prolonged periods and, after such storage, to be capable of addition to water to form aqueous preparations which remain homogeneous for a sufficient time to enable them to be applied by conventional spray equipment. Such aqueous preparations may contain varying amounts of a compound of formula (I) (for example 0.0001 to 10%, by weight) depending upon the purpose for which they are to be used.

A compound of formula (I) may be used in mixtures with fertilisers (for example nitrogen-, potassium- or phosphorus-containing fertilisers). Suitable formulation types include granules of fertiliser. The mixtures suitably contain up to 25% by weight of the compound of formula (I).

The invention therefore also provides a fertiliser composition comprising a fertiliser and a compound of formula (I).

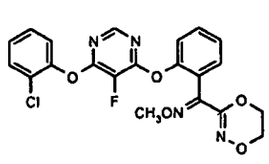
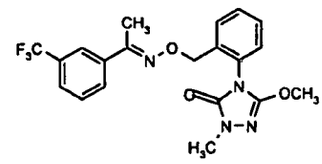
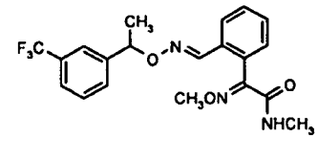
The compositions of this invention may contain other compounds having biological activity, for example micronutrients or compounds having similar or complementary fungicidal activity or which possess plant growth regulating, herbicidal, insecticidal, nematicidal or acaricidal activity.

By including another fungicide, the resulting composition may have a broader spectrum of activity or a greater level of intrinsic activity than the compound of formula (I) alone. Further the other fungicide may have a synergistic effect on the fungicidal activity of the compound of formula (I).

The compound of formula (I) may be the sole active ingredient of the composition or it may be admixed with one or more additional active ingredients such as a pesticide, fungicide, synergist, herbicide or plant growth regulator where appropriate. An additional active ingredient may: provide a composition having a broader spectrum of activity or increased persistence at a locus; synergise the activity or complement the activity (for example by increasing the speed of effect or overcoming repellency) of the compound of formula (I); or help to overcome or prevent the development of resistance to individual components. The particular additional active ingredient will depend upon the intended utility of the composition.

Examples of fungicidal compounds which may be included in the composition of the invention are AC 382042 (*N*-(1-cyano-1,2-dimethylpropyl)-2-(2,4-dichlorophenoxy) propionamide), acibenzolar-S-methyl, alanycarb, aldimorph, anilazine, azaconazole, azafenidin, azoxystrobin, benalaxyl, benomyl, benthiavalicarb, biloxazol, bitertanol, blasticidin S, boscalid (new name for nicobifen), bromuconazole, bupirimate, captafol, captan, carbendazim, carbendazim chlorhydrate, carboxin, carpropamid, carvone, CGA 41396, CGA 41397, chinomethionate, chlorbenzthiazone, chlorothalonil, chlorozolinate, clozylacon, copper containing compounds such as copper oxychloride, copper

oxyquinolate, copper sulphate, copper tallate, and Bordeaux mixture, cyamidazosulfamid, cyazofamid (IKF-916), cyflufenamid, cymoxanil, cyproconazole, cyprodinil, debacarb, di-2-pyridyl disulphide 1,1'-dioxide, dichlofluanid, diclocymet, diclomezine, dicloran, diethofencarb, difenoconazole, difenzoquat, diflumetorim, *O,O*-di-*iso*-propyl-*S*-benzyl thiophosphate, dimefluazole, dimetconazole, dimethirimol, dimethomorph, dimoxystrobin, diniconazole, dinocap, dithianon, dodecyl dimethyl ammonium chloride, dodemorph, dodine, doguadine, edifenphos, epoxiconazole, ethaboxam, ethirimol, ethyl (*Z*)-*N*-benzyl-*N*([methyl(methyl-thioethylideneaminooxy-carbonyl)amino]thio)-β-alaninate, etridiazole, famoxadone, fenamidone, fenarimol, fenbuconazole, fenfuram, fenhexamid, fenoxanil (AC 382042), fenpiclonil, fenpropidin, fenpropimorph, fentin acetate, fentin hydroxide, ferbam, ferimzone, fluazinam, fludioxonil, flumetover, flumorph, fluoroimide, fluoxastrobin, fluquinconazole, flusilazole, flusulfamide, flutolanil, flutriafol, folpet, fosetyl-aluminium, fuberidazole, furalaxyl, furametpyr, guazatine, hexaconazole, hydroxyisoxazole, hymexazole, imazalil, imibenconazole, iminoctadine, iminoctadine triacetate, ipconazole, iprobenfos, iprodione, iprovalicarb, isopropanyl butyl carbamate, isoprothiolane, kasugamycin, kresoxim-methyl, LY186054, LY211795, LY 248908, mancozeb, maneb, mefenoxam, mepanipyrim, mepronil, metalaxyl, metalaxyl M, metconazole, metiram, metiram-zinc, metominostrobin, metrafenone, MON65500 (*N*-allyl-4,5-dimethyl-2-trimethylsilylthiophene-3-carboxamide), myclobutanil, NTN0301, neoasozin, nickel dimethyldithiocarbamate, nitrothale-isopropyl, nuarimol, ofurace, organomercury compounds, orysastrobin, oxadixyl, oxasulfuron, oxolinic acid, oxpoconazole, oxycarboxin, pefurazoate, penconazole, pencycuron, phenazin oxide, phosphorus acids, phthalide, picoxystrobin, polyoxin D, polyram, probenazole, prochloraz, procymidone, propamocarb, propamocarb hydrochloride, propiconazole, propineb, propionic acid, proquinazid, prothioconazole, pyraclostrobin, pyrazophos, pyrifenox, pyrimethanil, pyroquilon, pyroxyfur, pyrrolnitrin, quaternary ammonium compounds, quinomethionate, quinoxyfen, quintozene, silthiofam (MON 65500), S-imazalil, simeconazole, sipconazole, sodium pentachlorophenate, spiroxamine, streptomycin, sulphur, tebuconazole, tecloftalam, tecnazene, tetraconazole, thiabendazole, thifluzamide, 2-(thiocyano-methylthio)benzothiazole, thiophanate-methyl, thiram, tiadinil, timibenconazole, tolclofos-methyl, tolylfluanid, triadimefon, triadimenol, triazbutil, triazoxide, tricyclazole, tridemorph, trifloxystrobin, triflumizole, triforine, triticonazole, validamycin A, vapam, vinclozolin, XRD-563, zineb, ziram, zoxamide and the compounds of the formulae:

and

The compounds of formula (I) may be mixed with soil, peat or other rooting media for the protection of plants against seed-borne, soil-borne or foliar fungal diseases.

Some mixtures may comprise active ingredients, which have significantly different physical, chemical or biological properties such that they do not easily lend themselves to the same conventional formulation type. In these circumstances other formulation types may be prepared. For example, where one active ingredient is a water insoluble solid and the other a water insoluble liquid, it may nevertheless be possible to disperse each active ingredient in the same continuous aqueous phase by dispersing the solid active ingredient as a suspension (using a preparation analogous to that of an SC) but dispersing the liquid active ingredient as an emulsion (using a preparation analogous to that of an EW). The resultant composition is a suspoemulsion (SE) formulation.

The invention is illustrated by the following examples in which the following abbreviations are used:

ml = millilitres
g = grammes
ppm = parts per million
M^+ = mass ion
s = singlet
d = doublet
br s = broad singlet
t = triplet
DMSO = dimethylsulphoxide
NMR = nuclear magnetic resonance
HPLC = high performance liquid chromatography
q = quartet
m = multiplet

Example 1

This example illustrates the preparation of 2-(3-bromo-quinolin-6-yloxy)-N-*tert*-butyl-butyramide (Compound No. 12 of Table 154) according to Scheme 3 wherein m = 0.

Step 1: Preparation of 2-(3-Bromo-quinolin-6-yloxy)-butyric acid ethyl ester

3-Bromo-quinolin-6-ol (11.3 g) (preparation described in Liebigs Ann Chem 1966, 98-106) was dissolved in dry DMF (100 ml). 2-Bromo-butyric acid ethyl ester (11.05 g) and dry potassium carbonate (20.9 g) were added to the mixture at R.T. The resulting suspension was stirred at 70°c for 1 hour. The reaction mixture was poured into brine.

After removal of the precipitate and separation of the two phases, the aqueous layer was extracted twice with ethyl acetate (2x100ml). The organic layers were combined, washed with brine, dried over magnesium sulphate, filtered and evaporated to give 2-(3-bromo-quinolin-6-yloxy)-butyric acid ethyl ester as a oil (17.8) which was used in the next step without further purification.

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 8.78 (1H,d); 8.15 (1H,d); 7.98 (1H,d); 7.42 (1H,dxd); 6.90 (1H,d); 4.70 (1H,t); 4.25 (2H,q); 2.08 (2H,m); 1.25 (3H,t); 1.13 (3H,t).

Step 2: Preparation of 2-(3-Bromo-quinolin-6-yloxy)-butyric acid

To a suspension of 2-(3-Bromo-quinolin-6-yloxy)-butyric acid ethyl ester (17.8 g) in a mixture (500 ml) of tetrahydrofurane/water (1/1) at zero °C is added lithium hydroxide monohydrate (2.31g). The reaction mixture is allowed to warm up to ambient temperature and is stirred overnight. Ethyl acetate was added and the two phases were separated. The aqueous phase was acidified with dilute aqueous hydrochloric acid then extracted twice with ethyl acetate. The organic phases were combined, dried over magnesium sulphate, filtered and evaporated to give 2-(3-bromo-quinolin-6-yloxy)-butyric acid as a brown powder (13.1) which was used in the next step without further purification.

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 8.70 (1H,d); 8.13 (1H,d); 7.92 (1H,d); 7.35 (1H,dxd); 6.90 (1H,d); 4.70 (1H,t); 3.3-2.5 (1H, br); 2.05 (2H,m); 1.10 (3H,t).

Step 3: Preparation of 2-(3-Bromo-quinolin-6-yloxy)-N-tert-butyl-butyramide

2-(3-Bromo-quinolin-6-yloxy)-butyric acid (0.209 g), N-*tert*-butyl amine (0.074 ml), 1-hydroxy-7-azabenzotriazole (HOAT) (0.097g), *N*-(3-dimethylaminopropyl)-N'-ethylcarbodiimide hydrochloride (EDC) (0.137g) and triethylamine (0.098 ml) in dry N,N-dimethylformamide (7 ml) were stirred at ambient temperature for 3.5 hours. The reaction mixture was quenched with water and poured onto a Chromabond-XTR cartridge followed by elution with ethyl acetate (130 ml). The crude mixture was purified by reverse phase HPLC (acetonitrile-water) to give 2-(3-bromo-quinolin-6-yloxy)-N-tert-butyl-butyramide as an oil (0.16g).

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 8.70 (1H,d); 8.12 (1H,d); 7.92 (1H,d); 7.32 (1H,dxd); 6.92 (1H,d); 6.05 (1H, br s); 4.43 (1H,m); 1.92 (2H, m); 1.20 (9H, s); 0.98 (3H,t).

The following amides were prepared using a similar procedure.

Compound No. 47 of Table 154: 2-(3-Bromo-quinolin-6-yloxy)-N-(2-methoxy-1,1-dimethyl-ethyl)-butyramide using 2-methoxy-1,1-dimethyl-ethylamine.

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 8.75 (1H,d); 8.15 (1H,d); 7.96 (1H,d); 7.38 (1H,dxd); 7.0 (1H,d); 6.42 (1H, br s); 4.50 (1H,m); 3.25 (2H,m); 3.23(3H,s); 2.02 (2H,m); 1.31 (3H,s); 1.24 (3H,s); 1.05 (3H,t).

Compound No. 52 of Table 154: 2-(3-Bromo-quinolin-6-yloxy)-N-(1-cyano-2-methoxy-1-methyl-ethyl)-butyramide using 2-amino-3-methoxy-2-methyl-propionitrile:
^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: diastereoisomeric mixture (9/1); major diastereoisomer: 8.72 (1H,d); 8.18 (1H,dxm); 7.95 (1H,d); 7.35 (1H,dxd); 6.98 (1H,m); 6.88 (1H,m br); 4.65 (1H,m); 3.6 (2H, m); 3.25 (3H,s); 2.05 (2H,m); 1.70 (3H,s); 1.05 (3H,t).

2-(3-Bromo-quinolin-6-yloxy)-N-tert-butyl-3-methyl-butyramide using 2-(3-bromo-quinolin-6-yloxy)-3-methyl-butyric acid and N-*tert*-butylamine. M.p.(°C): 123-125; ^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 8.78 (1H,d); 8.18 (1H,d); 8.01 (1H,d); 7.41 (1H,dxd); 7.02 (1H,d); 5.59 (1H, br s); 4.32 (1H,d); 2.3 (1H,m); 1.30 (9H,s); 1.09 (6H,m).

2-(3-Bromo-quinolin-6-yloxy)-N-(1-cyano-2-methoxy-1-methyl-ethyl)-3-methyl-butyramide using 2-(3-bromo-quinolin-6-yloxy)-3-methyl-butyric acid and 2-cyano-1-methoxy-prop-2-ylamine. M.p.(°C): 151-157; ^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: diastereoisomeric mixture (1/1); 8.80 (1H,d); 8.20 (1H,d); 8.02 (1H,d); 7.41 (1H,dxd); 7.02 (1H,m); 6.67 (1H, br m); 4.48 (1H, m); 3.68-3.45 (2H,m+s); 3.41 and 3.21 (3H,2xs); 2.36 (1H,m); 1.70 and 1.61 (3H, 2xs); 1.10 (6H, m).

2-(3-Bromo-quinolin-6-yloxy)-N-*tert*-butyl-2-cyclopropyl-acetamide using (3-bromo-quinolin-6-yloxy)-cyclopropyl acetic acid and N-*tert*-butylamine. M.p.(°C): 165-167; ^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 8.78 (1H,d); 8.18 (1H,d); 8.00 (1H,d); 7.39 (1H,dxd); 6.98 (1H,d); 5.99 (1H, br s); 4.15 (1H,d); 1.3 (1H,m); 1.29 (9H,s); 0.75-0.50 (4H,2xm).

2-(3-Bromo-quinolin-6-yloxy)-2-cyclopropyl-N-(2-methoxy-1,1-dimethyl-ethyl)-acetamide using (3-bromo-quinolin-6-yloxy)-cyclopropyl acetic acid and 2-methoxy-1,1-dimethyl-ethylamine. M.p.(°C): 139-141; ^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 8.77 (1H,d); 8.18 (1H,d); 7.99 (1H,d); 7.40 (1H,dxd); 6.98 (1H,d); 6.33 (1H, br s); 4.15 (1H,d); 3.33-3.18 (2H,m); 3.22 (3H,s); 1.35 (1H,m); 1.31 (3H,s); 1.24 (3H,s); 0.75-0.47 (4H,2xm).

2-(3-Bromo-quinolin-6-yloxy)-N-(1-cyano-2-methoxy-1-methyl-ethyl)-2-cyclopropyl-acetamide using (3-Bromo-quinolin-6-yloxy)-cyclopropyl acetic acid and 2-cyano-1-methoxy-prop-2-ylamine. M.p.(°C): 119-121; ^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: diastereoisomeric mixture (1/1); 8.79 (1H,d); 8.20 (1H,m); 8.01 (1H,d); 7.40 (1H,dxd); 6.98 (1H,m); 6.74

and 6.68 (1H, 2xbr s); 4.29 (1H, m); 3.70-3.48 (2H,m+s); 3.42 and 3.23 (3H,2xs); 1.72 and 1.62 (3H, 2xs); 1.38 (1H,m); 0.80-0.50 (4H,2xm).

Example 2

This Example illustrates the preparation of 2-(3-bromo-quinolin-6-yloxy)-N-tert -butyl-2-methoxy-acetamide (Compound No.12 of Table 155) according to Scheme 6 wherein m = 1.

Step1: Preparation of (3-Bromo-quinolin-6-yloxy) acetic acid methyl ester

3-Bromo-quinolin-6-ol (10.0g) was dissolved in dry DMF (100 ml). Bromo-acetic acid methyl ester (7.51 g) and dry potassium carbonate (18.5 g) were added to the mixture at R.T. The resulting suspension was stirred at 80°c for 2 hours. The reaction mixture was poured onto brine and the resulting mixture was extracted twice with ethyl acetate (2x100 ml). The organic layers were combined, washed with brine, dried over magnesium sulphate, filtered and evaporated. The crude mixture was recrystallized in isopropanol to give (3-bromo-quinolin-6-yloxy) acetic acid methyl ester (11.5g) as a pale yellow solid.

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 8.78 (1H,d); 8.20 (1H,d), 8.0 (1H,d); 7.44 (1H,dxd); 6.92 (1H,d); 4.76 (2H, s); 3.85 (3H,s).

Step 2: Preparation of bromo-(3-bromo-quinolin-6-yloxy) acetic acid methyl ester

A suspension of (3-bromo-quinolin-6-yloxy) acetic acid methyl ester (2.0 g), N-bromosuccinimide (1.80 g) and, Azo-isobutyronitrile (0.222 g) in carbon tetrachloride (100 ml) was heated up at reflux for 3 hrs. The reaction mixture was cooled down to ambient temperature, filtered off and concentrated in vacuum to give bromo-(3-bromo-quinolin-6-yloxy) acetic acid methyl ester (2.8g) as yellow solid. The crude mixture was used in the next step without further purification.

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 8.87 (1H,d); 8.35 (1H,d); 8.12 (1H,d); 7.55 (1H,dxd); 7.41 (1H,d); 6.62 (1H,s); 3.98 (3H,s).

Step 3: Preparation of (3-bromo-quinolin-6-yloxy) methoxy acetic acid methyl ester

To a suspension of bromo-(3-bromo-quinolin-6-yloxy) acetic acid methyl ester (1.32 g) in anhydrous methanol was added Calcium carbonate (1.05 g). The reaction mixture was stirred at ambient temperature for 2.5 hrs; treated with chloroform and further stirred at R.T. for 10 minutes. The mixture was filtered off and the solvent was evaporated. The resulting crude oil was was fractionated by reverse phase HPLC (eluant:

acetonitrile/water) to give (3-bromo-quinolin-6-yloxy) methoxy acetic acid methyl ester (0.5g) as a yellow oil.

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 8.80 (1H,d); 8.22 (1H,d); 8.02 (1H,d); 7.51 (1H,dxd); 7.30 (1H,d); 5.63 (1H,s); 3.87 (3H,s); 3.58 (3H,s).

Step 4: Preparation of (3-bromo-quinolin-6-yloxy) methoxy acetic acid

A suspension of (3-bromo-quinolin-6-yloxy) methoxy acetic acid methyl ester (0.495 g) and lithium hydroxide monohydrate (0.070 g) in a mixture (500 ml) of tetrahydrofurane/water (1/1) was stirred at zero °C for 2.5 hrs. The reaction mixture is allowed to warm up to ambient temperature; ethyl acetate was added and the two phases were separated. The aqueous phase was acidified with dilute aqueous hydrochloric acid then extracted twice with ethyl acetate. The organic phases were combined, dried over magnesium sulphate, filtered and evaporated to give (3-bromo-quinolin-6-yloxy) methoxy acetic acid (0.39g) as a white solid which was used in the next step without further purification.

^{1}H NMR (DMSO d_6) δ ppm: 8.82 (1H,d); 8.63 (1H,d); 7.99 (1H,d); 7.57 (1H,dxd); 7.50 (1H,d); 5.78 (1H,s); 3.46 (3H,s).

Step 5: Preparation of 2-(3-bromo-quinolin-6-yloxy)-N-tert-butyl-2-methoxy acetamide

2-(3-bromo-quinolin-6-yloxy)-butyric acid (0.052 g), N-*tert*-Butyl amine (0.024 g), (benzotriazol-1-yloxy)-tris-(dimethylamino)-phosphonium-hexafluorophosphate (BOP) (0.099g), *N*-Ethyldiisopropylamine (0.043g) and N,N-dimethylaminopyridine (0.005 g) in dry N,N-dimethylformamide (4 ml) were stirred at ambient temperature for 8 hours. The reaction mixture was poured onto a solution of brine/ethyl acetate. The aqueous layer was separated and washed thrice with ethyl acetate. The organic phases were combined, dried over sodium sulphate, filtered and evaporated under reduced pressure. The resulting crude mixture was purified by chromatography on silica gel (eluant: heptane/ethyl acetate: 1/1) to give 2-(3-bromo-quinolin-6-yloxy)-N-*tert*-butyl-2-methoxy acetamide (Compound No.12 of Table 155) as a yellow oil (0.046g).

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 8.80 (1H,d); 8.22 (1H,d); 8.03 (1H,d); 7.52 (1H,dxd); 7.38 (1H,d); 6.45 (1H,br s); 5.36 (1H,s); 3.52 (3H,s); 1.38 (9H,s).

The following amides were prepared using a similar procedure.

Compound No. 12 of Table 99: N-tert-Butyl-2-(3,8-dibromo-quinolin-6-yloxy)-2-methoxy-acetamide using (3,8-dibromo-quinolin-6-yloxy)-methoxy acetic acid and N-*tert*-

butylamine. ^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 8.89 (1H,d); 8.23 (1H,d); 7.88 (1H,d); 7.49 (1H,d); 6.45 (1H,br s); 5.35 (1H,s); 3.52 (3H,s); 1.39 (9H,s).

Compound No. 47 of Table 155: 2-(3-Bromo-quinolin-6-yloxy)-2-methoxy-N-(2-methoxy-1,1-dimethyl-ethyl)-acetamide using (3-bromo-quinolin-6-yloxy)-methoxy-acetic acid and 2-methoxy-1,1-dimethyl-ethylamine, ^{1}H NMR ($CDCl_3$) □ ppm: 8.88 (1H,d); 8.21 (1H,d); 8.02 (1H,d); 7.51 (1H,dxd); 7.38 (1H,d); 6.8 (1H,br s); 5.38 (1H,s); 3.51 (3H,s); 3.37 (2H,m); 3.35 (3H,s); 1.39 (3H,s); 1.37 (3H,s).

Compound No. 52 of Table 155: 2-(3-Bromo-quinolin-6-yloxy)-N-(1-cyano-2-methoxy-1-methyl-ethyl)-2-methoxy-acetamide using (3-bromo-quinolin-6-yloxy)-methoxy-acetic acid and 2-cyano-1-methoxy-prop-2-ylamine, ^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: diastereoisomeric mixture (1/1); a) 8.81 (1H,d); 8.24 (1H,d); 8.02 (1H,d); 7.51 (1H,dxm); 7.41 (1H,d); 7.11 (1H,br s); 5.48 (1H,s); 3.75-3.6 (2H,m); 3.55 (3H,s); 3.51 (3H,s); 1.77 (3H,s); b) 8.81 (1H,d); 8.24 (1H,d); 8.02 (1H,d); 7.51 (1H,dxm); 7.38 (1H,d); 7.03 (1H,br s); 5.48 (1H,s); 3.75-3.6 (2H,m); 3.55 (3H,s); 3.44 (3H,s); 1.72 (3H,s).

Compound No. 12 of Table 156: 2-(3-Bromo-quinolin-6-yloxy)-N-*tert*-butyl-2-ethoxy-acetamide using (3-bromo-quinolin-6-yloxy)-ethoxy-acetic acid and N-*tert*-butylamine. ^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 8.79 (1H,d); 8.22 (1H,d); 8.01 (1H,d); 7.50 (1H,dxd); 7.38 (1H,d); 6.48 (1H,br s); 5.42 (1H,s); 3.85 (1H,m); 3.68 (1H,m); 1.39 (9H,s); 1.28 (3H,t).

Compound No. 47 of Table 156: 2-(3-Bromo-quinolin-6-yloxy)-2-ethoxy-N-(2-methoxy-1,1-dimethyl-ethyl)-acetamide using (3-bromo-quinolin-6-yloxy)-ethoxy-acetic acid and 2-methoxy-1,1-dimethyl-ethylamine.

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 8.79 (1H,d); 8.22 (1H,d); 8.01 (1H,d); 7.50 (1H,dxd); 7.37 (1H,d); 6.8 (1H,br s); 5.44 (1H,s); 3.85 (1H,m); 3.69 (1H,m); 3.38 (2H,m); 3.35 (3H,s); 1.39 (3H,s); 1.37 (3H,s); 1.28 (3H,t).

Compound No. 52 of Table 156: 2-(3-Bromo-quinolin-6-yloxy)-N-(1-cyano-2-methoxy-1-methyl-ethyl)-2-ethoxy-acetamide using (3-bromo-quinolin-6-yloxy)-ethoxy-acetic acid and 2-cyano-1-methoxy-prop-2-ylamine.

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: diastereoisomeric mixture (1/1); a) 8.80 (1H,d); 8.24 (1H,d); 8.02 (1H,d); 7.49 (1H,dxm); 7.40 (1H,d); 7.13 (1H,br s); 5.52 (1H,s); 3.88 (1H,m); 3.72 (1H,m); 3.73-3.6 (2H,m); 3.51 (3H,s); 1.78 (3H,s); 1.29 (3H,t); b) 8.80 (1H,d); 8.24 (1H,d); 8.02 (1H,d); 7.49 (1H,dxm); 7.37 (1H,d); 7.03 (1H,br s); 5.52 (1H,s); 3.88 (1H,m); 3.72 (1H,m); 3.73-3.6 (2H,m); 3.45 (3H,s); 1.73 (3H,s); 1.29 (3H,t).

Example 3

This Example illustrates the preparation of (3-bromo-quinolin-6-yloxy) methoxyacetic acid methyl ester according to Scheme 3 for m =1.

Step 1: Preparation of bromo-methoxy-acetic acid methyl ester

A suspension of methoxyacetic acid methyl ester (0.400 g), N-bromosuccinimide (0.752 g) and azo-isobutyronitrile (0.126 g) in carbon tetrachloride (6 ml) was heated at reflux for 20 hours. The reaction mixture was cooled down to ambient temperature, filtered off and concentrated in vacuum to give bromomethoxy-acetic acid methyl ester (0.94g) as a yellow liquid. The crude mixture was used in the next step without further purification. ^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 6.01 (1H,s); 3.88 (3H,s); 3.60 (3H,s).

Step 2: Preparation of (3-Bromo-quinolin-6-yloxy) methoxyacetic acid methyl ester

To a solution of potassium *tert*-butoxide (0.308 g) in *tert*-butyl alcohol (5 ml) at ambient temperature was added a solution of 3-bromo-quinolin-6-ol (0.454 g) in *tert*-butyl alcohol (1 ml). The resulting solution was stirred at R.T. for 15 minutes. Then, a solution of bromomethoxy-acetic acid methyl ester (0.500 g) in *tert*-butyl alcohol (1 ml), along with a catalytic amount of potassium iodide, were added. The reaction mixture was stirred at ambient temperature for 3 hours and then poured onto water (25 ml) / chloroform (25 ml). The aqueous layer was separated and washed thrice with chloroform. The organic phases were combined, washed with brine, dried over sodium sulphate, filtered and evaporated under reduced pressure. The resulting crude mixture was purified by reverse phase HPLC (eluant: acetonitrile/water) to give (3-bromo-quinolin-6-yloxy) methoxyacetic acid methyl ester (0.177g) as a yellow oil [^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 8.80 (1H,d); 8.22 (1H,d); 8.02 (1H,d); 7.51 (1H,dxd); 7.30 (1H,d); 5.63 (1H,s); 3.87 (3H,s); 3.58 (3H,s)] which can provide compounds of the general formula (1) as shown in Scheme 3 in a similar manner as described in Example 2, Steps 4 and 5.

Example 4

This Example illustrates the preparation of N-(3-fluoro-1,1-dimethyl-propyl)amine hydrochloride according to Scheme 9.

Step 1: Preparation of (3-Fluoro-1,1-dimethyl-propyl)-carbamic acid tert-butyl ester

4,4-dimethyl-2,2-dioxo-(1,2,3)oxathiazinane (23.9 g) (prepared according the procedure described in *J. Am. Chem. Soc.* 2001, *123*, 6935-6936) was dissolved in dry CH_3CN (500 ml) under a nitrogen atmosphere. Ethyl diisopropylamine (Hünig's base) (52.1 ml) and dimethylaminopyridine (DMAP) (1.8 g) were added followed by $(tBuOCO)_2O$ (56.9 g). The mixture was stirred at 50°C during 3 hours then poured into water and diluted with ethyl acetate. The organic phase was separated, washed with brine, dried over sodium suphate, filtered and evaporated to give the crude product which was purified by flash chromatography (cyclohexane: ethyl acetate, 2 :1) to give 24.1g pure 4,4-

dimethyl-2,2-dioxo-(1,2,3)oxathiazinane-3-carboxylic acid *tert*butyl ester as a yellow solid. ^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 4.55 (1H,t); 2.30 (1H,t); 1.65 (6H,s); 1.52 (9H,s)

To a solution of TBAF (6.8 ml of a 1M solution in THF) in CH3CN at room temperature, under a nitrogen atmosphere, was added 4,4-dimethyl-2,2-dioxo-(1,2,3)oxathiazinane-3-carboxylic acid *tert*butyl ester (1.5 g). The mixture was stirred overnight then diluted with ether (20 ml) and quenched with 1M HCl (7 ml). After separation, the organic phase was washed with brine, dried over sodium sulphate anhydrous, filtered and concentrated. The crude product was purified by flash chromatography (cyclohexane: ethyl acetate, 4 :1) to give 1.08g of pure (3-fluoro-1,1-dimethyl-propyl)-carbamic acid tert-butyl ester as a light yellow oil. ^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 4.65 (1H,t); 4.55 (1H,br s); 4.50 (1H,t); 2.15-2.05 (2H, m); 1.45 (9H,s); 1.30 (6H,s)

Step 2: Preparation of N-(3-Fluoro-1,1-dimethyl-propyl)amine hydrochloride

A 2M solution of HCl in ethyl ether (25 ml) was added to (3-fluoro-1,1-dimethyl-propyl)-carbamic acid tert-butyl ester (1.08 g) at room temperature, under a nitrogen atmosphere. The mixture was stirred overnight, then a 2M solution of HCl in ethyl ether (12 ml) was added again. After stirring during 2 days the mixture was concentrated to give a N-(3-fluoro-1,1-dimethyl-propyl)amine hydrochloride (0.77g) as a solid which was pure to be used for the next steps. ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ ppm: 4.62 (1H,t); 4.50 (1H,t); 3.70-3.45 (br s); 2.00-1.85 (2H, m); 1.20 (6H,s).

Example 5

This Example illustrates the preparation of 2-(3-iodo-quinolin-6-yloxy)-N-(3-fluoro-1,1-dimethyl-propyl) butyramide (Compound No. 275 of Table 158) according to Scheme 3 wherein m = 0.

Step 1: Preparation of 2-(3-Iodo-quinolin-6-yloxy)-butyric acid ethyl ester

Stage 1: Preparation of 3-iodo-6-hydroxyquinoline

To a stirred mixture of 3-bromo-6-hydroxyquinoline (preparation described in Liebigs Ann Chem 1966, 98-106), (3.0g), sodium iodide (4.0g) and copper iodide (0.25g) in dioxane (19.5ml) was added N,N,N',N'-tetramethyl-ethane-1,2-diamine (0.24g) in a sealed tube. The mixture was stirred at 120°C for 14h and upon cooling was treated with aqueous ammonia followed by aqueous hydrochloric acid. Extraction with ethyl acetate, drying of the organic phase over magnesium sulphate, filtration and evaporation under reduced pressure gave the required product (M^+ 272) as a light brown coloured powder that was used as such in the next step.

Stage 2: 3-Iodo-quinolin-6-ol (1.0 g) from Step1, Stage 1 was dissolved in dry DMF (20 ml). 2-Bromo-butyric acid ethyl ester (940 mg) and dry potassium carbonate (1.5 g) were added to the mixture at R.T. The resulting suspension was stirred at 50°c for 3 hour. The

reaction mixture was poured into brine and extracted 3 times with ethyl acetate. The organic layers were combined, washed with brine, dried over sodium sulphate, filtered and evaporated to give 0.86g og 2-(3-iodo-quinolin-6-yloxy)-butyric acid ethyl ester which after flash chromatography (cyclohexane: ethyl acetate, 6 :1) . ^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 8.86 (1H,d); 8.36 (1H,d); 7.95 (1H,d); 7.41 (1H,dd); 6.85 (1H,d); 4.65 (1H,t); 4.22 (2H,q); 2.05 (2H,m); 1.25 (3H,t); 1.10 (3H,t).

Step 2: Preparation of 2-(3-Iodo-quinolin-6-yloxy)-butyric acid

To a solution of 2-(3-iodo-quinolin-6-yloxy)-butyric acid ethyl ester (860 mg) in tetrahydrofurane (9 ml) at room temeprature is added a 0.5M aqueous solution of NaOH (5.4 ml). The reaction mixture is stirred 4 h at room temperature. Ethyl acetate was added and the two phases were separated. The aqueous phase was acidified with 1M HCl (until pH 2-3) then extracted twice with ethyl acetate. The organic phases were combined, washed with brine, dried over sodium sulphate, filtered and evaporated to give 0.77g of crude 2-(3-iodo-quinolin-6-yloxy)-butyric acid which was used in the next step without further purification. ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ ppm: 8.85 (1H,d); 8.20 (1H,d); 7.90 (1H,d); 7.45 (1H,dd); 7.20 (1H,d); 4.85 (1H,t); 2.00 (2H,m); 1.05 (3H,t).

Step 3: Preparation of 2-(3-Iodo-quinolin-6-yloxy)-N-(3-Fluoro-1,1-dimethyl-propyl) butyramide

2-(3-Iodo-quinolin-6-yloxy)-butyric acid (100 mg), N-(3-fluoro-1,1-dimethyl-propyl) amine hydrochloride (44 mg) from Step 2, Example 4, 1-hydroxy-7-azabenzotriazole (HOAT) (42 mg), O-(Benzotriazol-1-yl)-N,N,N',N'-tetramethyluronium tetrafluoroborate (TBTU) (100 mg) and triethylamine (0.2 ml) in dry CH_3CN (7 ml) were stirred at ambient temperature overnight. The reaction mixture was quenched with a saturated solution of $NaHCO_3$ and extracted with ethyl acetate. The organich phase was washed with brine and dried over sodium sulphate, filtered and evaporated. The crude product was purified by flash chromatography (cyclohexane: ethyl acetate, 3 :1) to give 0.12g of 2-(3-iodo-quinolin-6-yloxy)-N-(3-fluoro-1,1-dimethyl-propyl) -butyramide as a yellow oil.

Compound 275 of Table 158: ^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 8.90 (1H,d); 8.40 (1H,d); 7.96 (1H,d); 7.40 (1H,dd); 6.95 (1H,d); 6.40 (1H,br s); 4.60-4.35 (3H,m); 2.20-1.95 (4H,m); 1.35 (3H,s); 1.32 (3H,s); 1.05 (3H,t).

Example 6

This Example illustrates the preparation of 2-(3-bromo-8-methyl-quinolin-6-ylox y)-N-tert-butyl-butyramide (Compound No. 12 of Table 90) according to Scheme 3 wherein m = 0.

Stage 1: Preparation of 3-bromo-6-hydroxy-8-methylquinoline

6-Amino-3-bromo-8-methylquinoline (12g) (preparation described in Journal of the American Chemical Society (1955), pages 4175-4176) was suspended in a mixture of water (5ml) and phosphoric acid (60ml) and heated in a sealed glass tube to 180oC for 3 days. The mixture was cooled to ambient temperature, diluted with water then taken to pH 3-4 with aqueous (2M) sodium hydroxide. The precipitate formed was filtered from solution, washed with cold water and sucked to dryness to give 3-bromo-6-hydroxy-8-methylquinoline as a grey solid.

1H NMR (d6-DMSO) δ ppm: 2.56(3H,s); 3.50(1H,bs); 6.91(1H,d); 7.15(1H,d); 8.38(1h,d); 8.61(1H,d).

The procedures of example 1, steps 1-3 is repeated using 3-bromo-6-hydroxy-8-methylquinoline from stage 1 above as a staring material to provide 2-(3-bromo-8-methyl-quinolin-6-yloxy)-N-tert-butyl-butyramide (Compound No.12 of Table 90):

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 8.79 (1H,d); 8.14 (1H,d); 7.27 (1H,d); 6.83 (1H,d); 6.10 (1H,br s); 4.49 (1H,dd); 2.75 (3H,s); 2.06-1.93 (2H,m), 1.30 (9H, s), 1.05 (3H, t).

The following amides were prepared using a similar procedure.

Compound No. 47 of Table 90: 2-(3-Bromo-8-methyl-quinolin-6-yloxy)-N-(2-methoxy-1,1-dimethyl-ethyl)-butyramide using 2-(3-bromo-8-methyl-quinolin-6-yloxy)-butyric acid and 1-methoxy-2-methylprop-2-ylamine:

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 8.79 (1H,d); 8.15 (1H,d); 7.27 (1H,d); 6.84 (1H,d); 6.42 (1H,br s); 4.50 (1H,dd); 3.29 (2H,dd), 3.27 (3H,s), 2.76 (3H,s), 2.08-1.94 (2H,m), 1.33 (3H,s), 1.28 (3H,s), 1.06 (3H, t).

Compound No. 52 of Table 90: 2-(3-Bromo-8-methyl-quinolin-6-yloxy)-N-(cyano-methoxymethyl-methyl-methyl)-butyramide using2-(3-bromo-8-methyl-quinolin-6-yloxy)-butyric acid and 2-cyano-1-methoxy-prop-2-ylamine:

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: diastereoisomeric mixture; 8.78 (1H,m); 8.18-8.14 (1H,d); 7.27 (1H,m); 6.88-6.79 (2H, m), 4.70-4.62 (1H,m), 3.69-3.52 (2H,m), {3.43 (s) & 3.28 (s) 3H}, 2.74 (3H, s), 2.13-2.00 (2H,m), {1.72 (s) & 1.64 (s), 3H}, 1.10-1.06 (3H,m).

EXAMPLE 7

This Example illustrates the preparation of 1-methoxy-3-methylbut-3-ylamine hydrochloride according to Scheme 9.

Stage 1: Preparation of 1-methoxy-3-methylbut-3-ylamine hydrochloride

To a stirred suspension of sodium hydride (0.30g, 80% dispersion in mineral oil) in dry N,N-dimethylformamide (2ml) under an atmosphere of nitrogen at ambient temperature was added dropwise a solution of 1-hydroxy-3-methylbut-3-ylamine (0.52g) in N,N-dimethylformamide (5ml). The mixture was stirred for 3 hours, methyl iodide (0.74g) in N,N-dimethylformamide (5ml) added over 5 minutes then stirred for another 2.25 hours and stored for 18 hours at ambient temperature. The solution was diluted with water, extracted into ethyl acetate (three times) and the extracts combined then extracted with dilute hydrochloric acid. The aqueous acidic extract was evaporated under reduced pressure and co-distilled with toluene to remove residual water to give 1-methoxy-3-methylbut-3-ylamine hydrochloride as a yellow gum.

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 1.54(6H,s); 1.96-2.00(2H,t); 3.48(3H,s); 3.62-3.66(2H,t).

In a similar procedure, 1-hydroxy-3-methylbut-3-ylamine was reacted with ethyl iodide to give 1-ethoxy-3-methylbut-3-ylamine hydrochloride.

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 1.20-1.24(3H,t); 1.54(6H,s); 1.96-2.00(2H,t); 3.50(2H,q); 3.66-3.70(2H,t).

In a similar procedure, 1-hydroxy-2-methylprop-2-ylamine was reacted with methyl iodide to give 1-methoxy-2-methylprop-2-ylamine hydrochloride.

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 1.47(6H,s); 3.43(3H,s); 3.44(2H,s); 8.24(3H bs).

In a similar procedure, 1-hydroxy-2-methylprop-2-ylamine was reacted with 4-fluorobenzyl bromide to give 1-(4-fluorobenzyloxy)-2-methylprop-2-ylamine hydrochloride.

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 1.41(6H,s); 3.46(2H,s); 4.53(2H,s); 7.00-7.04(2H,m);7.32-7.36(2H,m); 8.30(3H bs).

EXAMPLE 8

Table 161

The characterized compounds in Table 161 are of the general formula (I) where Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen, L is O, R^2 is hydrogen, and Q^1,Q^2, Q^3, m , R^1 and R^3 have the values given in the table.

Cpd. No.	Q^1	Q^2	Q^3	m	R^1	R^3	Physical/spectral data
1	Br	H	H	1	Me	$C(CH_3)_3$	m.p.=104-105 °C
2	Br	H	H	1	Et	$C(CH_3)_3$	^{1}H NMR ($CDCl_3$) δppm: 8.79 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.00 (1H, d); 7.50 (1H, dd); 7.48 (1H, d); 6.48 (1H, s br); 5.41 (1H, s); 3.90

							to 3.53 (2H, m); 1.38 (9H, s); 1.28 (3H, t).
3	Br	H	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	^{1}H NMR ($CDCl_3$) □ppm: 8.79 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.00 (1H, d); 7.51 (1H, dd); 7.48 (1H, d); 6.79 (1H, s br); 5.47 (1H, s); 3.50 (3H, s); 3.40 to 3.34 (5H, m); 1.40 (6H, d).
4	Br	H	H	1	Me	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	^{1}H NMR ($CDCl_3$) □ppm: 8.80 (1H, d); 8.23 (1H. d); 8.02 (1H, d); 7.51 (1H, m); 7.39 (1H, dd); 7.11, 7.03 (1H, s br, 2 isomers); 5.49, 5.47 (1H, s, isomers A+B); 3.74 to 3.60 (2H, m, isomers A+B); 3.56 (3H, s); 3.51, 3.43 (3H, s, isomers A+B); 1.77, 1.73 (3H, s, isomers A+B).
5	Br	Br	H	1	Me	$C(CH_3)_3$	m.p.=154-157 °C
6	Br	H	H	1	Et	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	^{1}H NMR ($CDCl_3$) □ppm: 8.79 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.02 (1H, d); 7.50 (1H, dd); 7.48 (1H, d); 6.81 (1H, s br); 5.43 (1H, s); 3.91 to 3.62 (2H, m); 3.39 (2H, s); 3.37 (3H, s); 1.38 (6H, d); 1.28 (3H, t).
7	Br	H	H	1	Et	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	^{1}H NMR ($CDCl_3$) □ppm: 8.80 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.02 (1H, d); 7.48 (1H, m); 7.38 (1H, dd); 7.13, 7.03 (1H, s br, isomers A+B); 5.53, 5.51 (1H, s, isomers A+B); 3.92 to 3.83 (1H, m); 3.75 to 3.61 (3H, m); 3.50, 3.43 (3H, s, isomers A+B); 1.77, 1.72 (3H, s,

							isomers A+B); 1.38 (3H, m).
8	Br	Cl	H	1	Me	$C(CH_3)_3$	m.p.=130-134 °C
9	Br	Br	H	1	Et	$C(CH_3)_3$	m.p.=157-160 °C
10	Br	Br	H	1	Me	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	m.p.=120-122 °C
11	Br	Br	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	m.p.=80-83 °C
12	Br	H	H	1	CH_2(cyclopropyl)	$C(CH_3)_3$	^{1}H NMR ($CDCl_3$) □ppm: 8.80 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.02 (1H, d); 7.50 (1H, dd); 7.38 (1H, d); 6.50 (1H, s br); 5.50 (1H, s); 3.65 to 3.55 (1H, m); 3.50 to 3.46 (1H, m); 1.40 (9H, s); 1.09 (1H, m); 0.53 (2H, d); 0.20 (2H, m).
13	Br	H	H	1	CH_2CHCH_2	$C(CH_3)_3$	^{1}H NMR ($CDCl_3$) □ppm: 8.80 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.02 (1H, d); 7.51 (1H, dd); 7.49 (1H, d); 6.47 (1H, s br); 5.98 to 5.86 (1H, m); 5.46 (1H, s); 5.38 to 5.27 (2H, m); 4.33 (1H, dd); 4.18 (1H, dd); 1.39 (9H, s).
14	Br	H	H	1	CH_2CF_3	$C(CH_3)_3$	m.p.=127-130 °C
15	Br	H	H	1	$CH(CH3)_2$	$C(CH_3)_3$	^{1}H NMR ($CDCl_3$) □ppm: 8.80 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.00 (1H, d); 7.49 (1H, dd); 7.38 (1H, d); 6.49 (1H, s br); 5.45 (1H, s); 4.03 (1H, quint.); 1.37 (9H, s); 1.27 (3H, d); 1.20 (3H, d).
16	Br	H	H	1	$(CH_2)_2OCH3$	$C(CH_3)_3$	m.p.=58-62 °C
17	Br	H	H	1	$CH(CH2F)_2$	$C(CH_3)_3$	m.p.=124-128 °C
18	Br	H	H	1	CH_2CCH	$C(CH_3)_3$	^{1}H NMR ($CDCl_3$) □ppm: 8.80 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.01 (1H, d); 7.51 (1H, dd); 7.43 (1H, d); 6.43 (1H, s br); 5.62 (1H, s); 4.44 (2H, m); 2.47 (1H, s); 1.49 (9H, s).
19	Br	H	H	1	$(CH_2)_2$	$C(CH_3)_3$	^{1}H NMR ($CDCl_3$)

					SCH3		□ppm: 8.80 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.01 (1H, d); 7.51 (1H, dd); 7.39 (1H, d); 6.58 (1H, s br); 5.47 (1H, s); 4.00 to 3.93 (1H, m); 3.81 to 3.64 (1H, m); 2.73 (2H, m); 2.11 (3H, s); 1.39 (9H, s).
20	Br	H	H	1	CH_2C CCH3	$C(CH_3)_3$	^{1}H NMR ($CDCl_3$) □ppm: 8.80 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.01 (1H, d); 7.52 (1H, dd); 7.42 (1H, d); 6.48 (1H, s br); 5.62 (1H, s); 4.47 to 4.34 (2H, m); 1.79 (3H, m); 1.39 (9H, s).
21	Br	H	H	1	CH_2C HF_2	$C(CH_3)_3$	m.p.=102-1106 °C
22	Br	Me	H	1	Me	$C(CH_3)_3$	m.p.=110-113 °C
23	Br	Me	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	m.p.=55-60 °C
24	Br	Me	H	1	Me	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	m.p.=95-99 °C
25	I	H	H	1	Me	$C(CH_3)_3$	m.p.=125-128 °C
26	I	Me	H	1	Me	$C(CH_3)_3$	m.p.=132-136 °C
27	Br	H	F	1	Me	$C(CH_3)_3$	m.p.=120-123 °C
28	Br	H	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH_2OH$	^{1}H NMR ($CDCl_3$) □ppm: 8.82 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.02 (1H, d); 7.50 (1H, dd); 7.38 (1H, d); 6.70(1H, s br); 5.42 (1H, s); 3.89 (1H, t); 3.70 to 3.59 (2H, m); 3.52 (3H, s); 1.33 (6H, d).
29	Br	Me	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH_2OH$	^{1}H NMR ($CDCl_3$) □ppm: 8.82 (1H, d); 8.20 (1H, d); 7.35 (1H, m); 7.20 (1H, d); 6.70(1H, s br); 5.41 (1H, s); 3.92 (1H, t); 3.70 to 3.60 (2H, m); 3.52 (3H, s); 2.78 (3H, s); 1.33 (6H, d).
30	I	H	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH_2OH$	^{1}H NMR ($CDCl_3$) □ppm: 8.82 (1H, d); 8.47 (1H, d); 8.01 (1H, d); 7.51 (1H, dd); 7.35 (1H, d); 6.70 (1H, s br);

							5.41 (1H, s); 3.90 (1H, s); 3.62 (2H, s); 3.51 (3H, s); 1.33 (6H, d).
31	I	Me	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH_2OH$	m.p.=105-107 °C
32	Br	H	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH(O)$	^{1}H NMR ($CDCl_3$) □ppm: 9.39 (1H, s); 8.81 (1H, d); 8.23 (1H, d); 8.02 (1H, d); 7.52 (1H, dd); 7.39 (1H, d); 7.22 (1H, s br); 5.47 (1H, s); 3.54 (3H, s); 1.46 (6H, d).
33	Br	Me	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH(O)$	m.p.=148-150 °C
34	I	H	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH(O)$	^{1}H NMR ($CDCl_3$) □ppm: 9.39 (1H, s); 8.93 (1H, d); 8.46 (1H, d); 8.01 (1H, d); 7.52 (1H, dd); 7.33 (1H, d); 7.22 (1H, s br); 5.47 (1H, s); 3.54 (3H, s); 1.46 (6H, d).
35	I	Me	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH(O)$	m.p.=174-175 °C
36	H	H	H	0	Et	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	m.p.=134-136 °C
37	H	H	H	0	Et	C(CH3)CH(C(O)CH3)OH	m.p.=130-132 °C
38	Br	H	H	0	CH(Me)$_2$	$C(CH_3)_3$	m.p.=123-125 °C
39	Br	H	H	0	CH(Me)$_2$	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	m.p.=151-157 °C
40	Br	H	H	0	cyclopropyl	$C(CH_3)_3$	m.p.=165-167 °C
41	Br	H	H	0	cyclopropyl	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	m.p.=119-121 °C
42	Br	H	H	0	cyclopropyl	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	m.p.=139-141 °C
43	Br	H	H	0	Et	$C(CH_3)_3$	^{1}H NMR ($CDCl_3$) □ppm: 8.69 (1H, sm); 8.10 (1H, sm); 7.92 (1H, d); 7.32 (1H, dm); 6.92 (sm); 6.0 (1H, br s); 4.43 (1H, m); 1.95 (2H, m); 1.22 (9H, s); 0.96 (3H, t).
44	Br	H	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	^{1}H NMR ($CDCl_3$) □ppm: 8.75 (1H, sm); 8.16 (1H, sm); 7.98 (1H, d); 7.38 (1H, dm); 7.00 (sm); 6.4 (1H, br s); 4.51 (1H,

							m); 3.33-3.20 (2H, m); 3.23 (3H, s); 2.0 (2H, m); 1.30 (3H, s); 1.23 (3H, s); 1.05 (3H, t).
45	Br	H	H	0	Et	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	^{1}H NMR ($CDCl_3$) □ppm: 8.72 (isomer A, 1H, sm); 8.68 (isomer B, 1H, sm); 8.18 (isomer A, 1H, sm); 8.10 (isomer B, 1H, sm); 7.98 (isomer A, 1H, d); 7.92 (isomer B, 1H, d); 7.42 (isomer B, 1H, dm); 7.38 (isomer A, 1H, dm); 7.0 (isomer A, 1H, sm); 6.95 (isomer B, 1H, sm); 6.90+6.85 (isomer A+B, 1H, 2 br s); 4.7-4.6 (isomer A+B, 1H, m); 3.75-3.50 (isomer A+B, 2H, m); 3.40 and 3.25 (isomers A+B, 3H, 2s); 2.15-1.95 (isomers A+B, 2H, m); 1.70 (isomer A, 3H, s); 1.60 (isomer B, 3H, s); 1.15 (isomer B, 3H, t); 1.04 (isomer A, 3H, t).
46	Br	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_3$	m.p.=138-140°C
47	Br	Me	H	0	Et	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	m.p.=89-90°C
48	I	H	H	0	Et	$C(CH_3)_3$	m.p.=125-126 °C
49	I	H	H	0	Et	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	m.p.=100-101 °C
50	I	H	H	0	Et	$C(CH_3)(CH_2)_2F$	^{1}H-NMR ($CDCl_3$) □ ppm: 8.90 (1H,d); 8.40 (1H,d); 7.96 (1H,d); 7.40 (1H,dd); 6.95 (1H,d); 6.40 (1H,br s); 4.60-4.35 (3H,m); 2.20-1.95 (4H,m); 1.35 (3H,s); 1.32 (3H,s); 1.05 (3H,t).
51	Br	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	m.p.=117-120°C
52	Br	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH_2OH$	m.p.=99-100°C
53	Br	Cl	H	0	Et	$C(CH_3)_3$	m.p.=126-127°C

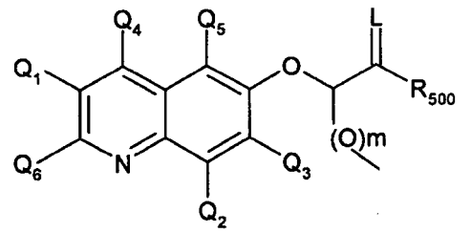
54	Br	Cl	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	m.p.=139-140°C
55	Br	Cl	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH_2OH$	m.p.=125-127°C
56	Br	Cl	H	0	Et	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	m.p.=105-106°C
57	Br	Me	H	0	Me	$C(CH_3)_3$	m.p.=155-157°C
58	Br	Me	H	0	Me	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	m.p.=104-106°C
59	Br	Me	H	0	Me	$C(CH_3)_2CH_2OH$	m.p.=98-99°C
60	Br	Me	H	0	Me	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	m.p.=136-138°C
61	Br	Cl	H	0	Me	$C(CH_3)_3$	m.p.=148-150°C
62	Br	Cl	H	0	Me	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	m.p.=122-123°C
63	Br	Cl	H	0	Me	$C(CH_3)_2CH_2OH$	m.p.=102-104°C
64	Br	Cl	H	0	Me	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	m.p.=144-146°C
65	Br	H	H	0	$(CH_2)_2F$	$C(CH_3)_3$	m.p.=126-128 °C
66	Br	H	H	0	$(CH_2)_2OMe$	$C(CH_3)_3$	m.p.=109-111 °C
67	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	^{1}H-NMR ($CDCl_3$) □ ppm: 8.94 (1H, d, isomer A+B); 8.40 (1H, dd, isomer A+B); 7.27 (1H, m, isomer A+B); 6.85-6.75 (2H, m, isomer A+B); 4.67 (1H, m, isomer A+B); 3.72-3.46 (2H,m, isomer A+B); 3.45 (3H, s, isomer A); 3.29 (3H, s, isomer B); 2.74 (3H, s, isomer A+B); 2.10-2.00 (1H, m, 2H); 1.72 (3H, s, isomer A); 1.63 (3H, s, isomer B); 1.12-0.60 (3H, m, isomer A+B)
68	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2(CH_2)_2SCH_3$	^{1}H-NMR ($CDCl_3$) □ ppm: 8.95 (1H, d); 8.42 (1H, d); 7.30 (1H, d); 6.82 (1H, d); 6.13 (1H, s); 4.50 (1H, dd); 2.78 (3H, s); 2.31-2.22 (2H, m); 2.08-1.95 (4H, m); 1.98 (3H, s); 1.31 (3H, s); 1.29 (3H, s); 1.08 (3H, t)
69	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2(CH_2)_2S(O)CH_3$	m.p.=101-102 °C
70	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2(CH_2)_2S(O)_2CH_3$	m.p.=85-86 °C
71	I	H	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH_2CCH$	^{1}H-NMR ($CDCl_3$) □ ppm: 8.91 (1H, d); 8.41 (1H, d), 8.00 (1H, d); 7.42

							(1H, dd); 6.99 (1H, d); 6.29 (1H, s); 4.52 (1H, dd); 2.7-2.55 (2H, m); 2.10-1.98 (2H, m); 1.72 (1H, t); 1.38 (3H, s); 1.09 (3H, t)
72	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH_2CCH$	^{1}H-NMR ($CDCl_3$) □ ppm: 8.90 (1H, d); 8.37 (1H, d); 7.29 (1H, d); 6.30 (1H, d); 6.28 (1H, s); 4.50 (1H, dd); 2.72 (3H, s); 2.7-2.55 (2H, m); 2.01-1.97 (2H, m); 1.74 (1H, t); 1.37 (3H, s); 1.07 (3H, t)
73	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_3$	m.p.=139-140 °C
74	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	m.p.=136-138 °C
75	I	H	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH_2OH$	m.p.=88-90°C
76	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH(O)$	m.p.=153-154°C
77	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH_2OH$	m.p.=103-105°C
78	I	H	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH(O)$	m.p.=148-150°C
79	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2(CH_2)_2S(O)(NH)CH_3$	m.p.=58-59°C
80	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2(CH_2)_2S(O)(NCH_2CCH)CH_3$	m.p.=51-52°C
81	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2(CH_2)_2S(O)(NC_6H_4pCl)CH_3$	m.p.=58-59°C

EXAMPLE 9

Table 162

The characterized compounds in Table 162 are of the general formula (100) where Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen, L is O and, Q^1,Q^2, Q^3, m , R^{500} have the values given in the table.



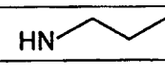
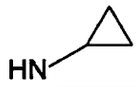
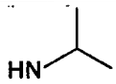
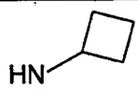
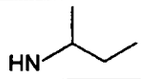
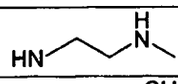
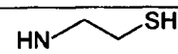
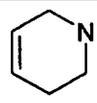
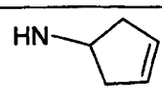
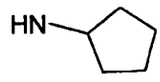
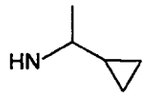
(100)

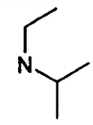
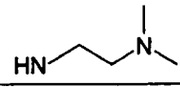
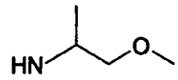
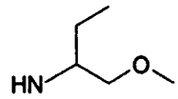
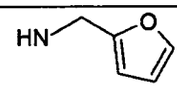
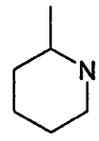
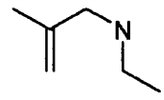
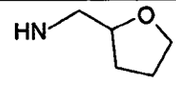
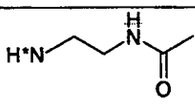
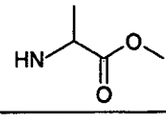
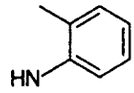
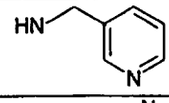
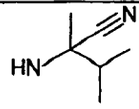
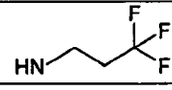
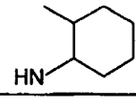
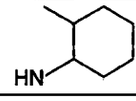
The following method was used for LC-MS analysis:

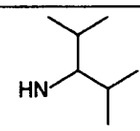
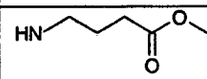
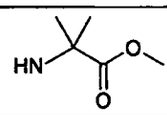
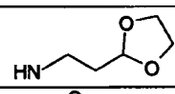
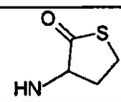
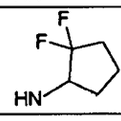
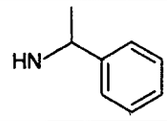
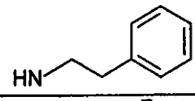
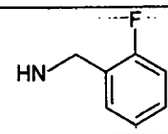
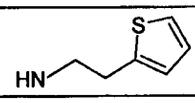
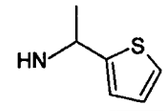
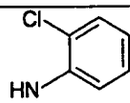
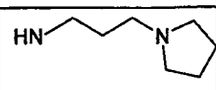
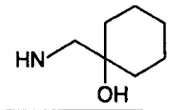
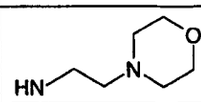
Method A: Method (Water Alliance 2795 LC) with the following HPLC gradient conditions (Solvent A: 0.1% of formic acid in water / acetonitrile (9: 1) and Solvent B: 0.1% of formic acid in acetonitrile)

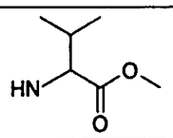
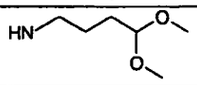
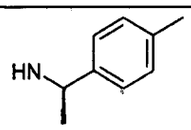
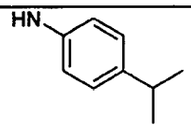
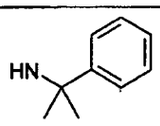
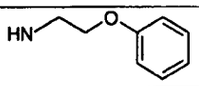
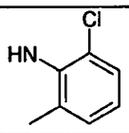
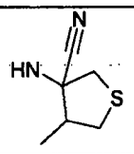
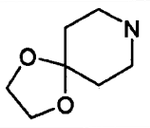
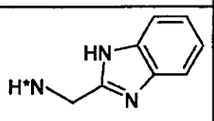
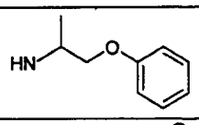
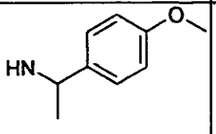
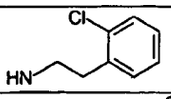
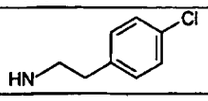
Time (minutes)	A (%)	B (%)	Flow rate (ml/min)
0	90	10	1.7
2.5	0	100	1.7
2.8	0	100	1.7
2.9	90	10	1.7

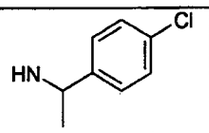
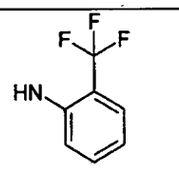
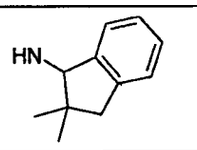
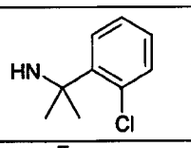
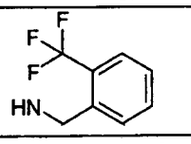
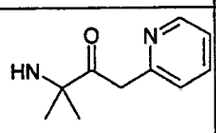
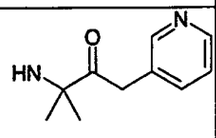
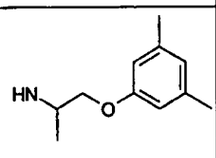
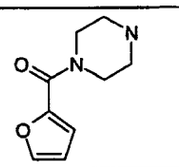
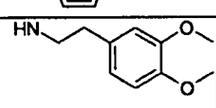
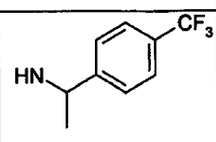
Type of column: Water atlantis dc18; Column length: 20 mm; Internal diameter of column: 3 mm; Particle Size: 3 micron; Temperature: 40°C.

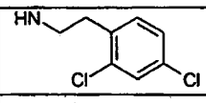
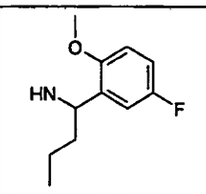
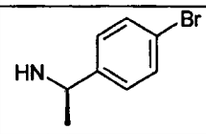
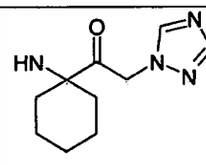
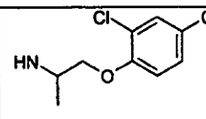
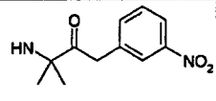
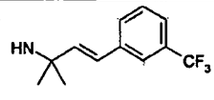
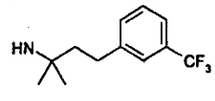
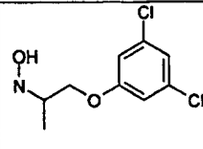
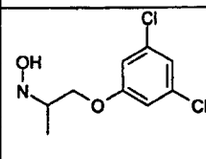
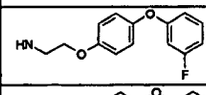
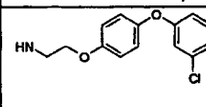
Cpd. No.	Q1	Q2	Q3	m	R^1	R^{500}	RT (Min)	M+H
1	I	Me	H	0	Et		1.60	413.1
2	I	Me	H	0	Et		1.30	385.0
3	I	Me	H	0	Et		1.50	399.0
4	I	Me	H	0	Et		1.50	411.0
5	I	Me	H	0	Et		1.60	413.1
6	I	Me	H	0	Et		1.70	425.1
7	I	Me	H	0	Et		1.70	427.1
8	I	Me	H	0	Et		0.80	428.1
9	I	Me	H	0	Et		1.50	431.0
10	I	Me	H	0	Et		1.70	437.1
11	I	Me	H	0	Et		1.70	437.1
12	I	Me	H	0	Et		1.70	439.1
13	I	Me	H	0	Et		1.80	439.1

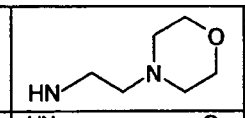
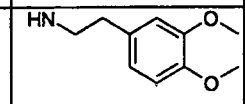
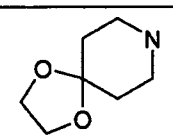
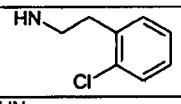
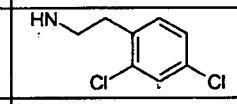
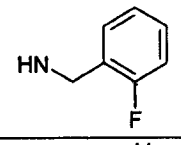
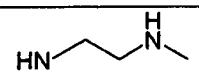
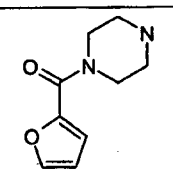
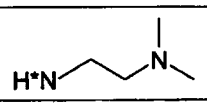
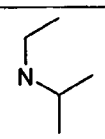
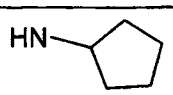
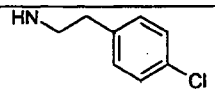
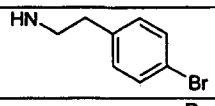
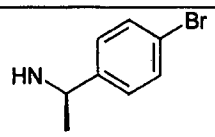
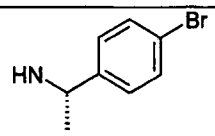
14	I	Me	H	0	Et		1.80	441.1
15	I	Me	H	0	Et		0.75	442.1
16	I	Me	H	0	Et		1.50	443.1
17	I	Me	H	0	Et		1.30	443.1
18	I	Me	H	0	Et		1.70	451.0
19	I	Me	H	0	Et		1.80	453.1
20	I	Me	H	0	Et		1.90	453.1
21	I	Me	H	0	Et		1.50	455.1
22	I	Me	H	0	Et		1.10	456.1
23	I	Me	H	0	Et		1.50	457.1
24	I	Me	H	0	Et		1.90	461.1
25	I	Me	H	0	Et		0.91	462.1
26	I	Me	H	0	Et		1.70	466.1
27	I	Me	H	0	Et		1.70	467.0
28	I	Me	H	0	Et		2.00	467.1
29	I	Me	H	0	Et		2.00	467.1

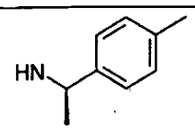
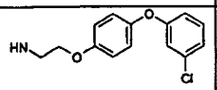
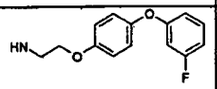
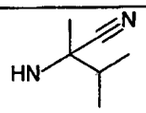
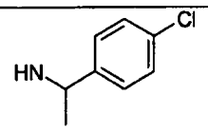
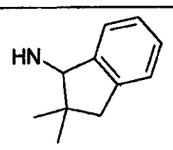
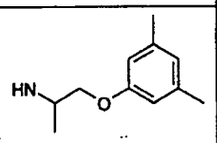
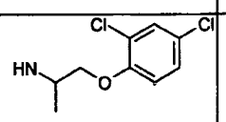
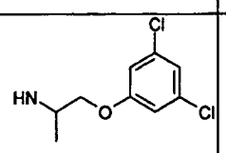
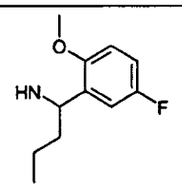
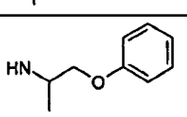
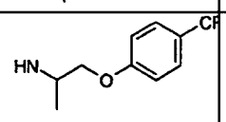
30	I	Me	H	0	Et		2.10	469.1
31	I	Me	H	0	Et		1.46	471.1
32	I	Me	H	0	Et		1.60	471.1
33	I	Me	H	0	Et		1.40	471.1
34	I	Me	H	0	Et		1.50	471.0
35	I	Me	H	0	Et		1.70	475.1
36	I	Me	H	0	Et		1.80	475.1
37	I	Me	H	0	Et		1.80	475.1
38	I	Me	H	0	Et		1.80	479.1
39	I	Me	H	0	Et		1.80	481.0
40	I	Me	H	0	Et		1.80	481.0
41	I	Me	H	0	Et		2.10	481.0
42	I	Me	H	0	Et		0.90	482.1
43	I	Me	H	0	Et		1.60	483.1
44	I	Me	H	0	Et		0.90	484.1

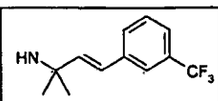
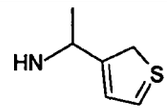
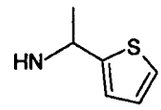
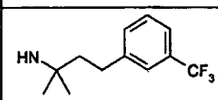
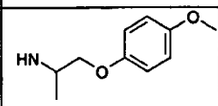
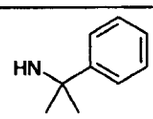
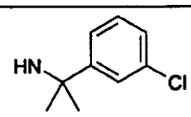
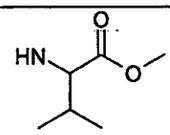
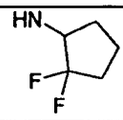
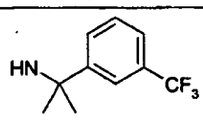
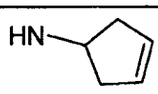
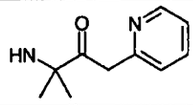
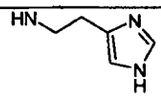
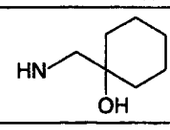
45	I	Me	H	0	Et		1.80	485.1
46	I	Me	H	0	Et		1.50	487.1
47	I	Me	H	0	Et		2.00	489.1
48	I	Me	H	0	Et		2.20	489.1
49	I	Me	H	0	Et		2.00	489.1
50	I	Me	H	0	Et		1.80	491.1
51	I	Me	H	0	Et		1.90	495.0
52	I	Me	H	0	Et		1.70	496.0
53	I	Me	H	0	Et		1.60	497.1
54	I	Me	H	0	Et		1.00	501.1
55	I	Me	H	0	Et		1.90	505.1
56	I	Me	H	0	Et		1.80	505.1
57	I	Me	H	0	Et		2.00	509.0
58	I	Me	H	0	Et		2.00	509.0

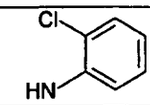
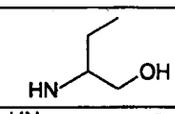
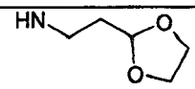
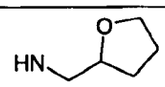
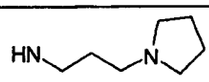
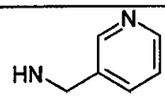
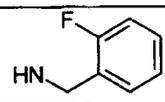
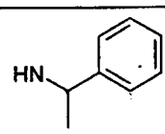
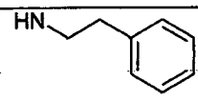
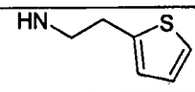
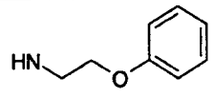
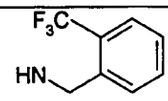
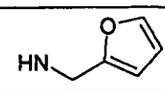
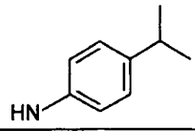
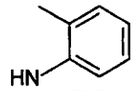
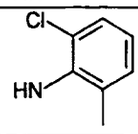
59	I	Me	H	0	Et		2.00	509.0
60	I	Me	H	0	Et		2.10	515.0
61	I	Me	H	0	Et		2.20	515.1
62	I	Me	H	0	Et		2.10	523.1
63	I	Me	H	0	Et		2.00	529.1
64	I	Me	H	0	Et		1.10	532.1
65	I	Me	H	0	Et		0.94	532.1
66	I	Me	H	0	Et		2.20	533.1
67	I	Me	H	0	Et		1.50	534.1
68	I	Me	H	0	Et		1.70	535.1
69	I	Me	H	0	Et		2.00	543.1

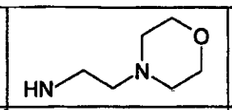
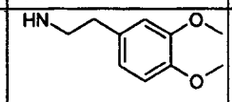
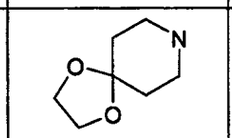
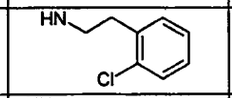
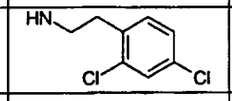
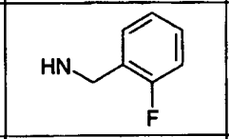
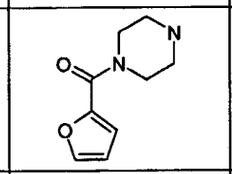
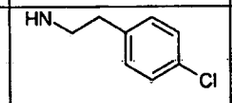
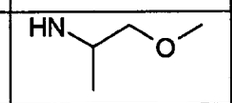
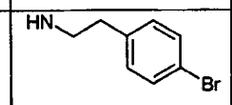
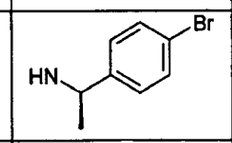
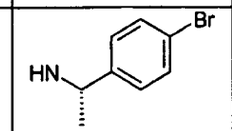
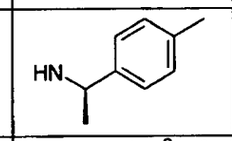
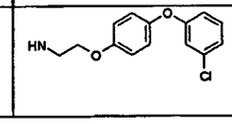
70	I	Me	H	0	Et		2.10	543.0
71	I	Me	H	0	Et		2.10	551.1
72	I	Me	H	0	Et		2.00	553.0
73	I	Me	H	0	Et		1.60	562.1
74	I	Me	H	0	Et		2.20	573.0
75	I	Me	H	0	Et		1.90	576.1
76	I	Me	H	0	Et		2.30	583.1
77	I	Me	H	0	Et		2.30	585.1
78	I	Me	H	0	Et		1.90	589.0
79	I	Me	H	0	Et		2.14	589.0
80	I	Me	H	0	Et		2.20	601.1
81	I	Me	H	0	Et		2.30	617.1

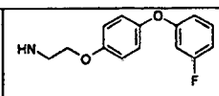
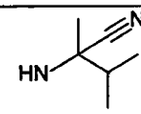
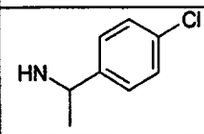
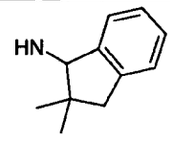
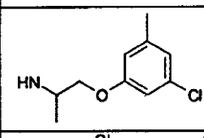
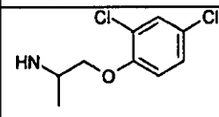
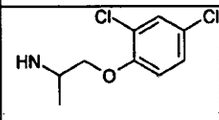
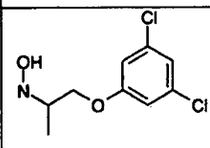
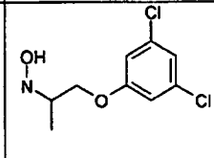
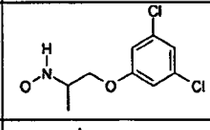
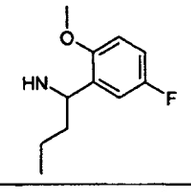
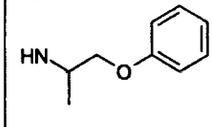
82	Br	H	H	1	Me		0.40	424.1
83	Br	H	H	1	Me		1.39	475.1
84	Br	H	H	1	Me		1.30	437.1
85	Br	H	H	1	Me		1.68	449.0
86	Br	H	H	1	Me		1.84	483.0
87	Br	H	H	1	Me		1.49	419.0
88	Br	H	H	1	Me		0.39	368.1
89	Br	H	H	1	Me		1.22	474.1
90	Br	H	H	1	Me		0.38	382.1
91	Br	H	H	1	Me		1.53	381.1
92	Br	H	H	1	Me		1.44	379.1
93	Br	H	H	1	Me		1.68	449.0
94	Br	H	H	1	Me		1.72	493.0
95	Br	H	H	1	Me		1.73	493.0
96	Br	H	H	1	Me		1.73	493.0

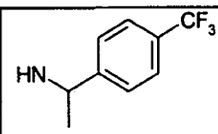
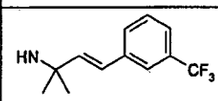
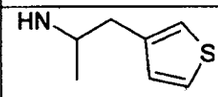
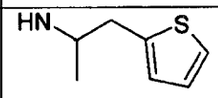
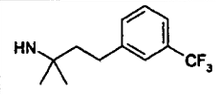
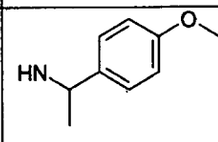
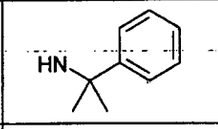
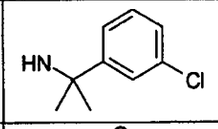
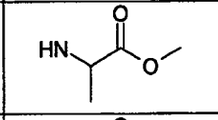
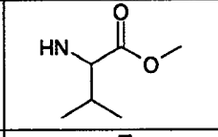
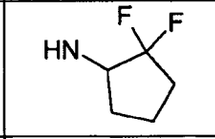
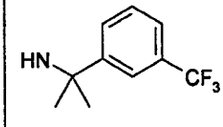
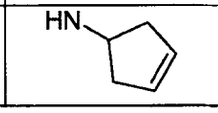
97	Br	H	H	1	Me		1.65	429.1
98	Br	H	H	1	Me		2.03	557.0
99	Br	H	H	1	Me		1.90	541.1
100	Br	H	H	1	Me		1.40	406.1
101	Br	H	H	1	Me		1.70	449.0
102	Br	H	H	1	Me		1.87	455.1
103	Br	H	H	1	Me		1.87	473.1
104	Br	H	H	1	Me		1.91	513.0
105	Br	H	H	1	Me		1.9	529.0
106	Br	H	H	1	Me		1.87	491.1
107	Br	H	H	1	Me		1.63	445.1
108	Br	H	H	1	Me		1.80	483.0

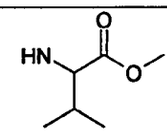
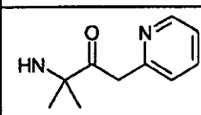
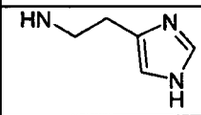
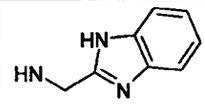
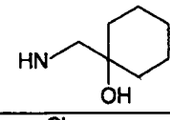
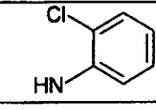
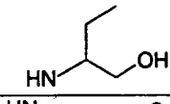
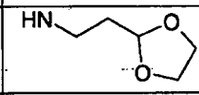
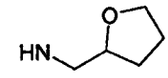
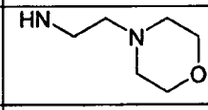
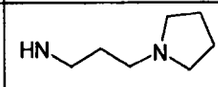
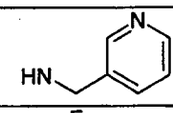
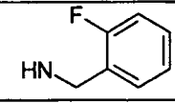
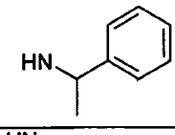
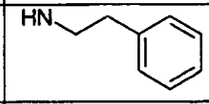
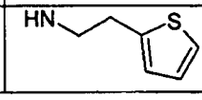
109	Br	H	H	1	Me		2.00	523.1
110	Br	H	H	1	Me		1.51	421.0
111	Br	H	H	1	Me		1.51	421.0
112	Br	H	H	1	Me		2.10	525.1
113	Br	H	H	1	Me		1.54	445.1
114	Br	H	H	1	Me		1.70	429.1
115	Br	H	H	1	Me		1.80	463.0
116	Br	H	H	1	Me		1.49	425.1
117	Br	H	H	1	Me		1.43	415.0
118	Br	H	H	1	Me		1.86	497.1
119	Br	H	H	1	Me		1.40	377.0
120	Br	H	H	1	Me		0.80	472.1
121	Br	H	H	1	Me		0.43	405.0
122	Br	H	H	1	Me		1.26	423.1

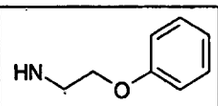
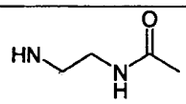
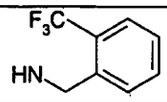
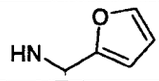
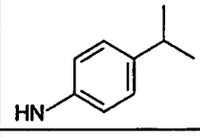
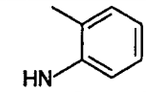
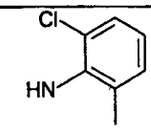
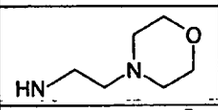
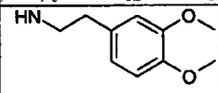
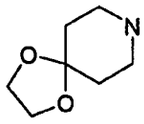
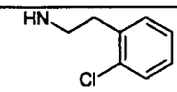
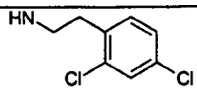
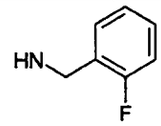
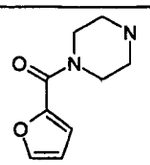
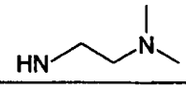
123	Br	H	H	1	Me		1.79	421.0
124	Br	H	H	1	Me		1.00	383.1
125	Br	H	H	1	Me		1.10	411.0
126	Br	H	H	1	Me		1.13	395.1
127	Br	H	H	1	Me		0.50	422.1
128	Br	H	H	1	Me		0.36	402.0
129	Br	H	H	1	Me		1.49	419.0
130	Br	H	H	1	Me		1.54	415.1
131	Br	H	H	1	Me		1.55	415.1
132	Br	H	H	1	Me		1.50	421.0
133	Br	H	H	1	Me		1.52	431.1
134	Br	H	H	1	Me		1.70	469.0
135	Br	H	H	1	Me		1.32	391.0
136	Br	H	H	1	Me		1.92	429.1
137	Br	H	H	1	Me		1.58	401.0
138	Br	H	H	1	Me		1.60	435.0

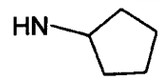
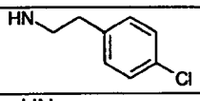
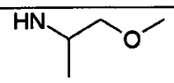
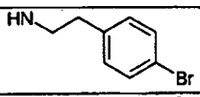
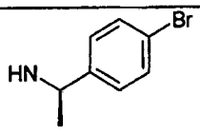
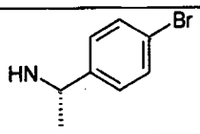
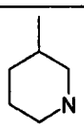
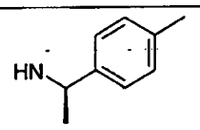
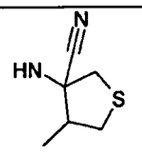
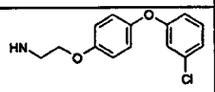
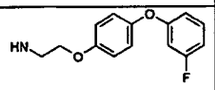
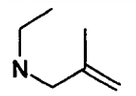
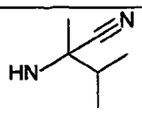
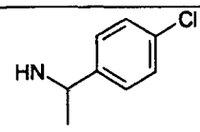
139	I	H	H	0	Et		0.68	470.1
140	I	H	H	0	Et		1.50	521.1
141	I	H	H	0	Et		1.40	483.1
142	I	H	H	0	Et		1.80	495.0
143	I	H	H	0	Et		2.00	529.0
144	I	H	H	0	Et		1.60	465.0
145	I	H	H	0	Et		1.30	520.1
146	I	H	H	0	Et		1.80	495.0
147	I	H	H	0	Et		1.30	429.1
148	I	H	H	0	Et		1.83	539.0
149	I	H	H	0	Et		1.80	539.0
150	I	H	H	0	Et		1.83	539.0
151	I	H	H	0	Et		1.79	475.1
152	I	H	H	0	Et		2.13	603.0

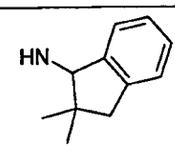
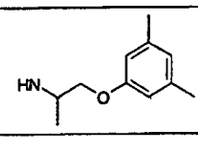
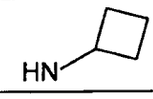
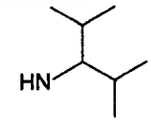
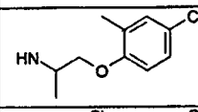
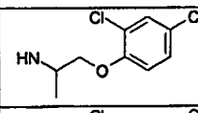
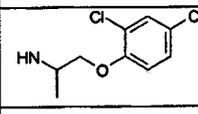
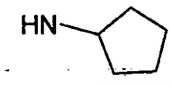
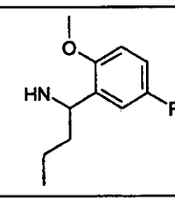
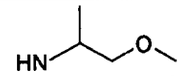
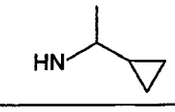
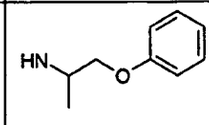
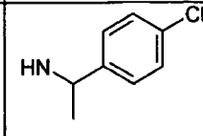
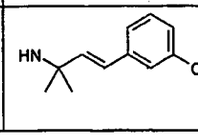
153	I	H	H	0	Et		2.00	587.1
154	I	H	H	0	Et		1.60	452.1
155	I	H	H	0	Et		1.81	495.0
156	I	H	H	0	Et		2.00	501.1
157	I	H	H	0	Et		2.00	539.1
158	I	H	H	0	Et		2.00	559.0
159	I	H	H	0	Et		1.99	559.0
160	I	H	H	0	Et		1.80	575.0
161	I	H	H	0	Et		2.00	575.0
162	I	H	H	0	Et		2.30	575.0
163	I	H	H	0	Et		1.99	537.1
164	I	H	H	0	Et		1.80	491.1

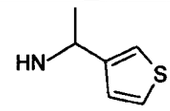
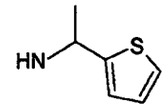
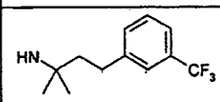
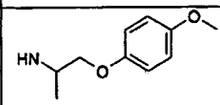
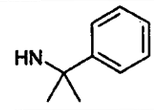
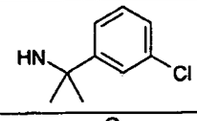
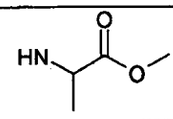
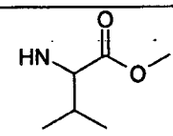
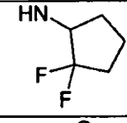
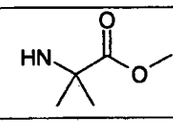
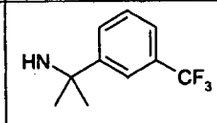
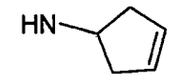
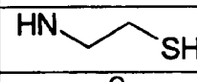
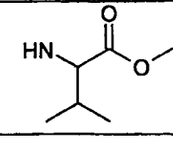
165	I	H	H	0	Et		1.90	529.1
166	I	H	H	0	Et		2.20	569.1
167	I	H	H	0	Et		1.60	467.0
168	I	H	H	0	Et		1.66	467.0
169	I	H	H	0	Et		2.20	571.1
170	I	H	H	0	Et		1.64	491.1
171	I	H	H	0	Et		1.80	475.1
172	I	H	H	0	Et		1.90	509.0
173	I	H	H	0	Et		1.40	443.0
174	I	H	H	0	Et		1.60	471.1
175	I	H	H	0	Et		1.60	461.0
176	I	H	H	0	Et		1.99	543.1
177	I	H	H	0	Et		1.50	423.0

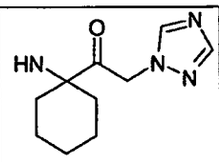
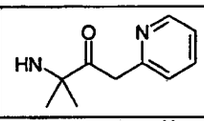
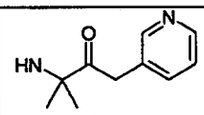
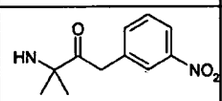
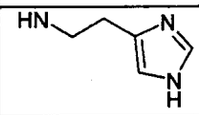
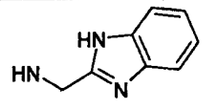
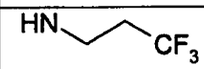
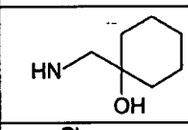
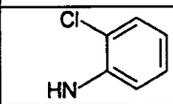
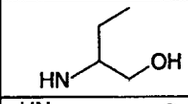
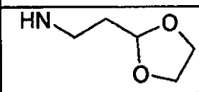
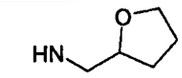
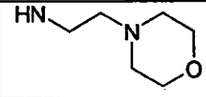
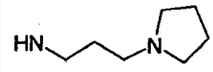
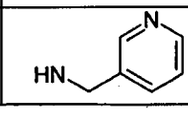
178	I	H	H	0	Et		1.60	471.1
179	I	H	H	0	Et		0.98	518.1
180	I	H	H	0	Et		0.70	451.1
181	I	H	H	0	Et		0.87	487.1
182	I	H	H	0	Et		1.40	469.1
183	I	H	H	0	Et		2.00	467.0
184	I	H	H	0	Et		1.17	429.1
185	I	H	H	0	Et		1.27	457.1
186	I	H	H	0	Et		1.30	441.1
187	I	H	H	0	Et		0.73	470.1
188	I	H	H	0	Et		0.73	468.1
189	I	H	H	0	Et		0.77	448.0
190	I	H	H	0	Et		1.64	465.0
191	I	H	H	0	Et		1.68	461.1
192	I	H	H	0	Et		1.69	461.1
193	I	H	H	0	Et		1.60	467.0

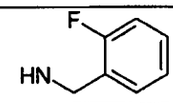
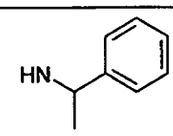
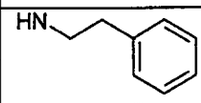
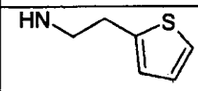
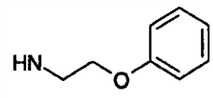
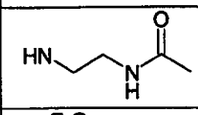
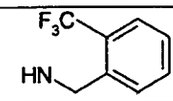
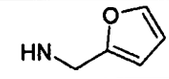
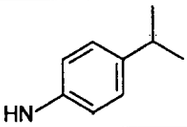
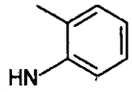
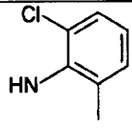
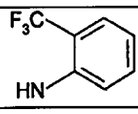
194	I	H	H	0	Et		1.60	477.1
195	I	H	H	0	Et		0.95	442.1
196	I	H	H	0	Et		1.80	515.0
197	I	H	H	0	Et		1.50	437.0
198	I	H	H	0	Et		2.05	475.1
199	I	H	H	0	Et		1.73	447.0
200	I	H	H	0	Et		1.70	481.0
201	Br	H	H	0	Et		0.50	422.1
202	Br	H	H	0	Et		1.60	473.1
203	Br	H	H	0	Et		1.40	435.1
204	Br	H	H	0	Et		1.80	447.0
205	Br	H	H	0	Et		2.00	481.0
206	Br	H	H	0	Et		1.70	417.1
207	Br	H	H	0	Et		1.40	472.1
208	Br	H	H	0	Et		0.60	380.1

209	Br	H	H	0	Et		1.60	377.1
210	Br	H	H	0	Et		1.80	447.0
211	Br	H	H	0	Et		1.40	381.1
212	Br	H	H	0	Et		1.90	491.0
213	Br	H	H	0	Et		1.90	491.0
214	Br	H	H	0	Et		1.90	491.0
215	Br	H	H	0	Et		1.70	391.1
216	Br	H	H	0	Et		1.50	375.1
217	Br	H	H	0	Et		1.80	427.1
218	Br	H	H	0	Et		1.60	434.0
219	Br	H	H	0	Et		2.20	555.1
220	Br	H	H	0	Et		2.10	539.1
221	Br	H	H	0	Et		1.80	391.1
222	Br	H	H	0	Et		1.60	404.1
223	Br	H	H	0	Et		1.80	447.0

224	Br	H	H	0	Et		2.00	453.1
225	Br	H	H	0	Et		2.00	471.1
226	Br	H	H	0	Et		1.50	363.1
227	Br	H	H	0	Et		1.90	407.1
228	Br	H	H	0	Et		2.00	491.1
229	Br	H	H	0	Et		2.00	511.0
230	Br	H	H	0	Et		2.10	511.0
231	Br	H	H	0	Et		1.60	377.1
232	Br	H	H	0	Et		2.00	489.1
233	Br	H	H	0	Et		1.40	381.1
234	Br	H	H	0	Et		1.60	377.1
235	Br	H	H	0	Et		1.80	443.1
236	Br	H	H	0	Et		1.90	481.1
237	Br	H	H	0	Et		2.20	521.1

238	Br	H	H	0	Et		1.70	419.0
239	Br	H	H	0	Et		1.70	419.0
240	Br	H	H	0	Et		2.20	523.1
241	Br	H	H	0	Et		1.70	443.1
242	Br	H	H	0	Et		1.90	427.1
243	Br	H	H	0	Et		2.00	461.1
244	Br	H	H	0	Et		1.40	395.1
245	Br	H	H	0	Et		1.70	423.1
246	Br	H	H	0	Et		1.60	413.1
247	Br	H	H	0	Et		1.50	409.1
248	Br	H	H	0	Et		2.00	495.1
249	Br	H	H	0	Et		1.60	375.1
250	Br	H	H	0	Et		2.00	369.0
251	Br	H	H	0	Et		1.70	423.1

252	Br	H	H	0	Et		1.50	500.1
253	Br	H	H	0	Et		1.00	470.1
254	Br	H	H	0	Et		0.90	470.1
255	Br	H	H	0	Et		1.80	514.1
256	Br	H	H	0	Et		0.50	403.1
257	Br	H	H	0	Et		0.80	439.1
258	Br	H	H	0	Et		1.60	405.0
259	Br	H	H	0	Et		1.50	421.1
260	Br	H	H	0	Et		2.00	419.0
261	Br	H	H	0	Et		1.20	381.1
262	Br	H	H	0	Et		1.30	409.1
263	Br	H	H	0	Et		1.40	393.1
264	Br	H	H	0	Et		0.60	422.1
265	Br	H	H	0	Et		0.60	420.1
266	Br	H	H	0	Et		0.70	400.1

267	Br	H	H	0	Et		1.70	417.1
268	Br	H	H	0	Et		1.70	413.1
269	Br	H	H	0	Et		1.70	413.1
270	Br	H	H	0	Et		1.70	419.0
271	Br	H	H	0	Et		1.70	429.1
272	Br	H	H	0	Et		1.00	394.1
273	Br	H	H	0	Et		1.90	467.1
274	Br	H	H	0	Et		1.50	389.0
275	Br	H	H	0	Et		2.10	427.1
276	Br	H	H	0	Et		1.80	399.1
277	Br	H	H	0	Et		1.80	433.0
278	Br	H	H	0	Et		2.00	453.0

Example 10

This Example illustrates the fungicidal properties of compounds of formula (I).

The compounds were tested in a leaf disk assay, with methods described below. The test compounds were dissolved in DMSO and diluted into water to 200 ppm. In the case

of the test on *Pythium ultimum*, they were dissolved in DMSO and diluted into water to 20 ppm.

Erysiphe graminis f.sp. tritici (wheat powdery mildew): Wheat leaf segments were placed on agar in a 24-well plate and sprayed with a solution of the test compound. After allowing to dry completely, for between 12 and 24 hours, the leaf disks were inoculated with a spore suspension of the fungus. After appropriate incubation the activity of a compound was assessed four days after inoculation as preventive fungicidal activity.

Puccinia recondita f.sp. tritici (wheat brown rust): Wheat leaf segments were placed on agar in a 24-well plate and sprayed with a solution of the test compound. After allowing to dry completely, for between 12 and 24 hours, the leaf disks were inoculated with a spore suspension of the fungus. After appropriate incubation the activity of a compound was assessed nine days after inoculation as preventive fungicidal activity.

Septoria nodorum (wheat glume blotch): Wheat leaf segments were placed on agar in a 24-well plate and sprayed with a solution of the test compound. After allowing to dry completely, for between 12 and 24 hours, the leaf disks were inoculated with a spore suspension of the fungus. After appropriate incubation the activity of a compound was assessed four days after inoculation as preventive fungicidal activity.

Pyrenophora teres (barley net blotch): Barley leaf segments were placed on agar in a 24-well plate and sprayed with a solution of the test compound. After allowing to dry completely, for between 12 and 24 hours, the leaf disks were inoculated with a spore suspension of the fungus. After appropriate incubation the activity of a compound was assessed four days after inoculation as preventive fungicidal activity.

Pyricularia oryzae (rice blast): Rice leaf segments were placed on agar in a 24-well plate and sprayed with a solution of the test compound. After allowing to dry completely, for between 12 and 24 hours, the leaf disks were inoculated with a spore suspension of the fungus. After appropriate incubation the activity of a compound was assessed four days after inoculation as preventive fungicidal activity.

Botrytis cinerea (grey mould): Bean leaf disks were placed on agar in a 24-well plate and sprayed with a solution of the test compound. After allowing to dry completely, for between 12 and 24 hours, the leaf disks were inoculated with a spore suspension of the

fungus. After appropriate incubation the activity of a compound was assessed four days after inoculation as preventive fungicidal activity.

Phytophthora infestans (late blight of potato on tomato): Tomato leaf disks were placed on water agar in a 24-well plate and sprayed with a solution of the test compound. After allowing to dry completely, for between 12 and 24 hours, the leaf disks were inoculated with a spore suspension of the fungus. After appropriate incubation the activity of a compound was assessed four days after inoculation as preventive fungicidal activity.

Plasmopara viticola (downy mildew of grapevine): Grapevine leaf disks were placed on agar in a 24-well plate and sprayed a solution of the test compound. After allowing to dry completely, for between 12 and 24 hours, the leaf disks were inoculated with a spore suspension of the fungus. After appropriate incubation the activity of a compound was assessed seven days after inoculation as preventive fungicidal activity.

Septoria tritici (leaf blotch): Conidia of the fungus from cryogenic storage were directly mixed into nutrient broth (PDB potato dextrose broth). After placing a (DMSO) solution of the test compounds into a microtiter plate (96-well format) the nutrient broth containing the fungal spores was added. The test plates were incubated at 24 C and the inhibition of growth was determined photometrically after 72 hrs.

Fusarium culmorum (root rot): Conidia of the fungus from cryogenic storage were directly mixed into nutrient broth (PDB potato dextrose broth). After placing a (DMSO) solution of the test compounds into a microtiter plate (96-well format) the nutrient broth containing the fungal spores was added. The test plates were incubated at 24 C and the inhibition of growth was determined photometrically after 48 hrs.

Pythium ultimum (Damping off): Mycelial fragments of the fungus, prepared from a fresh liquid culture, were mixed into potato dextrose broth. A solution of the test compound in dimethyl sulphoxide was diluted with water to 20ppm then placed into a 96-well microtiter plate and the nutrient broth containing the fungal spores was added. The test plate was incubated at 24°C and the inhibition of growth was determined photometrically after 48 hours.

The following compounds (number of compound first, followed by table number in brackets) gave at least 60% control of the following fungal infection at 200ppm:

Plasmopara viticola, compounds, 12 (95), 12 (99), 12 (156), 12 (159), 38 (154), 47 (91), 47 (99), 47 (118), 47 (156), 52 (90), 52 (118), 52 (156), 60 (154), 85 (118), 85 (158), 34 (161), 25 (161), 23 (161), 16(161), 11(161), 8(161), 7(161), 6(161), 5(161), 2(161), 1(161), 78(161), 77(161), 74(161), 72(161), 71(161), 70(161), 67(161), 65(161), 47(161), 44(161), 42(161), 32(162), 64(162), 90(162), 91(162), 115(162), 177(162), 222(162), 247(162).

Phytophthora infestans, compounds, 12 (156), 12 (158), 12 (159), 47 (154), 47 (156), 52 (118), 34(161), 25(161), 6(161), 2(161), 78(161), 77(161), 76(161), 75(161), 67(161), 50(161), 48(161), 44(161), 32(162), 122(162), 179(162), 189(162).

Botrytis cinerea, compounds, 24(161), 8(161), 6(161), 5(161), 78(161), 73(161), 72(161), 60(161), 57(161), 56(161), 54(161), 53(161), 51(161), 49(161), 48(161), 47(161), 46(161), 41(161), 81(161), 4(162), 150(162), 155(162), 169(162), 174(162), 176(162), 177(162), 185(162), 246(162).

Pyrenophora teres, compounds, 77(161), 76(161), 67(161), 51(161), 47(161).

Erysiphe graminis f.sp. tritici, 12 (91), 12 (94), 12 (95), 12 (99), 12 (118), 12 (119), 12 (154), 12 (155), 12 (156), 12 (159), 39 (90), 39 (94), 47 (90),47 (91), 47 (94), 47 (99), 47 (118), 47 (155), 47 (156), 52 (91), 52 (94), 52 (99), 52 (118), 52 (154), 52 (155), 52 (158), 85 (118), 264 (158), 275 (158), 290 (154), 35(161), 34(161), 33(161), 31(161), 30(161), 29(161), 27(161), 26(161), 25(161), 24(161), 23(161), 22(161), 11(161), 10(161), 8(161), 7(161), 6(161), 5(161), 4(161), 3(161), 2(161), 1(161), 77(161), 76(161), 74(161), 73(161), 72(161), 71(161), 70(161), 69(161), 68(161), 67(161), 65(161), 64(161), 62(161), 61(161), 60(161), 59(161), 58(161), 57(161), 56(161), 55(161), 54(161), 53(161), 52(161), 51(161), 50(161), 49(161), 48(161), 47(161), 46(161), 45(161), 44(161), 43(161), 79(161), 80(161), 2(162), 3(162), 16(162), 25(162), 32(162), 33(162), 46(162), 64(162), 77(162), 91(162), 147(162), 154(162), 170(162), 177(162), 183(162), 185(162), 189(162), 226(162).

Pyricularia oryzae, compounds 12 (159), 287 (155); 26(161), 25(161), 24(161), 23(161), 8(161), 6(161), 77(161), 76(161), 67(161), 51(161), 47(161), 109(162), 110(162), 117(162), 138(162), 177(162).

Puccinia recondita f.sp. tritici, compounds 47 (94), 47 (118), 52 (118), 85 (158), 23(161), 11(161), 6(161), 74(161), 72(161), 71(161), 67(161), 58(161), 54(161), 16(162).

Septoria nodorum, compounds, 12 (119), 12 (159), 47 (91), 47 (94), 47 (99), 47 (118), 47 (156), 85 (118), 26(161), 25(161), 23(161), 11(161), 77(161), 74(161), 73(161), 72(161), 71(161), 67(161), 54(161), 48(161), 47(161), 46(161), 16(162), 32(162), 107(162), 183(162), 190(162), 265(162).

Septoria tritici, compounds, 12 (90), 12 (91), 12 (94), 12 (99), 12 (103), 12 (118), 12 (119), 12 (155), 12 (156), 12 (159), 38 (158), 39 (94), 39 (118), 47 (91), 47 (99), 47 (118), 47 (155), 52 (91), 52 (94), 52 (99), 52 (118), 85 (118), 85 (158), 95 (155), 181 (154), 181 (155), 189 (155), 189 (158), 190 (155), 275 (158), 290 (154), 35(161), 33(161), 32(161), 31(161), 29(161), 27(161), 26(161), 25(161), 24(161), 23(161), 22(161), 11(161), 10(161), 9(161), 8(161), 6(161), 5(161), 3(161), 2(161), 1(161), 78(161), 77(161), 76(161), 74(161), 73(161), 72(161), 71(161), 70(161), 68(161), 67(161),62(161), 60(161), 59(161), 58(161), 57(161), 56(161), 55(161), 54(161), 53(161), 52(161), 51(161), 50(161), 49(161), 48(161), 47(161), 46(161), 81(161), 1(162), 2(162), 3(162), 4(162), 5(162), 6(162), 7(162), 8(162), 9(162), 10(162), 11(162), 13(162), 16(162), 17(162), 18(162), 21(162), 23(162), 25(162), 26(162), 32(162), 33(162), 34(162), 36(162), 46(162), 49(162), 52(162), 54(162), 56(162), 59(162), 64(162), 65(162), 67(162), 87(162), 92(162), 101(162), 114(162), 115(162), 130(162), 147(162), 154(162), 155(162), 167(162), 171(162), 177(162), 183(162), 191(162), 197(162), 199(162), 226(162), 234(162), 268(162).

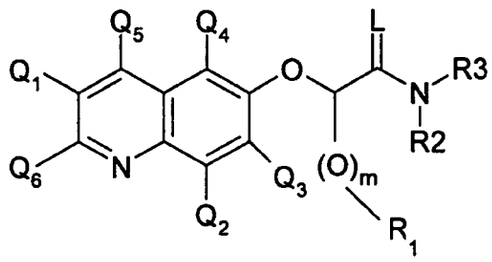
Fusarium culmorum, compounds, 12 (91), 12 (95), 12 (103), 12 (118), 12 (119), 12 (155), 12 (159), 39 (118), 52 (158), 275 (158), 27(161), 26(161), 25(161), 22(161), 8(161), 1(161), 73(161), 53(161), 48(161), 46(161), 43(161), 3(162), 32(162).

The following compounds (number of compound first, followed by table number in brackets) gave at least 60% control of the following fungal infection at 20ppm:

Pythium ultimum, compounds 12 (118), 12 (158), 12 (159), 39 (118), 39 (158), 47 (118), 52 (118), 34(161), 30(161), 25(161), 1(161), 78(161), 77(161), 76(161), 75(161), 70(161), 50(161), 49(161), 48(161), 43(161), 37(161), 36(161), 23(162), 32(162), 54(162), 64(162), 65(162), 147(162), 177(162), 179(162), 181(162), 185(162), 189(162), 195(162), 253(162), 254(162).

CLAIMS

1. A compound of the general formula I



(I)

wherein

Q^1, Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6 independently of each other, are hydrogen halogen, cyano, nitro, azido, optionally substituted C_{1-6} alkyl, optionally substituted C_{3-6} cycloalkyl, optionally substituted C_{3-6} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, optionally substituted C_{2-6} alkenyl, optionally substituted C_{2-6} alkynyl, optionally substituted C_{1-6} alkoxy, optionally substituted C_{2-6} alkenyloxy, optionally substituted C_{2-6} alkynyloxy, optionally substituted aryl, optionally substituted aryloxy, optionally substituted aryl(C_{1-6})alkyl, optionally substituted aryl(C_{1-6})alkoxy, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heteroaryloxy, optionally substituted heteroaryl(C_{1-6})alkyl, optionally substituted heteroaryl(C_{1-6})alkoxy, $-SF_5$ or $-S(O)_u(C_{1-6})$alkyl, wherein u is 0, 1 or 2 and the alkyl group is optionally substituted with halogen, or

Q^1, Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6, independently of each other, are $-OSO_2(C_{1-4})$alkyl, wherein the alkyl group is optionally substituted with halogen, or

Q^1, Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6, independently of each other, are $-CONR^uR^v$, $-COR^u$, $-CO_2R^u$, $-CR^u=NR^v$, $-NR^uR^v$, $-NR^uCOR^v$, $-NR^uCO_2R^v$, $-SO_2NR^uR^v$ or $-NR^uSO_2R^w$, wherein R^w is optionally substituted C_{1-6} alkyl and R^u and R^v independently of each other, are hydrogen or C_{1-6} alkyl optionally substituted with halogen, or, in the case of $-CONR^uR^v$ or $-SO_2NR^uR^v$, R^uR^v may join to form a 5- or 6-membered carbocyclic or heterocyclic ring containing a heteroatom selected from sulfur, oxygen and NR^o, wherein R^o is hydrogen or optionally substituted C_{1-6}alkyl, or, in the case of $-CR^u=NR^v$, R^v is hydrogen, hydroxyl, or C_{1-6}alkoxy,

R^1 is C_{1-4} alkyl, C_{3-5} cycloalkyl, C_{2-4} alkenyl or C_{2-4} alkynyl in which the alkyl, alkenyl and alkynyl groups are optionally substituted on their terminal carbon atom with one, two or three halogen atoms, with a cyano group, with a C_{1-4} alkylcarbonyl group, with a C_{1-4} alkoxycarbonyl group or with a hydroxy group, or R_1 is alkoxyalkyl, alkylthioalkyl,

alkylsulphinylalkyl or alkylsulphonylalkyl in which the total number of carbon atoms is 2 or 3, or R_1 is a straight-chain C_{1-4} alkoxy group;

R^2 is hydrogen, C_{1-8} alkyl, C_{3-4} cycloalkyl, C_{2-8} alkenyl, cyano(C_{1-4})alkyl, C_{1-4} alkoxy(C_{1-4})-alkyl, C_{1-4} alkoxy(C_{1-4})alkoxy(C_{1-4})alkyl or benzyloxy(C_{1-4})alkyl, wherein the phenyl ring is optionally substituted with C_{1-4} alkoxy,

R^3 is $-(CR^aR^b)_p(CR^cR^d)_q(X)_r(CR^eR^f)_sR^4$, wherein

R^a, R^b, R^c, R^d, R^e and R^f, independently of each other, are hydrogen, C_{1-4} alkyl, halogen, cyano, hydroxy, C_{1-4} alkoxy or C_{1-4} alkoxycarbonyl, or

R^aR^b, R^cR^d or R^eR^f may join to form a 3 to 8 membered carbocyclic or heterocyclic ring containing a heteroatom selected from sulfur, oxygen and NR^o, wherein R^o is hydrogen or optionally substituted C_{1-6}alkyl,

X is (CO), (CO)O, O(CO), O, $S(O)_t$, wherein t is 0, 1 or 2, or X is NH or N(C_{1-6})alkyl,

p, r and s, independently of each other, are 0 or 1,

q is 0, 1 or 2,

R^4 is optionally substituted C_{1-6} alkyl, optionally substituted C_{2-6} alkenyl or

when at least one of p, q, r and s is 1, R^4 is $-CH_2-C\equiv C-R^5$, wherein

R^5 is hydrogen, C_{1-8} alkyl optionally substituted with halogen, hydroxy, C_{1-6} alkoxy, C_{1-3} alkoxy(C_{1-3})alkoxy, cyano, C_{1-4} alkylcarbonyloxy, aminocarbonyloxy, mono- or di(C_{1-4})-alkylaminocarbonyloxy, tri(C_{1-4})alkylsilyloxy or $-S(O)_g(C_{1-6})$alkyl, wherein g is 0, 1 or 2, or

R^5 is C_{3-6} cycloalkyl optionally substituted with halogen, hydroxy, C_{1-6} alkoxy, C_{1-3} alkoxy-(C_{1-3})alkoxy, cyano, C_{1-4} alkylcarbonyloxy, aminocarbonyloxy, mono- or di(C_{1-4})alkyl-aminocarbonyloxy, tri(C_{1-4})alkylsilyloxy or $-S(O)_g(C_{1-6})$alkyl, wherein g is 0, 1 or 2, or

R^5 is C_{3-6} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, wherein the alkyl and/or cycloalkyl moiety is optionally substituted with halogen, hydroxy, C_{1-6} alkoxy, C_{1-3} alkoxy(C_{1-3})alkoxy, cyano, C_{1-4} alkyl-carbonyloxy, aminocarbonyloxy, mono- or di(C_{1-4})alkylaminocarbonyloxy, tri(C_{1-4})alkyl-silyloxy or $-S(O)_g(C_{1-6})$alkyl, wherein g is 0, 1 or 2, or

R^5 is optionally substituted aryl, optionally substituted aryl(C_{1-4})alkyl, optionally substituted aryloxy(C_{1-4})alkyl, optionally substituted heteroaryl or optionally substituted heteroaryl(C_{1-4})alkyl or optionally substituted heteroaryloxy(C_{1-4})alkyl, or

R^4 is optionally substituted C_{3-6} cycloalkyl, optionally substituted C_{5-6} cycloalkenyl, optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl or an optionally substituted 5- to 8-membered ring optionally containing a heteroatom selected from sulfur, oxygen or NR^0, wherein R^o is hydrogen or optionally substituted C_{1-6}alkyl, or

R^2 and R^3 may join to form a 5- or 6-membered ring optionally substituted with halogen, C_{1-4} alkyl, mono- or di-(C_{1-4})alkylaminocarbonyl, and optionally containing a heteroatom selected from sulphur, oxygen and NR^{00}, wherein R^{00} is C_{1-4} alkyl optionally substituted with halogen, C_{1-6} alkoxy or cyano, or R^{00} is phenyl optionally substituted with nitro, C_{1-4}

alkyl, halo(C_{1-4})alkyl, C_{1-4} alkylcarbonyl or heteroaryl, or R^2 and R^3 may join to form an optionally substituted 6,6-membered bicycle,
L is sulfur or oxygen, and
m is 0 or 1; and
salts and N-oxides of the compounds of the formula I.

2. Compounds according to claim 1, wherein Q^2 is hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen, Q^1, Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6 are as defined in claim 1.

3. Compounds according to claim 2, wherein Q^2 is methyl or ethyl.

4. Compounds according to claim 1, wherein Q^1 is halogen, aryl or heteroaryl, Q^2 is hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen and Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6 are as defined in claim 1.

5. Compounds according to claim 4, wherein Q^2 is methyl or ethyl.

6. Compounds according to claim 1, wherein Q^1 is aryl, Q^2 is hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen and Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6 is as defined in claim 1.

7. Compounds according to claim 6, wherein Q^2 is methyl or ethyl.

8. Compounds according to claim 1, wherein Q^1 is heteroaryl, Q^2 is hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen and Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6 is as defined in claim 1.

9. Compounds according to claim 8, wherein Q^2 is methyl or ethyl.

10. Compounds according to claim 1, wherein Q^1 and Q^3, independently of each other, are hydrogen or halogen and Q^2, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen.

11. Compounds according to claim 10, wherein Q^1 and Q^3, independently of each other, are fluoro, chloro, bromo or iodo.

12. Compounds according to claim 10, wherein Q^1 is chloro, bromo or iodo, and Q^3 is fluoro or chloro.

13. Compounds according to claim 1, wherein Q^1 is aryl or heteroaryl, Q^2, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen and Q^3 is hydrogen or halogen.

14. Compounds according to claim 13, wherein Q^1 is thiophen-2-yl, thiophen-3-yl, halo, or halo or alkoxy substituted phenyl, or halo or alkoxy substituted pyridyl.

15. Compounds according to claim 13, wherein Q^3 is hydrogen, fluoro or chloro.

16. Compounds according to claim 1, wherein Q^1, Q^2, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen and Q^3 is hydrogen, halogen or optionally substituted alkyl.

17. Compounds according to claim 16, wherein Q^3 is hydrogen, fluoro or chloro.

18. Compounds according to claim 1, wherein Q^1 is halogen, Q^2, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen and Q^3 is hydrogen or optionally substituted alkyl.

19. Compounds according to claim 18, wherein Q^1 is chloro, bromo or iodo.

20. Compounds according to claim 18, wherein Q^3 is methyl.

21. Compounds according to claim 1, wherein Q^1 and Q^2 are halogen and Q^3 is hydrogen or optionally substituted alkyl and Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen.

22. Compounds according to claim 21, wherein Q^1 is chloro, bromo or iodo.

23. Compounds according to claim 21, wherein Q^3 is methyl.

24. Compounds according to claim 1, wherein Q^1 is bromo and Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6, independently of each other, are hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen.

25. Compounds according to claim 24, wherein Q^2 is halogen and Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen.

26. Compounds according to claim 24, wherein Q^2 is methyl or ethyl and Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen.

27. Compounds according to claim 24, wherein Q^3 is fluoro or chloro and Q^2, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen.

28. Compounds according to claim 1, wherein Q^1 is iodo and Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6, independently of each other, are hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen.

29. Compounds according to claim 28, wherein Q^2 is halogen and Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen.

30. Compounds according to claim 28, wherein Q^2 is methyl or ethyl and Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen.

31. Compounds according to claim 28, wherein Q^3 is fluoro or chloro and Q^2, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen.

32. Compounds according to claim 1 wherein Q^1 is chloro and Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6, independently of each other, are hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen.

33. Compounds according to claim 32, wherein Q^2 is halogen and Q^3, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen.

34. Compounds according to claim 32, wherein Q^2 is methyl or ethyl and Q^3,Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen.

35. Compounds according to claim 32, wherein Q^3 is fluoro or chloro and Q^2, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen.

36. Compounds according to claim 1, wherein Q^1 is chloro, bromo or iodo.

37. Compounds according to claim 1, wherein Q^1 is fluoro.

38. Compounds according to claim 1, wherein Q^3 is hydrogen or halogen.

39. Compounds according to claim 38, wherein Q^3 is hydrogen, fluoro or chloro.

40. Compounds according to claim 39, wherein Q^3 is fluoro.

41. Compounds according to claim 1, wherein Q^1 is bromo, Q^2, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen and Q^3 is hydrogen, fluoro or chloro.

42. Compounds according to claim 41, wherein Q^3 is fluoro.

43. Compounds according to claim 41, wherein Q^3 is chloro.

44. Compounds according to claim 41, wherein Q^3 is hydrogen.

45. Compounds according to claim 1, wherein Q^1 is iodo, Q^2, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen and Q^3 is hydrogen, fluoro or chloro.

46. Compounds according to claim 45, wherein Q^1 is iodo, Q^2, Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen and Q^3 is fluoro.

47. Compounds according to claim 45, wherein Q^1 is iodo, Q^2,Q^4, Q^5 and Q^6 are hydrogen and Q^3 is chloro.

48. Compounds according to claim 45, wherein Q^3 is hydrogen.

49. Compounds according to claim 1, wherein Q^1 is hydrogen, halogen, optionally substituted C_{2-4} alkenyl, optionally substituted C_{2-4} alkynyl, optionally substituted aryl or optionally substituted heteroaryl.

50. Compounds according to claim 1, wherein R^1 is C_{1-4} alkyl.

51. Compounds according to claim 50, wherein R^1 is methyl or ethyl.

52. Compounds according to claim 51, wherein R^1 is methyl.

53. Compounds according to claim 51, wherein R^1 is ethyl.

54. Compounds according to claim 1, wherein R^1 is methyl or ethyl, Q^1 is hydrogen or halogen, Q^2 is hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen and Q^3 is hydrogen or halogen.

55. Compounds according to claim 54, wherein Q^1 is chloro, bromo or iodo, Q^2 is hydrogen, methyl, ethyl, chloro or bromo, and Q^3 is fluoro or bromo.

56. Compounds according to claim 1, wherein R^2 is hydrogen or methyl.

57. Compounds according to claim 56, wherein R^2 is hydrogen.

58. Compounds according to claim 1, wherein R^1 is methyl or ethyl, R^2 is hydrogen, Q^1 is hydrogen or halogen, Q^2 is hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen and Q^3 is hydrogen or halogen.

59. Compounds according to claim 58, wherein Q^1 is chloro, bromo or iodo, Q^2 is hydrogen, methyl, ethyl, chloro or bromo, and Q^3 is hydrogen, fluoro or bromo.

60. Compounds according to claim 1, wherein R^3 is tert-butyl, 1-halo-2-methylprop-2-yl, 1,1-dihalo-2-methylprop-2-yl, 1,1,1-trihalo-2-methylprop-2-yl, 1-alkoxy-2-methylprop-2-yl, 1-alkenyloxy-2-methylprop-2-yl, 1-alkynyloxy-2-methylprop-2-yl, 1-cyano-2-methyl-prop-2-yl, 1-alkoxyalkoxy-2-methyl-prop-2-yl, 1-halo-3-methylbut-3-yl, 1-alkoxy-3-methylbut-3-yl, 1-alkenyloxy-3-methylbut-3-yl, 1-alkynyloxy-3-methylbut-3-yl, 1-cyano-3-methylbut-3-yl, 2-cyanoprop-2-yl, 2-methoxycarbonylprop-2-yl, 2-(C_{1-2})alkoxycarbonylprop-2-yl or 2-methylaminocarbonylprop-2-yl, 1-alkylthio-2-methylprop-2-yl, 2-cyano-1-alkoxyprop-2-yl, 2-cyano-1-haloprop-2-yl,1-alkoxy-prop-2-yl, 1-halo-prop-2-yl, 1-cyanoalkyl-3-methylbut-3-yl, 1-haloalkyl-3-methylbut-3-yl, and R^1, R^2, Q^1, Q^2 and Q^3 are as defined in claim 1.

61. Compounds according to claim 60, wherein R^1 is methyl or ethyl, R^2 is hydrogen, Q^1 is hydrogen or halogen, Q^2 is hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen and Q^3 is hydrogen or halogen.

62. Compounds according to claim 61, wherein Q^1 is chloro, bromo or iodo, Q^2 is hydrogen, methyl, ethyl, chloro or bromo, and Q^3 is hydrogen, fluoro, chloro or bromo.

63. Compounds according to claim 60, wherein R^3 is tert-butyl, 1-halo-2-methylprop-2-yl, 1-methoxy-2-methylprop-2-yl, 1-ethoxy-2-methylprop-2-yl, 1-allyloxy-2-methylprop-2-yl, 1-(prop-2-ynyloxy)-2-methylprop-2-yl, 2-cyano-1-methoxyprop-2-yl, 2-cyano-1-haloprop-2-yl, 2-cyano-1-ethoxyprop-2-yl, 2-cyano-1-(prop-2-ynyloxy)-prop-2-yl,and R^1, R^2, Q^1, Q^2 and Q^3 are as defined in claim 1.

64. Compounds according to claims 1, wherein R^4 is C_{1-6} alkyl optionally substituted with C_{1-4}alkoxy-(C_{1-4})alkoxy(C_{1-4})alkyl, wherein the alkyl group is optionally substituted

with halo, mono- or di-(C_{1-6})alkylamino or tri(C_{1-4})alkylsilyl, or R^4 is C_{1-6} alkyl optionally substituted with benzyloxy(C_{1-4})alkyl, wherein the alkyl group is optionally substituted with halo, mono- or di-(C_{1-6})alkylamino or tri(C_{1-4})alkylsilyl, or R^4 is C_{1-6} alkyl optionally substituted with C_{2-6} alkenyloxy, C_{2-6} alkynyloxy or -S(O)$_x$(C_{1-6})alkyl, wherein x is 0, 1 or 2 and the alkyl group is optionally substituted with halo, mono- or di-(C_{1-6})alkylamino, R^4 is $-CH_2-C\equiv C-R^5$, wherein R^5 is hydrogen, C_{1-8} alkyl optionally substituted with halogen, hydroxy, C_{1-6} alkoxy, C_{1-3}alkoxy(C_{1-3})alkoxy, cyano and R^1, R^2, Q^1, Q^2 and Q^3 are as defined in claim 1.

65. Compounds according to claim 64, wherein R^1 is methyl or ethyl, R^2 is hydrogen, Q^1 is hydrogen or halogen, Q^2 is hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen and Q^3 is hydrogen or halogen.

66. Compounds according to claim 65, wherein Q^1 is chloro, bromo or iodo, Q^2 is hydrogen, methyl, ethyl, chloro or bromo, and Q^3 is hydrogen, fluoro, chloro or bromo.

67. Compounds according to claim 1, wherein the optionally substituted aryl and optionally substituted heteroaryl rings or moieties of the R_5 values are optionally substituted with halogen, cyano, nitro, azido, C_{1-6} alkyl, halo(C_{1-6})alkyl, C_{3-6} cycloalkyl, C_{3-6} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, C_{2-6} alkenyl, halo(C_{2-6})alkenyl, C_{2-6} alkynyl, halo(C_{2-6})alkynyl, C_{1-6} alkoxy, halo(C_{1-6})alkoxy, C_{2-6} alkenyloxy, halo(C_{2-6})alkenyloxy, C_{2-6} alkynyloxy, halo(C_{2-6})alkynyloxy, aryl, aryloxy, aryl(C_{1-6})alkyl, aryl(C_{1-6})alkoxy, heteroaryl, heteroaryloxy, heteroaryl(C_{1-6})alkyl, heteroaryl(C_{1-6})alkoxy, $-SF_5$, -S(O)$_g$(C_{1-4})alkyl wherein g is 0, 1 or 2 and the alkyl is optionally substituted with halo, or R^5 is optionally substituted with -OSO$_2$(C_{1-4})alkyl, wherein the alkyl group is optionally substituted with halo, or R^5 is optionally substituted with $-CONR^gR^h$, $-COR^g$, $-CO_2R^g$, $-R^{gg}=NR^h$, $-NR^gR^h$, $-NR^gCOR^h$, $-NR^gCO_2R^h$, $-SO_2NR^gR^h$ or $-NR^gSO_2R^i$, wherein R^i is C_{1-6} alkyl optionally substituted with halogen, R^{gg} is (C_{1-6})alkylene, and R^g and R^h, independently of each other, are hydrogen or C_{1-6} alkyl optionally substituted with halogen, or, in the case of $-CONR^gR^h$ or $-SO_2NR^gR^h$, R^gR^h may join to form a 5- or 6-membered carbocyclic or heterocyclic ring containing a heteroatom selected from sulphur, oxygen or NR^0, wherein R^0 is hydrogen or optionally substituted C_{1-6}alkyl and R^1, R^2, Q^1, Q^2 and Q^3 are as defined in claim 1.

68. Compounds according to claim 67, wherein R^1 is methyl or ethyl, R^2 is hydrogen, Q^1 is hydrogen or halogen, Q^2 is hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen and Q^3 is hydrogen or halogen.

69. Compounds according to claim 67, wherein Q^1 is chloro, bromo or iodo, Q^2 is hydrogen, methyl, ethyl, chloro or bromo, and Q^3 is hydrogen, fluoro, chloro or bromo.

70. Compounds according to claim 1, wherein the optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl or optionally substituted 5- to 8-membered ring R^4 is optionally substituted with halogen, cyano, nitro, azido, C_{1-6} alkyl, halo(C_{1-6})alkyl, C_{3-6} cycloalkyl, C_{3-6} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, C_{2-6} alkenyl, halo(C_{2-6})alkenyl, C_{2-6} alkynyl, halo(C_{2-6})alkynyl, C_{1-6} alkoxy, halo(C_{1-6})alkoxy, C_{2-6} alkenyloxy, halo(C_{2-6})alkenyloxy, C_{2-6} alkynyloxy, halo(C_{2-6})alkynyloxy, $-SF_5$, $-S(O)_x(C_{1-6})$alkyl, wherein x is 0, 1 or 2 and the alkyl group is optionally substituted with halo, or R^4 is optionally substituted with $-OSO_2(C_{1-4})$alkyl, wherein the alkyl group is optionally substituted with halogen, $-CONR^xR^y$, $-CON(OR^x)R^y$, $-COR^x$, $-CO_2R^x$, $-CR^x{=}NR^y$, $-NR^xR^y$, $-NR^xCOR^y$, $-NR^xCO_2R^y$, $-SO_2NR^xR^y$ or $-NR^xSO_2R^z$, wherein R^z is C_{1-8} alkyl optionally substituted with halogen and R^x and R^y, independently of each other, are hydrogen or C_{1-6} alkyl optionally substituted with halogen and R^1, R^2, Q^1, Q^2 and Q^3 are as defined in claim 1.

71. Compounds according to claim 70, wherein R^1 is methyl or ethyl, R^2 is hydrogen, Q^1 is hydrogen or halogen, Q^2 is hydrogen, C_{1-4} alkyl or halogen and Q^3 is hydrogen or halogen.

72. Compounds according to claim 71, wherein Q^1 is chloro, bromo or iodo, Q^2 is hydrogen, methyl, ethyl, chloro or bromo, and Q^3 is hydrogen, fluoro, chloro or bromo.

73. Compounds according to claim 1, wherein L is oxygen.

74. Compounds according to claim 1, wherein m is 0.

75. Compounds according to claim 1, wherein m is 1.

76. A process for preparing a compound according to claim 1 as described herein.

77. A fungicidal composition comprising a fungicidally effective amount of a compound according to claim 1 and a suitable carrier or diluent therefor.

78. A method of combating or controlling phytopathogenic fungi which comprises applying a fungicidally effective amount of a compound according to claim 1 to a plant,

to a seed of a plant, to the locus of the plant or seed or to soil or any other plant growth medium.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2008/001974

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. A01N43/42 C07D215/20 C07D401/12 C07D407/12 C07D409/12

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)
C07D A01N

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

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)
EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data, BEILSTEIN Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	DATABASE WPI Week 200146 Thomson Scientific, London, GB; AN 2001-427696 XP002486901 & JP 2001 089453 A (IHARA CHEM IND CO LTD) 3 April 2001 (2001-04-03) abstract	1-78
X	WO 2004/047538 A (SYNGENTA LTD [GB]; CROWLEY PATRICK JELF [GB]; SALMON ROGER [GB]) 10 June 2004 (2004-06-10) claims 1,12 examples	1-78
A	WO 2006/058700 A (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; SYNGENTA LTD [GB]; SALMON ROGER [GB];) 8 June 2006 (2006-06-08) claims 1,33	1-78

☐ 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 document 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	Date of mailing of the international search report
4 July 2008	18/07/2008

Name and mailing address of the ISA/	Authorized officer
European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Bérillon, Laurent

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2008/001974

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
JP 2001089453 A	03-04-2001	NONE	
WO 2004047538 A	10-06-2004	AT 376357 T	15-11-2007
		AU 2003276400 A1	18-06-2004
		BR 0316496 A	11-10-2005
		CA 2502183 A1	10-06-2004
		CN 1717175 A	04-01-2006
		EP 1567010 A1	31-08-2005
		ES 2297274 T3	01-05-2008
		JP 2006507339 T	02-03-2006
		KR 20050086882 A	30-08-2005
		MX PA05005453 A	26-08-2005
		US 2006019973 A1	26-01-2006
		US 2007072884 A1	29-03-2007
		ZA 200502930 A	22-02-2006
WO 2006058700 A	08-06-2006	AR 052255 A1	07-03-2007
		AU 2005311492 A1	08-06-2006
		CA 2583022 A1	08-06-2006
		CN 101115748 A	30-01-2008
		EP 1817309 A1	15-08-2007
		KR 20070085680 A	27-08-2007

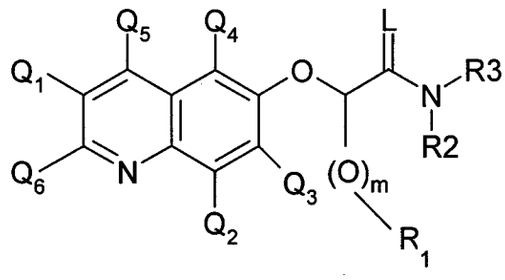
DERIVADOS DE QUINOLINA COMO FUNGICIDAS

Esta invención se relaciona con nuevas amidas de ácido quinoliniloxialcanoico; con procesos para su preparación, con composiciones que contienen dichos compuestos y con métodos para su uso con el fin de combatir hongos, en especial, infecciones fúngicas de plantas.

Ciertos derivados de amida de ácido quinoliniloxialcanoico y su uso como bactericidas agrícolas y hortícolas se describen, por ejemplo, en los documentos WO 04/047538 y JP 2001-89453.

La presente invención se relaciona con la provisión de amidas de ácido quinolina-6-iloxialcanoico sustituidas particulares, para el uso, principalmente, como fungicidas de plantas.

Por lo tanto, de acuerdo con la presente invención, se proporciona un compuesto de la fórmula general I:



(I),

donde:

Q^1, Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6, de manera independiente entre sí, son hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, azido, alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido, cicloalquilo C_{3-6} opcionalmente sustituido, cicloalquiloC_{3-6}alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido, alquenilo C_{2-6} opcionalmente sustituido, alquinilo C_{2-6} opcionalmente sustituido, alcoxi C_{1-6} opcionalmente sustituido, alqueniloxi C_{2-6} opcionalmente sustituido, alquiniloxi C_{2-6} opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, ariloxi opcionalmente sustituido, aril-alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, aril-

alcoxi(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, heteroariloxi opcionalmente sustituido, heteroaril-alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, heteroaril-alcoxi(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, $-SF_5$ o $-S(O)_u$alquilo(C_{1-6}), donde u es 0; 1 ó 2, y el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halógeno; o

Q^1, Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6, de modo independiente entre sí, son $-OSO_2$alquilo(C_{1-4}), donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halógeno; o

Q^1, Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6, de manera independiente entre sí, son $-CONR^uR^v$, $-COR^u$, $-CO_2R^u$, $-CR^u=NR^v$, $-NR^uR^v$, $-NR^uCOR^v$, $-NR^uCO_2R^v$, $-SO_2NR^uR^v$ o $-NR^uSO_2R^w$, donde R^w es alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido, y R^u y R^v, de modo independiente entre sí, son hidrógeno o alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido con halógeno; o, en el caso de $-CONR^uR^v$ o $-SO_2NR^uR^v$, R^uR^v pueden unirse para formar un anillo heterocíclico o carbocíclico de 5 ó 6 miembros, que contiene un heteroátomo seleccionado de azufre, oxígeno y NR^o, donde R^o es hidrógeno o alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido; o, en el caso de $-CR^u=NR^v$, R^v es hidrógeno, hidroxilo, o alcoxi C_{1-6};

R^1 es alquilo C_{1-4}, cicloalquilo C_{3-5}, alquenilo C_{2-4} o alquinilo C_{2-4} donde los grupos alquilo, alquenilo y alquinilo están opcionalmente sustituidos en su átomo de carbono terminal, con uno, dos o tres átomos de halógeno, con un grupo ciano, con un grupo alquilcarbonilo C_{1-4}, con un grupo alcoxicarbonilo C_{1-4} o con un grupo hidroxi; o R_1 es alcoxialquilo, alquiltioalquilo, alquilsulfinilalquilo o alquilsulfonilalquilo donde el número total de átomos de carbono es 2 ó 3; o R_1 es un grupo alcoxi C_{1-4} de cadena recta;

R^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-8}, cicloalquilo C_{3-4}, alquenilo C_{2-8}, ciano-alquilo(C_{1-4}), alcoxiC_{1-4}-alquilo(C_{1-4}), alcoxiC_{1-4}alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-4}) o benciloxi-alquilo(C_{1-4}), donde el anillo fenilo está opcionalmente sustituido con alcoxi C_{1-4};

R^3 es $-(CR^aR^b)_p(CR^cR^d)_q(X)_r(CR^eR^f)_sR^4$, donde:

R^a, R^b, R^c, R^d, R^e y R^f, de manera independiente entre sí, son hidrógeno, alquilo C_{1-4}, halógeno, ciano, hidroxi, alcoxi C_{1-4} o alcoxicarbonilo C_{1-4} ; o

R^aR^b, R^cR^d o R^eR^f pueden unirse para formar un anillo heterocíclico o carbocíclico de 3 a 8 miembros que contiene un heteroátomo seleccionado de azufre, oxígeno y NR^o, donde R^o es hidrógeno o alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido;

X es (CO), (CO)O, O(CO), O, $S(O)_t$, donde t es 0; 1 ó 2; o X es NH o Nalquilo(C_{1-6});

p, r y s, independientemente entre sí, son 0 ó 1;

q es 0; 1 ó 2;

R^4 es alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido, alquenilo C_{2-6} opcionalmente sustituido; o

cuando por lo menos uno de p, q, r y s es 1, R^4 es $-CH_2-C\equiv C-R^5$, donde

R^5 es hidrógeno, alquilo C_{1-8} opcionalmente sustituido con halógeno, hidroxi, alcoxi C_{1-6}, alcoxiC_{1-3}alcoxi(C_{1-3}), ciano, alquilcarboniloxi C_{1-4}, aminocarboniloxi, mono- o di-alquilo(C_{1-4})aminocarboniloxi, tri-alquilo(C_{1-4})sililoxi o -$S(O)_g$alquilo(C_{1-6}), donde g es 0; 1 ó 2; o R^5 es cicloalquilo C_{3-6} opcionalmente sustituido con halógeno, hidroxi, alcoxi C_{1-6}, alcoxiC_{1-3}alcoxi(C_{1-3}), ciano, alquilcarboniloxi C_{1-4}, aminocarboniloxi, mono- o di-alquilo(C_{1-4})aminocarboniloxi, tri-alquilo(C_{1-4})sililoxi o -$S(O)_g$alquilo(C_{1-6}), donde g es 0; 1 ó 2; o

R^5 es cicloalquiloC_{3-6}alquilo(C_{1-4}), donde la porción alquilo o cicloalquilo está opcionalmente sustituida con halógeno, hidroxi, alcoxi C_{1-6}, alcoxiC_{1-3}alcoxi(C_{1-3}), ciano, alquiloC_{1-4}carboniloxi, aminocarboniloxi, mono- o di-alquilo(C_{1-4})aminocarboniloxi, tri-alquilo(C_{1-4})sililoxi o -$S(O)_g$alquilo(C_{1-6}), donde g es 0; 1 ó 2; o

R^5 es arilo opcionalmente sustituido, aril-alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido, ariloxi-alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o heteroaril-alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido, o heteroariloxi-alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido; o

R^4 es cicloalquilo C_{3-6} opcionalmente sustituido, cicloalquenilo C_{5-6} opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, o un anillo de 5 a 8 miembros opcionalmente sustituido, que en forma opcional, contiene un heteroátomo seleccionado de azufre, oxígeno o NR^0, donde R^o es hidrógeno o alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido; o

R^2 y R^3 pueden unirse para formar un anillo de 5 ó 6- miembros, opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C_{1-4}, mono- o di-alquilo(C_{1-4})aminocarbonilo, y que, en forma opcional, contiene un heteroátomo seleccionado de azufre, oxígeno y NR^{00}, donde R^{00} es alquilo C_{1-4} opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi C_{1-6} o ciano; o R^{00} es fenilo opcionalmente sustituido con nitro, alquilo C_{1-4}, halo-alquilo(C_{1-4}), alquilcarbonilo C_{1-4} o heteroarilo; o R^2 y R^3 pueden unirse para formar un biciclo de 6,6 miembros opcionalmente sustituido;

L es azufre u oxígeno; y

m es 0 ó 1; y

sales y N-óxidos de los compuestos de la fórmula I.

Los compuestos de la invención contienen por lo menos un átomo de carbono asimétrico, y pueden presentarse como enantiómeros (o como pares de diastereoisómeros), o como sus mezclas. Además, cuando n es 1, los compuestos de la invención son sulfóxidos, que pueden presentarse en dos formas enantiómeras, y el carbono adyacente también puede presentarse en dos formas enantiómeras. Los compuestos de la fórmula general (1), por lo tanto, se pueden presentar como racematos, diastereoisómeros o enantiómeros simples, y

la invención incluye todos los isómeros o las mezclas de isómeros posibles, en todas las proporciones. Debe esperarse que, para cualquier compuesto determinado, un isómero pueda ser más activo que otro como fungicida.

Los N-óxidos de los compuestos de la fórmula I denotan, preferentemente, los N-óxidos formados por la porción quinolina.

Las sales que los compuestos de la fórmula I pueden formar son, preferentemente, aquellas formadas mediante la interacción de estos compuestos con ácidos. El término "ácido" comprende ácidos minerales, tales como haluros de hidrógeno, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, etc., al igual que ácidos orgánicos, preferentemente, los ácidos alcanoicos comúnmente utilizados, por ejemplo, ácido fórmico, ácido acético y ácido propiónico.

Excepto donde se declare lo contrario, los grupos alquilo y las porciones alquilo de alcoxi, alquiltio, etc. contienen apropiadamente de 1 a 6, habitualmente, de 1 a 4 átomos de carbono, en forma de cadenas rectas o ramificadas. Ejemplos comprenden metilo, etilo, *n*- e *iso*-propilo y *n*-, *sec*-, *iso*- y *ter*-butilo. Cuando las porciones alquilo contienen 5 ó 6 átomos de carbono, los ejemplos son *n*-pentilo y *n*-hexilo. Ejemplos de sustituyentes opcionales adecuados de grupos y porciones alquilo incluyen halo, hidroxi, alcoxi C_{1-4} y alcoxiC_{1-4}alcoxi(C_{1-4}), ciano, arilo opcionalmente sustituido y heteroarilo opcionalmente sustituido. Cuando el sustituyente opcional es halo, el grupo o la porción haloalquilo es, típicamente, monoclorometilo, monofluormetilo, diclorometilo, difluormetilo, triclorometilo o trifluormetilo.

Excepto donde se declare lo contrario, las porciones alquenilo y alquinilo también contienen apropiadamente de 2 a 6, habitualmente, de 2 a 4 átomos de carbono, en forma de cadenas rectas o ramificadas. Ejemplos comprenden alilo, etinilo y propargilo. Los sustituyentes opcionales incluyen halo, alcoxi, arilo opcionalmente sustituido y heteroarilo opcionalmente sustituido.

Halo incluye flúor, cloro, bromo y yodo.

Arilo habitualmente es fenilo, aunque también incluye naftilo, antrilo y fenantrilo.

Heteroarilo habitualmente es un anillo aromático de 5 ó 6 miembros que contiene una o más porciones azufre, oxígeno o NR como heteroátomos, que puede estar fusionado a uno o más anillos aromáticos o heteroaromáticos adicionales, por ejemplo, un anillo benceno. Ejemplos abarcan grupos tienilo, furilo, pirrolilo, isoxazolilo, oxazolilo, tiazolilo, oxadiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, isotiazolilo, tetrazolilo, tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, triazinilo, benzofuranilo, benzotienilo, dibenzofuranilo, dibenzotienilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, bencimidazolilo, indolilo, quinolilo, isoquinolilo, quinazolinilo y quinoxalinilo, y cuando es apropiado, sus N-óxidos y sales. Cualquiera de los valores de arilo o heteroarilo está opcionalmente sustituido. Excepto donde se indique lo contrario, los sustituyentes que pueden presentarse incluyen uno o más de los siguientes: halo, hidroxi, mercapto, alquilo C_{1-6} (en especial, metilo y etilo), alquenilo C_{2-6} (en especial, alilo), alquinilo C_{2-6} (en especial, propargilo), alcoxi C_{1-6} (en especial, metoxi), alqueniloxi C_{2-6} (en especial, aliloxi), alquiniloxi C_{2-6} (en especial, propargiloxi), halo-alquilo(C_{1-6}) (en especial, trifluormetilo), halo-alcoxi(C_{1-6}) (en especial, trifluormetoxi), -$S(O)_m$alquilo(C_{1-6}) donde m es 0; 1 ó 2, y el alquilo está opcionalmente sustituido con halo, hidroxi-alquilo(C_{1-6}), alcoxiC_{1-4}alquilo(C_{1-4}), alcoxiC_{1-4}alcoxi(C_{1-4}), cicloalquilo C_{3-6}, cicloalquiloC_{3-6}alquilo(C_{1-4}), arilo opcionalmente sustituido (en especial, fenilo opcionalmente sustituido), heteroarilo opcionalmente sustituido (en especial, piridilo o pirimidinilo opcionalmente sustituido), ariloxi opcionalmente sustituido (en especial, fenoxi opcionalmente sustituido), heteroariloxi opcionalmente sustituido (en especial, piridiloxi o pirimidiniloxi opcionalmente sustituido), -$S(O)_m$arilo opcionalmente sustituido donde m es 0; 1 ó 2 (en especial,

feniltio opcionalmente sustituido), -$S(O)_m$heteroarilo opcionalmente sustituido donde m es 0; 1 ó 2 (en especial, piridiltio o pirimidiniltio opcionalmente sustituido), aril-alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido (en especial, bencilo opcionalmente sustituido, fenetilo opcionalmente sustituido y fenil *n*-propilo opcionalmente sustituido), donde la porción alquilo está opcionalmente sustituida con hidroxi, heteroaril-alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido (en especial, piridil- o pirimidinil-alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido), aril-alquenilo(C_{2-4}) opcionalmente sustituido (en especial, feniletenilo opcionalmente sustituido), heteroaril-alquenilo(C_{2-4}) opcionalmente sustituido (en especial, piridiletenilo o pirimidiniletenilo opcionalmente sustituido), aril-alcoxi(C_{1-4}) opcionalmente sustituido (en especial, benciloxi y fenetiloxi opcionalmente sustituidos), heteroaril-alcoxi(C_{1-4}) opcionalmente sustituido (en especial, piridil-alcoxi(C_{1-4}) opcionalmente sustituido o pirimidinil-alcoxi(C_{1-4}) opcionalmente sustituido), ariloxi-alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido (en especial, fenoximetilo), heteroariloxi-alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido (en especial, piridiloxi o pirimidiniloxi-alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido), -$S(O)_m$alquilarilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido donde m es 0; 1 ó 2 (en especial, benciltio y fenetiltio opcionalmente sustituidos), -$S(O)_m$alquilheteroarilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido donde m es 0; 1 ó 2 (en especial, piridil-alquiltio(C_{1-4}) o pirimidinil-alquiltio(C_{1-4}) opcionalmente sustituido), -alquilo(C_{1-4})$S(O)_m$arilo opcionalmente sustituido donde m es 0; 1 ó 2 (en especial, feniltiometilo), -alquilo(C_{1-4})$S(O)_m$heteroarilo opcionalmente sustituido donde m es 0; 1 ó 2 (en especial, piridiltio-alquilo(C_{1-4}) o pirimidiniltio-alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido), aciloxi, que abarca alcanoiloxi C_{1-4} (en especial, acetiloxi) y benzoiloxi, ciano, isociano, tiocianato, isotiocianato, nitro, NR^gR^h, -$NHCOR^g$, -$NHCONR^gR^h$, -$CONR^gR^h$, -CO_2R^g, -SO_2R^i, -OSO_2R^i, -COR^g, -$CR^g{=}NR^h$ o -$N{=}CR^gR^h$ donde R^i es alquilo C_{1-4}, halo-alquilo(C_{1-4}), alcoxi C_{1-4}, halo-alcoxi(C_{1-4}), alquiltio C_{1-4}, cicloalquilo C_{3-6}, cicloalquiloC_{3-6}alquilo(C_{1-4}),

fenilo o bencilo, donde los grupos fenilo y bencilo están opcionalmente sustituidos con halógeno, alquilo C_{1-4} o alcoxi C_{1-4}, y R^g y R^h son de modo independiente hidrógeno, alquilo C_{1-4}, halo-alquilo(C_{1-4}), alcoxi C_{1-4}, halo-alcoxi(C_{1-4}), alquiltio C_{1-4}, cicloalquilo C_{3-6}, cicloalquiloC_{3-6}alquilo(C_{1-4}), fenilo o bencilo, donde los grupos fenilo y bencilo están opcionalmente sustituidos con halógeno, alquilo C_{1-4} o alcoxi C_{1-4}.

Son de particular interés aquellos compuestos de la fórmula (I) donde Q^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno; Q^1, Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6 se definen de acuerdo con lo descripto con anterioridad. Preferentemente, Q^2 es metilo o etilo.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde Q^1 es halógeno, arilo o heteroarilo; Q^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno; y Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6 se definen de acuerdo con lo descripto con anterioridad. Preferentemente, Q^2 es metilo o etilo.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde Q^1 es arilo; Q^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno; y Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6 se definen de acuerdo con lo descripto con anterioridad. Preferentemente, Q^2 es metilo o etilo.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde Q^1 es heteroarilo; Q^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno; y Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6 se definen de acuerdo con lo descripto con anterioridad. Preferentemente, Q^2 es metilo o etilo.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde Q^1 y Q^3, de manera independiente entre sí, son hidrógeno o halógeno; y Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno. Preferentemente, Q^1 y Q^3, de manera independiente entre sí, son flúor, cloro, bromo, o yodo. Más preferentemente, Q^1 es cloro, bromo o yodo, y Q^3 es flúor o cloro.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde Q^1 es arilo o heteroarilo; Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno, y Q^3 es hidrógeno o

halógeno. Preferentemente, Q^1 es tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, halo, o fenilo sustituido con halo o alcoxi, o piridilo sustituido con halo o alcoxi. Además, se prefiere que Q^3 sea hidrógeno, flúor o cloro.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde Q^1, Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno, y Q^3 es hidrógeno, halógeno o alquilo opcionalmente sustituido. Preferentemente, Q^3 es hidrógeno, flúor o cloro.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde Q^1 es halógeno; Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno, y Q^3 es hidrógeno o alquilo opcionalmente sustituido. Preferentemente, Q^1 es cloro, bromo o yodo. Se prefiere además que Q^3 sea metilo.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde Q^1 y Q^2 son halógeno y Q^3 es hidrógeno o alquilo opcionalmente sustituido, y Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno. Preferentemente, Q^1 es cloro, bromo o yodo. Se prefiere además que Q^3 sea metilo.

Son de particular interés aquellos compuestos de la fórmula (I), donde Q^1 es bromo, y Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6, de manera independiente entre sí, son hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno. Preferentemente, Q^2 es halógeno, y Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno. Además, se prefiere que Q^2 sea metilo o etilo, y Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6 sean hidrógeno. Adicionalmente, se prefiere que Q^3 sea flúor o cloro, y Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 sean hidrógeno.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde Q^1 es yodo, y Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6, de manera independiente entre sí, son hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno. Preferentemente, Q^2 es halógeno, y Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno. Se prefiere además que Q^2 sea metilo o etilo, y Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6 sean hidrógeno. Asimismo, se prefiere que Q^3 sea flúor o cloro, y Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 sean hidrógeno.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde Q^1 es cloro, y Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6, de modo independiente entre sí, son hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno. Preferentemente, Q^2 es halógeno, y Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno. Se prefiere además que Q^2 sea metilo o etilo, y Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6 sean hidrógeno. Adicionalmente, se prefiere que Q^3 sea flúor o cloro, y Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 sean hidrógeno.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde Q^1 es cloro, bromo o yodo.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde Q^1 es flúor.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde Q^3 es hidrógeno o halógeno. Preferentemente, Q^3 es hidrógeno, flúor o cloro. Más preferentemente, Q^3 es flúor.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde Q^1 es bromo, Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno, y Q^3 es hidrógeno, flúor o cloro. Preferentemente, Q^3 es flúor. Se prefiere además que Q^3 sea cloro. Asimismo, se prefiere que Q^3 sea hidrógeno.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde Q^1 es yodo, Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno, y Q^3 es hidrógeno, flúor o cloro. Preferentemente, Q^1 es yodo, Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno, y Q^3 es flúor. Además, se prefiere que Q^1 sea yodo, Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 sean hidrógeno, y Q^3 sea cloro. Asimismo, se prefiere que Q^3 sea hidrógeno.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde Q^1 es hidrógeno, halógeno, alquenilo C_{2-6} opcionalmente sustituido, alquinilo C_{2-6} opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde R^1 es alquilo C_{1-4}. Preferentemente, R^1 es metilo o etilo. Más preferentemente, R^1 es metilo. Se prefiere además que R^1 sea etilo.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde R^1 es metilo o etilo, Q^1 es hidrógeno o halógeno, Q^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno, y Q^3 es hidrógeno o halógeno. Preferentemente, Q^1 es cloro, bromo o yodo, Q^2 es hidrógeno, metilo, etilo, cloro o bromo, y Q^3 es flúor o bromo.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde R^2 es hidrógeno o metilo. Preferentemente, R^2 es hidrógeno.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde R^1 es metilo o etilo; R^2 es hidrógeno, Q^1 es hidrógeno o halógeno; Q^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno, y Q^3 es hidrógeno o halógeno. Preferentemente, Q^1 es cloro, bromo o yodo; Q^2 es hidrógeno, metilo, etilo, cloro o bromo, y Q^3 es hidrógeno, flúor o bromo.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde R^3 es ter-butilo, 1-halo-2-metilprop-2-ilo, 1,1-dihalo-2-metilprop-2-ilo, 1,1,1-trihalo-2-metilprop-2-ilo, 1-alcoxi-2-metilprop-2-ilo, 1-alqueniloxi-2-metilprop-2-ilo, 1-alquiniloxi-2-metilprop-2-ilo, 1-ciano-2-metil-prop-2-ilo, 1-alcoxialcoxi-2-metil-prop-2-ilo, 1-halo-3-metilbut-3-ilo, 1-alcoxi-3-metilbut-3-ilo, 1-alqueniloxi-3-metilbut-3-ilo, 1-alquiniloxi-3-metilbut-3-ilo, 1-ciano-3-metilbut-3-ilo, 2-cianoprop-2-ilo, 2-alcoxi(C_{1-6})carbonilprop-2-ilo, 2-metoxicarbonilprop-2-ilo o 2-metilaminocarbonilprop-2-ilo, 1-alquiltio-2-metilprop-2-ilo, 2-ciano-1-alcoxiprop-2-ilo, 1-alcoxi-prop-2-ilo, 1-halo-prop-2-ilo, 1-cianoalquil-3-metilbut-3-ilo, 1-haloalquil-3-metilbut-3-ilo; y R^1, R^2, Q^1, Q^2 y Q^3 se definen conforme a lo descripto con anterioridad. Preferentemente, R^1 es metilo o etilo; R^2 es hidrógeno; Q^1 es hidrógeno o halógeno; Q^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno; y Q^3 es hidrógeno o halógeno. Más preferentemente, Q^1 es cloro, bromo o yodo, Q^2 es

hidrógeno, metilo, etilo, cloro o bromo, y Q^3 es hidrógeno, flúor, cloro o bromo. Se prefiere además que R^3 sea ter-butilo, 1-halo-2-metilprop-2-ilo, 1-metoxi-2-metilprop-2-ilo, 1-etoxi-2-metilprop-2-ilo, 1-aliloxi-2-metilprop-2-ilo, 1-(prop-2-iniloxi)-2-metilprop-2-ilo o 2-ciano-1-metoxiprop-2-ilo; y R^1, R^2, Q^1, Q^2 y Q^3 se definen de acuerdo con lo descripto con anterioridad.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde R^4 es alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido con alcoxiC_{1-4}-alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-4}), donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo, mono- o di-alquilamino(C_{1-6}) o tri-alquilo(C_{1-4})sililo; o R^4 es alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido con benciloxi-alquilo(C_{1-4}), donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo, mono- o di-alquilamino(C_{1-6}) o tri-alquilo(C_{1-4})sililo; o R^4 es alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido con alqueniloxi C_{2-6}, alquiniloxi C_{2-6} o -$S(O)_x$alquilo(C_{1-6}), donde x es 0; 1 ó 2, y el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo, mono- o di-alquilamino(C_{1-6}); R^4 es $–CH_2-C\equiv C-R^5$, donde R^5 es hidrógeno, alquilo C_{1-8} opcionalmente sustituido con halógeno, hidroxi, alcoxi C_{1-6}, alcoxiC_{1-3}alcoxi(C_{1-3}), ciano; y R^1, R^2, Q^1, Q^2 y Q^3 se definen de acuerdo con lo descripto con anterioridad. Preferentemente, R^1 es metilo o etilo; R^2 es hidrógeno; Q^1 es hidrógeno o halógeno; Q^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno, y Q^3 es hidrógeno o halógeno. Más preferentemente, Q^1 es cloro, bromo o yodo, Q^2 es hidrógeno, metilo, etilo, cloro o bromo, y Q^3 es hidrógeno, flúor, cloro o bromo.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde los anillos o las porciones arilo opcionalmente sustituido y heteroarilo opcionalmente sustituido de los valores R_5 están opcionalmente sustituidos con halógeno, ciano, nitro, azido, alquilo C_{1-6}, halo-alquilo(C_{1-6}), cicloalquilo C_{3-6}, cicloalquiloC_{3-6}alquilo(C_{1-4}), alquenilo C_{2-6}, halo-alquenilo(C_{2-6}), alquinilo C_{2-6}, halo-alquinilo(C_{2-6}), alcoxi C_{1-6}, halo-alcoxi(C_{1-6}), alqueniloxi C_{2-6}, halo-alqueniloxi(C_{2-6}), alquiniloxi C_{2-6},

halo-alquiniloxi(C_{2-6}), arilo, ariloxi, aril-alquilo(C_{1-6}), aril-alcoxi(C_{1-6}), heteroarilo, heteroariloxi, heteroaril-alquilo(C_{1-6}), heteroaril-alcoxi(C_{1-6}), -SF_5, -$S(O)_g$alquilo(C_{1-4}) donde g es 0; 1 ó 2, y el alquilo está opcionalmente sustituido con halo; o R^5 está opcionalmente sustituido con -OSO_2alquilo(C_{1-4}), donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo; o R^5 está opcionalmente sustituido con -$CONR^gR^h$, -COR^g, -CO_2R^g, -R^{gg}=NR^h, -NR^gR^h, -NR^gCOR^h, -$NR^gCO_2R^h$, -$SO_2NR^gR^h$ o –$NR^gSO_2R^i$, donde R^i es alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido con halógeno, y R^{gg} es alquileno C_{1-6}; R^g y R^h, de modo independiente entre sí, son hidrógeno o alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido con halógeno; o, en el caso de –$CONR^gR^h$ o -$SO_2NR^gR^h$, R^gR^h pueden unirse para formar un anillo heterocíclico o carbocíclico de 5 ó 6 miembros, que contiene un heteroátomo seleccionado de azufre, oxígeno o NR^0, donde R^0 es hidrógeno o alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido, y R^1, R^2, Q^1, Q^2 y Q^3 se definen de acuerdo con lo descripto con anterioridad. Preferentemente, R^1 es metilo o etilo, R^2 es hidrógeno, Q^1 es hidrógeno o halógeno, Q^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno, y Q^3 es hidrógeno o halógeno. Más preferentemente, Q^1 es cloro, bromo o yodo, Q^2 es hidrógeno, metilo, etilo, cloro o bromo, y Q^3 es hidrógeno, flúor, cloro o bromo.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde el arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o anillo de 5 a 8 miembros opcionalmente sustituido R^4 está opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, nitro, azido, alquilo C_{1-6}, halo-alquilo(C_{1-6}), cicloalquilo C_{3-6}, cicloalquiloC_{3-6}alquilo(C_{1-4}), alquenilo C_{2-6}, halo-alquenilo(C_{2-6}), alquinilo C_{2-6}, halo-alquinilo(C_{2-6}), alcoxi C_{1-6}, halo-alcoxi(C_{1-6}), alqueniloxi C_{2-6}, halo-alqueniloxi(C_{2-6}), alquiniloxi C_{2-6}, halo-alquiniloxi(C_{2-6}), -SF_5, -$S(O)_x$alquilo(C_{1-6}), donde x es 0; 1 ó 2, y el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo; o R^4 está opcionalmente sustituido con -OSO_2alquilo(C_{1-4}), donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halógeno, -$CONR^xR^y$, -$CON(OR^x)R^y$, -COR^x, -CO_2R^x, -CR^x=NR^y,

$-NR^xR^y$, $-NR^xCOR^y$, $-NR^xCO_2R^y$, $-SO_2NR^xR^y$ o $-NR^xSO_2R^z$, donde R^z es alquilo C_{1-8} opcionalmente sustituido con halógeno, y R^x y R^y, de modo independiente entre sí, son hidrógeno o alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido con halógeno, y R^1, R^2, Q^1, Q^2 y Q^3 se definen de acuerdo con lo descripto con anterioridad. Preferentemente, R^1 es metilo o etilo; R^2 es hidrógeno; Q^1 es hidrógeno o halógeno; Q^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno; y Q^3 es hidrógeno o halógeno. Más preferentemente, Q^1 es cloro, bromo o yodo, Q^2 es hidrógeno, metilo, etilo, cloro o bromo, y Q^3 es hidrógeno, flúor, cloro o bromo.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde L es oxígeno.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde m es 0.

De particular interés son aquellos compuestos de la fórmula (I), donde m es 1.

Los compuestos que forman parte de la invención se ilustran en las Tablas 1 a 160, a continuación.

Tabla 1.

Los compuestos de la Tabla 1 son de la fórmula general (I), donde Q1, Q2, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la Tabla.

Compuesto Nro.	R^2	R^3
1	H	CH_3
2	CH_3	CH_3
3	H	C_2H_5
4	C_2H_5	C_2H_5
5	H	prop-2-ilo
6	CH_3	prop-2-ilo

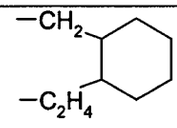
7	prop-2-ilo	prop-2-ilo
8	CH_3	*n*-butilo
9	H	but-2-ilo
10	H	2-metil-prop-1-ilo
11	2-metil-prop-1-ilo	2-metil-prop-1-ilo
12	H	*ter*-C_4H_9
13	CH_3	*ter*-C_4H_9
14	H	pent-2-ilo
15	H	pent-3-ilo
16	H	2-metil-but-2-ilo
17	H	3-metil-but-1-ilo
18	H	3-metil-pent-2-ilo
19	H	4-metil-pent-2-ilo
20	H	3,3-dimetil-but-2-ilo
21	H	2-metil-hex-2-ilo
22	H	2,4-dimetil-pent-2-ilo
23	H	2,4,4-trimetil-but-2-ilo
24	H	2,4,4-trimetil-pent-2-ilo
25	H	Cl-*n*-C_3H_6-
26	H	Cl-$CH_2(CH_3)_2C$-
27	H	$F_3C(CH_3)_2C$-
28	H	NC-CH_2-
29	CH_3	NC-CH_2-
30	NC-CH_2-	NC-CH_2-
31	H	$(NC)_2CH$-
32	H	NC-C_2H_4-
33	CH_3	NC-C_2H_4-
34	NC-C_2H_4-	NC-C_2H_4-
35	H	$(CH_3)_2C(CN)$-
36	H	$C_2H_5(CH_3)C(CN)$-
37	H	$(C_2H_5)_2C(CN)$-
38	H	$(CH_3)_2CH(CH_3)C(CN)$-
39	H	HO-$CH_2(CH_3)_2C$-
40	H	HO-$C_2H_4(CH_3)_2C$-

41	H	1-hidroxi-2-(hidroximetil)-prop-2-ilo
42	H	1-hidroxi-2-(metoximetil)prop-2-ilo
43	H	1-metoxi-2-(metoximetil)prop-2-ilo
44	H	1-hidroxi-2-(hidroximetil)-but-2-ilo
45	$C_2H_5OC_2H_4$-	$C_2H_5OC_2H_4$-
46	CH_3	$(CH_3O)_2CHCH_2$-
47	H	CH_3O-$CH_2(CH_3)_2C$-
48	H	CH_3O-$C_2H_4(CH_3)_2C$-
49	H	C_2H_5O-$C_2H_4(CH_3)_2C$-
50	H	CH_3S-$CH_2(CH_3)_2C$-
51	H	NC-$(CH_3O)CH$-
52	H	$CH_3OCH_2(CH_3)C(CN)$-
53	H	$CH_3SCH_2(CH_3)C(CN)$-
54	H	$CH_3(CO)(CH_3)_2C$-
55	H	$CH_3CHBr(CO)(CH_3)_2C$-
56	H	$CH_3(CO)(OH)CH(CH_3)_2C$-
57	H	$CH_3OC_2H_4(CO)(CH_3)_2C$-
58	H	$CH_3(CO)CH_2(CH_3)_2C$-
59	H	$CH_3O(CO)(CH_3)CH$-
60	H	$CH_3O(CO)(CH_3)_2C$-
61	H	$C_2H_5O(CO)C_2H_4$-
62	H	$CH_3NH(CO)(CH_3)_2C$-
63	H	$(CH_3)_2N(CO)(CH_3)_2C$-
64	H	$(CH_3)_3SiCH_2$-
65	H	*ter*-$C_4H_9(CH_3)_2SiO$-$CH_2(CH_3)_2C$-
66	H	*ter*-$C_4H_9(CH_3)_2SiO$-$C_2H_4(CH_3)_2C$-
67	H	4-F$PhCH_2OCH_2(CH_3)_2C$-
68	H	$C_2H_5OCH_2(CH_3)_2C$-
69	H	$CH_3OCH_2CH_2OCH_2(CH_3)_2C$-
70	H	CH_2=$CHCH_2$-
71	CH_2=$CHCH_2$-	CH_2=$CHCH_2$-
72	H	CH_2=$C(CH_3)CH_2$-
73	H	CH_2=$CH(CH_3)CH$-
74	H	CH_2=$CH(CH_3)_2C$-

75	H	$CH_3(CO)CH=CH-$
76	CH_3	$CH_3(CO)CH=CH-$
77	H	pent-3-en-2-ilo
78	H	2-metil-hex-3-en-2-ilo (E)
79	H	2-metil-hex-3-en-2-ilo (Z)
80	H	2-metil-pent-4-en-3-on-2-ilo
81	H	$CH_3O(CO)CH=(Cl)C(CH_3)_2C-$
82	H	$C_6H_5-C(CH_3)=CH(CH_3)_2C-$
83	H	$HC\equiv CCH_2CH_2-$
84	H	$HC\equiv CCH_2CH(CH_3)-$
85	H	$HC\equiv CCH_2C(CH_3)_2-$
86	H	ciclopropilo
87	$NC-C_2H_4-$	ciclopropilo
88	cicloprop-1-ilo	ciclopropilo
89	H	1-ciano-cicloprop-1-ilo
90	H	2-ciano-cicloprop-1-ilo
91	H	1-metoxicarbonil-cicloprop-1-ilo
92	H	1-[*N*,*N*-dimetilaminocarbonil]-cicloprop-1-ilo
93	H	1-[*N*-metil-*N*-metoxi-aminocarbonil]-cicloprop-1-ilo
94	H	1-ciano-1-ciclopropil-et-1-ilo
95	H	ciclopentilo
96	H	1-ciano-ciclopent-1-ilo
97	H	ciclohexilo
98	$CH_2=CHCH_2-$	ciclohexilo
99	H	4-ciano-ciclohex-1-ilo
100	H	1-ciano-4-metil-ciclohex-1-ilo
101	H	4-*ter*-butil-1-ciano-ciclohex-1-ilo
102	H	2-metil-3-cianotetrahidro-furan-3-ilo
103	H	5-metil-1,3-dioxolan-5-ilo
104	H	5-etil-1,3-dioxolan-5-ilo
105	H	3,5-dimetil-1,3-dioxolan-5-ilo

106	H	N-etoxicarbonil-piperid-4-ilo
107	H	morfolino
108	H	ciclohex-1-il-metilo
109	H	4-ciano-ciclopenten-3-ilo
110	H	5-*ter*-butil-2*H*-1,3,4-tiadiazin-2-ilo
111	H	2-(ciclohexen-1-il)-et-1-ilo
112	H	fur-2-ilo
113	H	5-metoxicarbonil-fur-2-ilo
114	H	tien-2-ilo
115	H	2-metoxicarbonil-tien-3-ilo
116	H	4-metoxicarbonil-tien-3-ilo
117	H	oxazol-2-ilo
118	H	5-metil-isoxazol-3-ilo
119	H	4-ciano-3-metil-isoxazol-5-ilo
120	H	tiazol-2-ilo
121	H	5-etiltio-1,3,4-tiadiazol-2-ilo
122	H	fur-2-ilmetilo
123	H	cianofur-1-ilmetilo
124	H	tien-2-ilmetilo
150	H	$C_6H_5CH_2$-
151	CH_3	$C_6H_5CH_2$-
152	H	2-F-$C_6H_4CH_2$-
153	H	2-Cl-$C_6H_4CH_2$-
154	CH_3	2-Cl-$C_6H_4CH_2$-
155	H	2-NO_2-$C_6H_4CH_2$-
156	H	2-CH_3-$C_6H_4CH_2$-
157	H	2-CH_3O-$C_6H_4CH_2$-
158	H	2-CHF_2O-$C_6H_4CH_2$-
159	H	2-CH_3S-$C_6H_4CH_2$-
160	H	2-CF_3S-$C_6H_4CH_2$-
161	H	3-Cl-$C_6H_4CH_2$-
162	H	3-I-$C_6H_4CH_2$-
163	H	3-CH_3-$C_6H_4CH_2$-
164	H	3-CH_3O-$C_6H_4CH_2$-

165	H	4-F-$C_6H_4CH_2$-
166	H	4-Cl-$C_6H_4CH_2$-
167	H	4-CH_3-$C_6H_4CH_2$-
168	H	4-CF_3-$C_6H_4CH_2$-
169	H	4-CH_3O-$C_6H_4CH_2$-
170	H	4-CF_3O-$C_6H_4CH_2$-
171	H	2,6-di-F-$C_6H_3CH_2$-
172	3-metil-but-2-en-1-ilo	2,5-di-F-$C_6H_3CH_2$-
173	H	2-F-4-Cl-$C_6H_3CH_2$-
174	H	2-F-6-Cl-$C_6H_3CH_2$-
175	H	2,6-di-Cl-$C_6H_3CH_2$-
176	4-metil-pent-2-en-1-ilo	3,4-di-Cl-$C_6H_3CH_2$-
177	H	2-F-6-CH_3O-$C_6H_3CH_2$-
178	H	2,4,5-tri-F-$C_6H_2CH_2$-
179	H	2,4-di-Cl-6-CH_3-$C_6H_2CH_2$-
180	H	3,4,5-tri-CH_3O-$C_6H_2CH_2$-
181	H	C_6H_5-$CH(CH_3)$-
182	H	4-F-C_6H_4-$CH(CH_3)$-
183	H	4-NO_2-C_6H_4-$CH(CH_3)$-
184	H	4-*n*-pentil-C_6H_4-$CH(CH_3)$-
185	H	4-CH_3SO_2-C_6H_4-$CH(CH_3)$-
186	H	$C_6H_5(CO)CH_2$-
187	H	C_6H_5-CH(CN)-
188	H	C_6H_5-$(CH_3O)CH$-
189	H	C_6H_5-$(CH_3)_2C$-
190	H	*m*-Cl-C_6H_5-$(CH_3)_2C$-
191	H	3,5-di-Cl-C_6H_3-$(CH_3)_2C$-
192	H	C_6H_5-$(C_2H_5O(CO))CH$-
193	H	fenetilo
194	H	3-metoxi-4-propargiloxi-fenetilo
195	H	3-metoxi-4-(pent-2-in-1-iloxi)-fenetilo
196	H	2-metil-3-fenil-prop-2-ilo
197	H	C_6H_5O-C_2H_4-
198	H	4-F-C_6H_4-$CH_2OCH_2(CH_3)_2C$-

199	H	C_6H_5-$CH_2O(CO)C_2H_4$-
200	H	naft-2-il-$(CH_3)CH$-
201	NC-C_2H_4-	pirid-3-ilmetilo
202	CH_3	2-pirid-2-ilet-1-ilo
203	H	2-(3-cloro-5-trifluormetil-pirid-2-il)oxiet-1-ilo
204	H	2-metil-4-pirazin-2-il-but-3-on-2-ilo
205	-$(CH_2)_4$-	
206	-$(CH_2)_5$-	
207	-$(CH_2)_4CH(C_2H_5)$-	
208	- $C_3H_6CH[(CO)N(C_2H_5)_2]CH_2$-	
209	-$CH(CH_3)CH$=$CHCH(CH_3)$-	
210		
211	-$C_2H_4OC_2H_4$-	
212	-$CH_2CH(CH_3)OCH(CH_3)CH_2$-	
213	-$C_2H_4SCH_2$-	
214	-$C_2H_4SC_2H_4$-	
215	-$(CH_2)_2NH(CH_2)_2$-	
216	-$(CH_2)_2N(p\text{-}NO_2\text{-}C_6H_4)(CH_2)_2$-	
217	-$(CH_2)_2N(m\text{-}CF_3\text{-}C_6H_4)(CH_2)_2$-	
218	-$(CH_2)_2N(p\text{-}CH_3CO\text{-}C_6H_4)(CH_2)_2$-	
219	-$(CH_2)_2$N(pirid-2-il)$(CH_2)_2$-	
220	H	$(H_2C$=$CHCH_2OCH_2)(CH_3)_2C$-
221	H	$(HCCHCH_2OCH_2)(CH_3)_2C$-
222	H	$(CH_3CH_2OCH_2)(CH_3)_2C$-
223	H	$((CH_3)_2CHOCH_2)(CH_3)_2C$-
224	H	$C_6H_5CH_2OCH_2(CH_3)_2C$-
225	H	$(CH_3CH_2OCH_2)(CH_3)_2C$-
226	H	4-F-C_6H_4-$CH_2(CH_3)C(CN)$-
227	H	4-Cl-C_6H_4-$CH_2(CH_3)C(CN)$-
228	H	4-CH_3O-C_6H_4-$CH_2CH_2(CH_3)C(CN)$-
229	H	2-Cl-C_6H_4-$CH_2(CH_3)C(CN)$-

230	H	$(CH_3)_2CH$-$CH_2(CH_3)C(CN)$-
231	H	1-metoximetil-cicloprop-1-ilo
232	H	1-benciloximetil-cicloprop-1-ilo
233	H	1-metoximetoxi-2- metil-prop-2-ilo
235	H	1-ciclopropil-et-1-ilo
236	H	2-fluor-et-1-ilo
237	H	2,2,2-trifluor-1-metil-et-1-ilo
261	H	$(H_2C=CHCH_2OCH_2)(CH_3)CH$-
262	H	$(HC\equiv CHCH_2OCH_2)(CH_3)CH$-
263	H	$(CH_3CH_2OCH_2)(CH_3)CH$-
264	H	$(CH_3OCH_2)(CH_3)CH$-
265	H	$((CH_3)_2CHOCH_2)(CH_3)CH$-
266	H	$C_6H_5CH_2OCH_2(CH_3)CH$-
267	H	$(CH_3CH_2OCH_2)(CH_3)CH$-
268	H	$(cC_4H_7)CH2$-
269	H	$(cC_4H_7)CH_3CH$-
270	H	$FCH_2(CH_3)CH$-
271	H	$ClCH_2(CH_3)CH$-
272	H	$FCH_2CH_2(CH_3)CH$-
273	H	$ClCH_2CH_2(CH_3)CH$-
274	H	$FCH_2(CH_3)_2C$-
275	H	$FCH_2CH_2(CH_3)_2C$-
276	H	$ClCH_2CH_2(CH_3)_2C$-
278	H	tetrahidro-furan-2-ilmetilo
279	H	1-(tetrahidro-furan-2-il)etilo
280	H	1-metil-1-(tetrahidro-furan-2-il)etilo
281	H	2-[1,3]dioxolan-2-il-etilo
282	H	2-[1,3]dioxolan-2-il-1-metil-etilo
283	H	2-[1,3]dioxolan-2-il-1,1-dimetil-etilo
284	H	prop-1-ilo
285	CH_3	prop-1-ilo
286	H	tiofen-3-ilmetilo
287	H	1-(tiofen-3-il)-et-1-ilo
289	H	1-metil-1-(tiofen-3-il)-et-1-ilo

290	H	ciclobutilo
291	H	1-metil-ciclobut-1-ilo
292	H	3-F-C_6H_4-$CH(CH_3)$-
293	H	3-F-C_6H_4-$C(CH_3)_2$-
294	H	1-ciano-ciclobut-1-ilo
295	H	$(O)HC(CH_3)_2C$-
296	H	$(MeO)_2C(CH_3)_2C$-
297	H	$(EtO)_2C(CH_3)_2C$-
298	H	$(O(CH_2)_2O)C(CH_3)_2C$-
299	H	$(O(CH_2)_3O)C(CH_3)_2C$-

Tabla 2

Los compuestos de la Tabla 2 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q2, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 2 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 2, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 2 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 2, R^1 es etilo.

Tabla 3

Los compuestos de la Tabla 3 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q2, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 3 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 3, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 3 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 3, m es 1.

Tabla 4

Los compuestos de la Tabla 4 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q2, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 4 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 4, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 4 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 4, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 5

Los compuestos de la Tabla 5 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es metilo, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 5 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 5, Q2 es metilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 5 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 4, Q2 es metilo.

Tabla 6

Los compuestos de la Tabla 6 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es metilo, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 6 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 6, Q2 es metilo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 6 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 6, Q2 es metilo, R^1 es etilo.

Tabla 7

Los compuestos de la Tabla 7 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es metilo, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 7 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 7, Q2 es metilo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 7 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 7, Q2 es metilo, m es 1.

Tabla 8

Los compuestos de la Tabla 8 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es metilo, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 8 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 8, Q2 es metilo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 8 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 8, Q2 es metilo, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 9

Los compuestos de la Tabla 9 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es cloro, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 9 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 9, Q2 es cloro. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 9 son

iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 9, Q2 es cloro.

Tabla 10

Los compuestos de la Tabla 10 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es cloro, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 10 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 10, Q2 es cloro, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 10 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 10, Q2 es cloro, R^1 es etilo.

Tabla 11

Los compuestos de la Tabla 11 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es cloro, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 11 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 11, Q2 es cloro, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 11 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 11, Q2 es cloro, m es 1.

Tabla 12

Los compuestos de la Tabla 12 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es cloro, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1

de la Tabla 12 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 12, Q2 es cloro, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 12 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 12, Q2 es cloro, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 13

Los compuestos de la Tabla 13 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es bromo, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 13 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 13, Q2 es bromo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 13 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 13, Q2 es bromo.

Tabla 14

Los compuestos de la Tabla 14 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es bromo, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 14 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 14, Q2 es bromo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 14 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 14, Q2 es bromo, R^1 es etilo.

Tabla 15

Los compuestos de la Tabla 15 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es bromo, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 15 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 15, Q2 es bromo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 15 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 15, Q2 es bromo, m es 1.

Tabla 16

Los compuestos de la Tabla 16 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es bromo, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 16 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 16, Q2 es bromo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 16 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 16, Q2 es bromo, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 17

Los compuestos de la Tabla 17 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es flúor, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 17 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 17, Q3 es flúor. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la

Tabla 17 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 17, Q3 es flúor.

Tabla 18

Los compuestos de la Tabla 18 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es flúor, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 18 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 18, Q3 es flúor, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 18 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 18, Q3 es flúor, R^1 es etilo.

Tabla 19

Los compuestos de la Tabla 19 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es flúor, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 19 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 19, Q3 es flúor, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 19 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 19, Q3 es flúor, m es 1.

Tabla 20

Los compuestos de la Tabla 20 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es flúor, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1

de la Tabla 20 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 20, Q3 es flúor, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 20 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 20, Q3 es flúor, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 21

Los compuestos de la Tabla 21 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es cloro, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 21 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 21, Q3 es cloro. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 21 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 21, Q3 es cloro.

Tabla 22

Los compuestos de la Tabla 22 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es cloro, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 22 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 22, Q3 es cloro, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 22 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 22, Q3 es cloro, R^1 es etilo.

Tabla 23

Los compuestos de la Tabla 23 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es cloro, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 23 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 23, Q3 es cloro, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 23 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 23, Q3 es cloro, m es 1.

Tabla 24

Los compuestos de la Tabla 24 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es cloro, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 24 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 24, Q3 es cloro, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 24 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 24, Q3 es cloro, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 25

Los compuestos de la Tabla 25 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es bromo, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 25 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 25, Q3 es bromo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de

la Tabla 25 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 25, Q3 es bromo.

Tabla 26

Los compuestos de la Tabla 26 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es bromo, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 26 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 26, Q3 es bromo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 26 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 26, Q3 es bromo, R^1 es etilo.

Tabla 27

Los compuestos de la Tabla 27 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es bromo, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 27 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 27, Q3 es bromo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 27 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 27, Q3 es bromo, m es 1.

Tabla 28

Los compuestos de la Tabla 28 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es bromo, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1

2/2

Organizacion y
Digitalizacion

PATENTE DE INVENCIÓN

09-97220

de la Tabla 28 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 28, Q3 es bromo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 28 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 28, Q3 es bromo, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 29

Los compuestos de la Tabla 29 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es metilo, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 29 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 29, Q3 es metilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 29 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 29, Q3 es metilo.

Tabla 30

Los compuestos de la Tabla 30 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es metilo, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 30 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 30, Q3 es metilo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 30 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 30, Q3 es metilo, R^1 es etilo.

Tabla 31

Los compuestos de la Tabla 31 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es metilo, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 31 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 31, Q3 es metilo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 31 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 31, Q3 es metilo, m es 1.

Tabla 32

Los compuestos de la Tabla 32 son de la fórmula general (I) donde Q1, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es metilo, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 32 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 32, Q3 es metilo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 32 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 32, Q3 es metilo, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 33

Los compuestos de la Tabla 33 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es metilo, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 33 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 33, Q1 es cloro, Q2 es metilo. Asimismo, los

compuestos 2 a 299 de la Tabla 33 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 33, Q1 es cloro, Q2 es metilo.

Tabla 34

Los compuestos de la Tabla 34 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es metilo, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 34 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 34, Q1 es cloro, Q2 es metilo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 34 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 34, Q1 es cloro, Q2 es metilo, R^1 es etilo.

Tabla 35

Los compuestos de la Tabla 35 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es metilo, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 35 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 35, Q1 es cloro, Q2 es metilo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 35 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 35, Q1 es cloro, Q2 es metilo, m es 1.

Tabla 36

Los compuestos de la Tabla 36 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es metilo, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y

R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 36 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 36, Q1 es cloro, Q2 es metilo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 36 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 36, Q1 es cloro, Q2 es metilo, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 37

Los compuestos de la Tabla 37 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es cloro, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 37 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 37, Q1 es cloro, Q2 es cloro. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 37 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 37, Q1 es cloro, Q2 es cloro.

Tabla 38

Los compuestos de la Tabla 38 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es cloro, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 38 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 38, Q1 es cloro, Q2 es cloro, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 38 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 38, Q1 es cloro, Q2 es cloro, R^1 es etilo.

Tabla 39

Los compuestos de la Tabla 39 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es cloro, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 39 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 39, Q1 es cloro, Q2 es cloro, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 39 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 39, Q1 es cloro, Q2 es cloro, m es 1.

Tabla 40

Los compuestos de la Tabla 40 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es cloro, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 40 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 40, Q1 es cloro, Q2 es cloro, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 40 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 40, Q1 es cloro, Q2 es cloro, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 41

Los compuestos de la Tabla 41 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es bromo, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 41 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 41, Q1 es cloro, Q2 es bromo. Asimismo, los

compuestos 2 a 299 de la Tabla 41 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 41, Q1 es cloro, Q2 es bromo.

Tabla 42

Los compuestos de la Tabla 42 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es bromo, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 42 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 42, Q1 es cloro, Q2 es bromo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 42 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 42, Q1 es cloro, Q2 es bromo, R^1 es etilo.

Tabla 43

Los compuestos de la Tabla 43 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es bromo, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 43 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 43, Q1 es cloro, Q2 es bromo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 43 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 43, Q1 es cloro, Q2 es bromo, m es 1.

Tabla 44

Los compuestos de la Tabla 44 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es bromo, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y

R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 44 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 44, Q1 es cloro, Q2 es bromo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 44 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 44, Q1 es cloro, Q2 es bromo, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 45

Los compuestos de la Tabla 45 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es flúor, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 45 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 45, Q1 es cloro, Q3 es flúor. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 45 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 45, Q1 es cloro, Q3 es flúor.

Tabla 46

Los compuestos de la Tabla 46 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es flúor, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 46 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 46, Q1 es cloro, Q3 es flúor, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 46 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 46, Q1 es cloro, Q3 es flúor, R^1 es etilo.

Tabla 47

Los compuestos de la Tabla 47 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es flúor, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 47 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 47, Q1 es cloro, Q3 es flúor, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 47 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 47, Q1 es cloro, Q3 es flúor, m es 1.

Tabla 48

Los compuestos de la Tabla 48 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es flúor, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 48 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 48, Q1 es cloro, Q3 es flúor, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 48 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 48, Q1 es cloro, Q3 es flúor, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 49

Los compuestos de la Tabla 49 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es cloro, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 49 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 49, Q1 es cloro, Q3 es cloro. Asimismo, los

compuestos 2 a 299 de la Tabla 49 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 49, Q1 es cloro, Q3 es cloro.

Tabla 50

Los compuestos de la Tabla 50 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es cloro, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 50 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 50, Q1 es cloro, Q3 es cloro, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 50 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 50, Q1 es cloro, Q3 es cloro, R^1 es etilo.

Tabla 51

Los compuestos de la Tabla 51 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es cloro, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 51 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 51, Q1 es cloro, Q3 es cloro, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 51 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 51, Q1 es cloro, Q3 es cloro, m es 1.

Tabla 52

Los compuestos de la Tabla 52 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es cloro, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y

R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 52 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 52, Q1 es cloro, Q3 es cloro, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 52 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 52, Q1 es cloro, Q3 es cloro, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 53

Los compuestos de la Tabla 53 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es bromo, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 53 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 53, Q1 es cloro, Q3 es bromo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 53 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 53, Q1 es cloro, Q3 es bromo.

Tabla 54

Los compuestos de la Tabla 54 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es bromo, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 54 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 54, Q1 es cloro, Q3 es bromo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 54 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 54, Q1 es cloro, Q3 es bromo, R^1 es etilo.

Tabla 55

Los compuestos de la Tabla 55 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es bromo, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 55 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 55, Q1 es cloro, Q3 es bromo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 55 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 55, Q1 es cloro, Q3 es bromo, m es 1.

Tabla 56

Los compuestos de la Tabla 56 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es bromo, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 56 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 56, Q1 es cloro, Q3 es bromo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 56 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 56, Q1 es cloro, Q3 es bromo, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 57

Los compuestos de la Tabla 57 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es metilo, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 57 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 57, Q1 es cloro, Q3 es metilo. Asimismo, los

compuestos 2 a 299 de la Tabla 57 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 57, Q1 es cloro, Q3 es metilo.

Tabla 58

Los compuestos de la Tabla 58 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es metilo, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 58 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 58, Q1 es cloro, Q3 es metilo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 58 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 58, Q1 es cloro, Q3 es metilo, R^1 es etilo.

Tabla 59

Los compuestos de la Tabla 59 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es metilo, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 59 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 59, Q1 es cloro, Q3 es metilo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 59 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 59, Q1 es cloro, Q3 es metilo, m es 1.

Tabla 60

Los compuestos de la Tabla 60 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es metilo, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y

R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 60 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 60, Q1 es cloro, Q3 es metilo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 60 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 60, Q1 es cloro, Q3 es metilo, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 61

Los compuestos de la Tabla 61 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es metilo, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 61 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 61, Q1 es flúor, Q2 es metilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 61 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 61, Q1 es flúor, Q2 es metilo.

Tabla 62

Los compuestos de la Tabla 62 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es metilo, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 62 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 62, Q1 es flúor, Q2 es metilo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 62 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 62, Q1 es flúor, Q2 es metilo, R^1 es etilo.

Tabla 63

Los compuestos de la Tabla 63 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es metilo, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 63 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 63, Q1 es flúor, Q2 es metilo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 63 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 63, Q1 es flúor, Q2 es metilo, m es 1.

Tabla 64

Los compuestos de la Tabla 64 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es metilo, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 64 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 64, Q1 es flúor, Q2 es metilo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 64 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 64, Q1 es flúor, Q2 es metilo, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 65

Los compuestos de la Tabla 65 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es cloro, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 65 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 65, Q1 es flúor, Q2 es cloro. Asimismo, los

compuestos 2 a 299 de la Tabla 65 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 65, Q1 es flúor, Q2 es cloro.

Tabla 66

Los compuestos de la Tabla 66 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es cloro, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 66 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 66, Q1 es flúor, Q2 es cloro, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 66 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 66, Q1 es flúor, Q2 es cloro, R^1 es etilo.

Tabla 67

Los compuestos de la Tabla 67 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es cloro, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 67 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 67, Q1 es flúor, Q2 es cloro, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 67 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 67, Q1 es flúor, Q2 es cloro, m es 1.

Tabla 68

Los compuestos de la Tabla 68 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es cloro, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y

R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 68 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 68, Q1 es flúor, Q2 es cloro, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 68 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 68, Q1 es flúor, Q2 es cloro, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 69

Los compuestos de la Tabla 69 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es bromo, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 69 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 69, Q1 es flúor, Q2 es bromo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 69 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 69, Q1 es flúor, Q2 es bromo.

Tabla 70

Los compuestos de la Tabla 70 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es bromo, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 70 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 70, Q1 es flúor, Q2 es bromo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 70 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 70, Q1 es flúor, Q2 es bromo, R^1 es etilo.

Tabla 71

Los compuestos de la Tabla 71 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es bromo, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 71 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 71, Q1 es flúor, Q2 es bromo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 71 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 71, Q1 es flúor, Q2 es bromo, m es 1.

Tabla 72

Los compuestos de la Tabla 72 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es bromo, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 72 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 72, Q1 es flúor, Q2 es bromo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 72 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 72, Q1 es flúor, Q2 es bromo, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 73

Los compuestos de la Tabla 73 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es flúor, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 73 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 73, Q1 es flúor, Q3 es flúor. Asimismo, los

compuestos 2 a 299 de la Tabla 73 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 73, Q1 es flúor, Q3 es flúor.

Tabla 74

Los compuestos de la Tabla 74 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es flúor, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 74 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 74, Q1 es flúor, Q3 es flúor, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 74 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 74, Q1 es flúor, Q3 es flúor, R^1 es etilo.

Tabla 75

Los compuestos de la Tabla 75 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es flúor, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 75 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 75, Q1 es flúor, Q3 es flúor, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 75 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 75, Q1 es flúor, Q3 es flúor, m es 1.

Tabla 76

Los compuestos de la Tabla 76 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es flúor, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y

R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 76 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 76, Q1 es flúor, Q3 es flúor, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 76 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 76, Q1 es flúor, Q3 es flúor, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 77

Los compuestos de la Tabla 77 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es cloro, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 77 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 77, Q1 es flúor, Q3 es cloro. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 77 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 77, Q1 es flúor, Q3 es cloro.

Tabla 78

Los compuestos de la Tabla 78 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es cloro, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 78 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 78, Q1 es flúor, Q3 es cloro, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 78 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 78, Q1 es flúor, Q3 es cloro, R^1 es etilo.

Tabla 79

Los compuestos de la Tabla 79 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es cloro, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 79 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 79, Q1 es flúor, Q3 es cloro, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 79 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 79, Q1 es flúor, Q3 es cloro, m es 1.

Tabla 80

Los compuestos de la Tabla 80 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es cloro, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 80 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 80, Q1 es flúor, Q3 es cloro, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 80 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 80, Q1 es flúor, Q3 es cloro, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 81

Los compuestos de la Tabla 81 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es bromo, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 81 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 81, Q1 es flúor, Q3 es bromo. Asimismo, los

compuestos 2 a 299 de la Tabla 81 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 81, Q1 es flúor, Q3 es bromo.

Tabla 82

Los compuestos de la Tabla 82 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es bromo, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 82 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 82, Q1 es flúor, Q3 es bromo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 82 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 82, Q1 es flúor, Q3 es bromo, R^1 es etilo.

Tabla 83

Los compuestos de la Tabla 83 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es bromo, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 83 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 83, Q1 es flúor, Q3 es bromo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 83 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 83, Q1 es flúor, Q3 es bromo, m es 1.

Tabla 84

Los compuestos de la Tabla 84 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es bromo, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y

R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 84 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 84, Q1 es flúor, Q3 es bromo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 84 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 84, Q1 es flúor, Q3 es bromo, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 85

Los compuestos de la Tabla 85 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es metilo, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 85 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 85, Q1 es flúor, Q3 es metilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 85 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 85, Q1 es flúor, Q3 es metilo.

Tabla 86

Los compuestos de la Tabla 86 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es metilo, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 86 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 86, Q1 es flúor, Q3 es metilo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 86 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 86, Q1 es flúor, Q3 es metilo, R^1 es etilo.

Tabla 87

Los compuestos de la Tabla 87 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es metilo, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 87 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 87, Q1 es flúor, Q3 es metilo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 87 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 87, Q1 es flúor, Q3 es metilo, m es 1.

Tabla 88

Los compuestos de la Tabla 88 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es metilo, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 88 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 88, Q1 es flúor, Q3 es metilo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 88 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 88, Q1 es flúor, Q3 es metilo, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 89

Los compuestos de la Tabla 89 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es metilo, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 89 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 89, Q1 es bromo, Q2 es metilo. Asimismo, los

compuestos 2 a 299 de la Tabla 89 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 89, Q1 es bromo, Q2 es metilo.

Tabla 90

Los compuestos de la Tabla 90 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es metilo, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 90 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 90, Q1 es bromo, Q2 es metilo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 90 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 90, Q1 es bromo, Q2 es metilo, R^1 es etilo.

Tabla 91

Los compuestos de la Tabla 91 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es metilo, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 91 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 91, Q1 es bromo, Q2 es metilo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 91 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 91, Q1 es bromo, Q2 es metilo, m es 1.

Tabla 92

Los compuestos de la Tabla 92 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es metilo, m es 1, L es O, R^1 es etilo,

y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 92 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 92, Q1 es bromo, Q2 es metilo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 92 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 92, Q1 es bromo, Q2 es metilo, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 93

Los compuestos de la Tabla 93 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es cloro, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 93 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 93, Q1 es bromo, Q2 es cloro. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 93 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 93, Q1 es bromo, Q2 es cloro.

Tabla 94

Los compuestos de la Tabla 94 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es cloro, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 94 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 94, Q1 es bromo, Q2 es cloro, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 94 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 94, Q1 es bromo, Q2 es cloro, R^1 es etilo.

Tabla 95

Los compuestos de la Tabla 95 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es cloro, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 95 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 95, Q1 es bromo, Q2 es cloro, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 95 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 95, Q1 es bromo, Q2 es cloro, m es 1.

Tabla 96

Los compuestos de la Tabla 96 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es cloro, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 96 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 96, Q1 es bromo, Q2 es cloro, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 96 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 96, Q1 es bromo, Q2 es cloro, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 97

Los compuestos de la Tabla 97 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es bromo, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 97 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 97, Q1 es bromo, Q2 es bromo. Asimismo, los

compuestos 2 a 299 de la Tabla 97 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 97, Q1 es bromo, Q2 es bromo.

Tabla 98

Los compuestos de la Tabla 98 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es bromo, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 98 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 98, Q1 es bromo, Q2 es bromo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 98 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 98, Q1 es bromo, Q2 es bromo, R^1 es etilo.

Tabla 99

Los compuestos de la Tabla 99 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es bromo, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 99 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 99, Q1 es bromo, Q2 es bromo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 99 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 99, Q1 es bromo, Q2 es bromo, m es 1.

Tabla 100

Los compuestos de la Tabla 100 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es bromo, m es 1, L es O, R^1 es etilo,

y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 100 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 100, Q1 es bromo, Q2 es bromo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 100 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 100, Q1 es bromo, Q2 es bromo, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 101

Los compuestos de la Tabla 101 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es flúor, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 101 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 101, Q1 es bromo, Q3 es flúor. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 101 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 101, Q1 es bromo, Q3 es flúor.

Tabla 102

Los compuestos de la Tabla 102 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es flúor, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 102 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 102, Q1 es bromo, Q3 es flúor, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 102 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 102, Q1 es bromo, Q3 es flúor, R^1 es etilo.

Tabla 103

Los compuestos de la Tabla 103 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es flúor, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 103 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 103, Q1 es bromo, Q3 es flúor, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 103 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 103, Q1 es bromo, Q3 es flúor, m es 1.

Tabla 104

Los compuestos de la Tabla 104 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es flúor, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 104 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 104, Q1 es bromo, Q3 es flúor, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 104 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 104, Q1 es bromo, Q3 es flúor, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 105

Los compuestos de la Tabla 105 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es cloro, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 105 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 105, Q1 es bromo, Q3 es cloro. Asimismo, los

compuestos 2 a 299 de la Tabla 105 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 105, Q1 es bromo, Q3 es cloro.

Tabla 106

Los compuestos de la Tabla 106 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es cloro, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 106 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 106, Q1 es bromo, Q3 es cloro, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 106 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 106, Q1 es bromo, Q3 es cloro, R^1 es etilo.

Tabla 107

Los compuestos de la Tabla 107 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es cloro, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 107 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 107, Q1 es bromo, Q3 es cloro, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 107 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 107, Q1 es bromo, Q3 es cloro, m es 1.

Tabla 108

Los compuestos de la Tabla 108 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es cloro, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y

R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 108 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 108, Q1 es bromo, Q3 es cloro, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 108 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 108, Q1 es bromo, Q3 es cloro, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 109

Los compuestos de la Tabla 109 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es bromo, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 109 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 109, Q1 es bromo, Q3 es bromo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 109 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 109, Q1 es bromo, Q3 es bromo.

Tabla 110

Los compuestos de la Tabla 110 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es bromo, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 110 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 110, Q1 es bromo, Q3 es bromo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 110 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 110, Q1 es bromo, Q3 es bromo, R^1 es etilo.

Tabla 111

Los compuestos de la Tabla 111 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es bromo, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 111 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 111, Q1 es bromo, Q3 es bromo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 111 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 111, Q1 es bromo, Q3 es bromo, m es 1.

Tabla 112

Los compuestos de la Tabla 112 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es bromo, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 112 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 112, Q1 es bromo, Q3 es bromo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 112 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 112, Q1 es bromo, Q3 es bromo, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 113

Los compuestos de la Tabla 113 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es metilo, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 113 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 113, Q1 es bromo, Q3 es metilo. Asimismo, los

compuestos 2 a 299 de la Tabla 113 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 113, Q1 es bromo, Q3 es metilo.

Tabla 114

Los compuestos de la Tabla 114 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es metilo, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 114 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 114, Q1 es bromo, Q3 es metilo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 114 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 114, Q1 es bromo, Q3 es metilo, R^1 es etilo.

Tabla 115

Los compuestos de la Tabla 115 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es metilo, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 115 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 115, Q1 es bromo, Q3 es metilo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 115 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 115, Q1 es bromo, Q3 es metilo, m es 1.

Tabla 116

Los compuestos de la Tabla 116 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es metilo, m es 1, L es O, R^1 es etilo,

y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 116 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 116, Q1 es bromo, Q3 es metilo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 116 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 116, Q1 es bromo, Q3 es metilo, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 117

Los compuestos de la Tabla 117 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es metilo, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 117 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 117, Q1 es yodo, Q2 es metilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 117 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 117, Q1 es yodo, Q2 es metilo.

Tabla 118

Los compuestos de la Tabla 118 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es metilo, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 118 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 118, Q1 es yodo, Q2 es metilo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 118 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 118, Q1 es yodo, Q2 es metilo, R^1 es etilo.

Tabla 119

Los compuestos de la Tabla 119 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es metilo, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 119 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 119, Q1 es yodo, Q2 es metilo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 119 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 119, Q1 es yodo, Q2 es metilo, m es 1.

Tabla 120

Los compuestos de la Tabla 120 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es metilo, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 120 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 120, Q1 es yodo, Q2 es metilo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 120 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 120, Q1 es yodo, Q2 es metilo, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 121

Los compuestos de la Tabla 121 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es cloro, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 121 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 121, Q1 es yodo, Q2 es cloro. Asimismo, los

compuestos 2 a 299 de la Tabla 121 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 121, Q1 es yodo, Q2 es cloro.

Tabla 122

Los compuestos de la Tabla 122 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es cloro, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 122 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 122, Q1 es yodo, Q2 es cloro, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 122 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 122, Q1 es yodo, Q2 es cloro, R^1 es etilo.

Tabla 123

Los compuestos de la Tabla 123 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es cloro, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 123 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 123, Q1 es yodo, Q2 es cloro, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 123 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 123, Q1 es yodo, Q2 es cloro, m es 1.

Tabla 124

Los compuestos de la Tabla 124 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es cloro, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y

R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 124 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 124, Q1 es yodo, Q2 es cloro, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 124 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 124, Q1 es yodo, Q2 es cloro, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 125

Los compuestos de la Tabla 125 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es bromo, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 125 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 125, Q1 es yodo, Q2 es bromo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 125 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 125, Q1 es yodo, Q2 es bromo.

Tabla 126

Los compuestos de la Tabla 126 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es bromo, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 126 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 126, Q1 es yodo, Q2 es bromo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 126 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 126, Q1 es yodo, Q2 es bromo, R^1 es etilo.

Tabla 127

Los compuestos de la Tabla 127 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es bromo, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 127 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 127, Q1 es yodo, Q2 es bromo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 127 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 127, Q1 es yodo, Q2 es bromo, m es 1.

Tabla 128

Los compuestos de la Tabla 128 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q2 es bromo, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 128 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 128, Q1 es yodo, Q2 es bromo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 128 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 128, Q1 es yodo, Q2 es bromo, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 129

Los compuestos de la Tabla 129 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es flúor, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 129 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 129, Q1 es yodo, Q3 es flúor. Asimismo, los

compuestos 2 a 299 de la Tabla 129 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 129, Q1 es yodo, Q3 es flúor.

Tabla 130

Los compuestos de la Tabla 130 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es flúor, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 130 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 130, Q1 es yodo, Q3 es flúor, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 130 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 130, Q1 es yodo, Q3 es flúor, R^1 es etilo.

Tabla 131

Los compuestos de la Tabla 131 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es flúor, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 131 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 131, Q1 es yodo, Q3 es flúor, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 131 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 131, Q1 es yodo, Q3 es flúor, m es 1.

Tabla 132

Los compuestos de la Tabla 132 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es flúor, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y

R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 132 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 132, Q1 es yodo, Q3 es flúor, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 132 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 132, Q1 es yodo, Q3 es flúor, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 133

Los compuestos de la Tabla 133 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es cloro, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 133 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 133, Q1 es yodo, Q3 es cloro. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 133 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 133, Q1 es yodo, Q3 es cloro.

Tabla 134

Los compuestos de la Tabla 134 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es cloro, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 134 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 134, Q1 es yodo, Q3 es cloro, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 134 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 134, Q1 es yodo, Q3 es cloro, R^1 es etilo.

Tabla 135

Los compuestos de la Tabla 135 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es cloro, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 135 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 135, Q1 es yodo, Q3 es cloro, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 135 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 135, Q1 es yodo, Q3 es cloro, m es 1.

Tabla 136

Los compuestos de la Tabla 136 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es cloro, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 136 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 136, Q1 es yodo, Q3 es cloro, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 136 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 136, Q1 es yodo, Q3 es cloro, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 137

Los compuestos de la Tabla 137 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es bromo, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 137 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 137, Q1 es yodo, Q3 es bromo. Asimismo, los

compuestos 2 a 299 de la Tabla 137 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 137, Q1 es yodo, Q3 es bromo.

Tabla 138

Los compuestos de la Tabla 138 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es bromo, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 138 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 138, Q1 es yodo, Q3 es bromo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 138 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 138, Q1 es yodo, Q3 es bromo, R^1 es etilo.

Tabla 139

Los compuestos de la Tabla 139 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es bromo, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 139 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 139, Q1 es yodo, Q3 es bromo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 139 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 139, Q1 es yodo, Q3 es bromo, m es 1.

Tabla 140

Los compuestos de la Tabla 140 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es bromo, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y

R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 140 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 140, Q1 es yodo, Q3 es bromo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 140 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 140, Q1 es yodo, Q3 es bromo, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 141

Los compuestos de la Tabla 141 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es metilo, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 141 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 141, Q1 es yodo, Q3 es metilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 141 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 141, Q1 es yodo, Q3 es metilo.

Tabla 142

Los compuestos de la Tabla 142 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es metilo, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 142 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 142, Q1 es yodo, Q3 es metilo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 142 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 142, Q1 es yodo, Q3 es metilo, R^1 es etilo.

Tabla 143

Los compuestos de la Tabla 143 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es metilo, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 143 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 143, Q1 es yodo, Q3 es metilo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 143 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 143, Q1 es yodo, Q3 es metilo, m es 1.

Tabla 144

Los compuestos de la Tabla 144 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q2, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, Q3 es metilo, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 144 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 144, Q1 es yodo, Q3 es metilo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 144 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 144, Q1 es yodo, Q3 es metilo, m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 145

Los compuestos de la Tabla 145 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor. Q2, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 145 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 145, Q1 es flúor. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de

la Tabla 145 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 145, Q1 es flúor.

Tabla 146

Los compuestos de la Tabla 146 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q2, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 146 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 146, Q1 es flúor, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 146 a 299 de la Tabla 146 son iguales a los compuestos 146 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 146, Q1 es flúor, R^1 es etilo.

Tabla 147

Los compuestos de la Tabla 147 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q2, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 147 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 147, Q1 es flúor, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 147 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 147, Q1 es flúor, m es 1.

Tabla 148

Los compuestos de la Tabla 148 son de la fórmula general (I) donde Q1 es flúor, Q2, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1

de la Tabla 148 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 148, Q1 es flúor, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 148 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 148, Q1 es flúor , m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 149

Los compuestos de la Tabla 149 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q2, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 149 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 149, Q1 es cloro. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 149 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 149, Q1 es cloro.

Tabla 150

Los compuestos de la Tabla 150 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q2, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 150 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 150, Q1 es cloro, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 150 a 299 de la Tabla 150 son iguales a los compuestos 150 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 150, Q1 es cloro, R^1 es etilo.

Tabla 151

Los compuestos de la Tabla 151 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q2, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 151 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 151, Q1 es cloro, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 151 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 151, Q1 es cloro, m es 1.

Tabla 152

Los compuestos de la Tabla 152 son de la fórmula general (I) donde Q1 es cloro, Q2, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 152 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 152, Q1 es cloro, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 152 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 152, Q1 es cloro , m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 153

Los compuestos de la Tabla 153 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q2, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 153 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 153, Q1 es bromo. Asimismo, los compuestos 2 a 299

de la Tabla 153 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 153, Q1 es bromo.

Tabla 154

Los compuestos de la Tabla 154 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q2, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 154 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 154, Q1 es bromo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 154 a 299 de la Tabla 154 son iguales a los compuestos 154 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 154, Q1 es bromo, R^1 es etilo.

Tabla 155

Los compuestos de la Tabla 155 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q2, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 155 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 155, Q1 es bromo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 155 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 155, Q1 es bromo, m es 1.

Tabla 156

Los compuestos de la Tabla 156 son de la fórmula general (I) donde Q1 es bromo, Q2, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1

de la Tabla 156 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 156, Q1 es bromo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 156 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 156, Q1 es bromo , m es 1, R^1 es etilo.

Tabla 157

Los compuestos de la Tabla 157 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q2, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, m es 0, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 157 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 157, Q1 es yodo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 157 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 157, Q1 es yodo.

Tabla 158

Los compuestos de la Tabla 158 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q2, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, m es 0, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 158 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 158, Q1 es yodo, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 158 a 299 de la Tabla 158 son iguales a los compuestos 158 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 158, Q1 es yodo, R^1 es etilo.

Tabla 159

Los compuestos de la Tabla 159 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q2, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, m es 1, L es O, R^1 es metilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 159 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 159, Q1 es yodo, m es 1. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 159 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 159, Q1 es yodo, m es 1.

Tabla 160

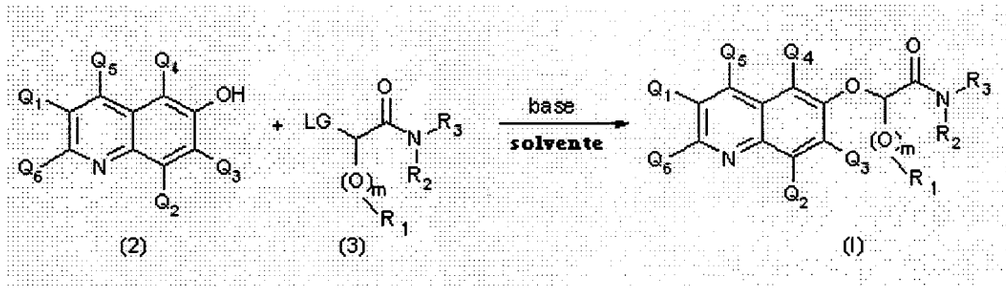
Los compuestos de la Tabla 160 son de la fórmula general (I) donde Q1 es yodo, Q2, Q3, Q4, Q5 y Q6 son hidrógeno, m es 1, L es O, R^1 es etilo, y R^2 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla. En consecuencia, el compuesto 1 de la Tabla 160 es igual al compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 160, Q1 es yodo, m es 1, R^1 es etilo. Asimismo, los compuestos 2 a 299 de la Tabla 160 son iguales a los compuestos 2 a 299 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 160, Q1 es yodo , m es 1, R^1 es etilo.

Los compuestos de la fórmula general (I) pueden prepararse como se representa en los Esquemas 1 a 9 expuestos a continuación, en los cuales Q_1, Q_2, Q_3, Q_4, Q_5, Q_6, R_1, R_2, R_3, m y L tienen los significados proporcionados anteriormente; R^6 es H o alquilo C_{1-4}, según lo indicado; R^7, R^8, R^{12}, R^{13} y R^{14} son, de modo independiente, H o alquilo C_{1-4}; R^9 y R^{10} son, de manera independiente, H o alquilo C_{1-4}, donde R^9 y R^{10} no son simultáneamente H; R^{13} y R^{14} son, de

modo independiente, H o alquilo C_{1-4} opcionalmente sustituido; R^{11} es alquilo C_{1-6}, bencilo opcionalmente sustituido, alquenilo C_{2-6} opcionalmente sustituido, alquinilo C_{2-4} opcionalmente sustituido; n es 0; 1 ó 2, a menos que se indique lo contrario. DMF es *N,N*-dimetilformamida, NBS es *N*-bromosuccinimida. Otras abreviaturas se definen en el texto. Cuando se proporcionan condiciones de proceso típicas o preferidas (temperatura de reacción, tiempo, solvente, relaciones molares de reactivos), a menos que se establezca lo contrario, pueden usarse también otras condiciones de proceso. Si bien las condiciones de reacción óptimas pueden variar con los reactivos particulares o solventes utilizados, dichas condiciones pueden ser determinadas por medio de procedimientos de optimización de rutina, por el experto en el arte.

Como se muestra en el Esquema 1, los compuestos de la fórmula general (1) pueden prepararse mediante la reacción de un compuesto de la fórmula general (2) con un compuesto de la fórmula general (3), en presencia de una base en un solvente adecuado. Los solventes típicos incluyen *N,N*-dimetilformamida y *N*-metilpirrolidin-2-ona. Las bases adecuadas comprenden carbonato de potasio, carbonato de calcio, hidruro de sodio o diisopropiletilamina.

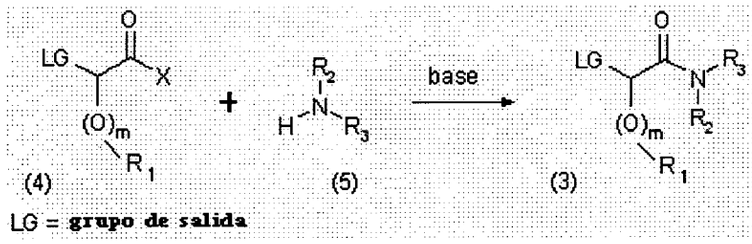
Esquema 1



Como se muestra en el Esquema 2, los compuestos de la fórmula general (3) pueden prepararse mediante la reacción de una amina de la fórmula general (5) con un ácido carboxílico activado, tal como un haluro ácido o el

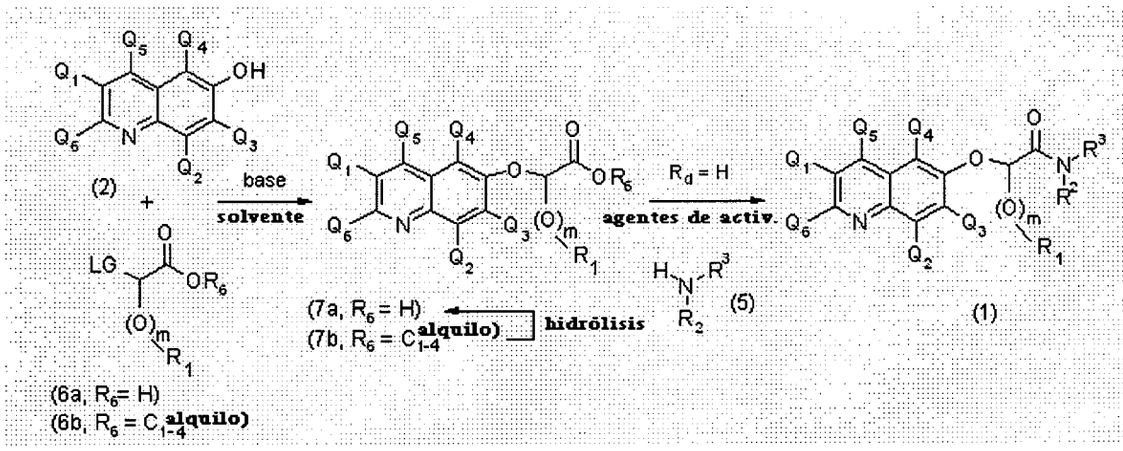
correspondiente anhídrido ácido de la fórmula general (4), en presencia de una base orgánica o inorgánica adecuada, tal como carbonato de potasio o diisopropiletilamina, en un solvente tal como diclorometano, tetrahidrofurano o N.N-dimetilformamida.

Esquema 2



Alternativamente, como se expone en el Esquema 3, los compuestos de la fórmula general (1) pueden prepararse mediante la condensación de un compuesto de la fórmula general (7a), donde R_6 es H, con una amina de la fórmula general (5), usando reactivos de activación adecuados, tales como 1-hidroxibenzotriazol (HOBt), (benzotriazol-1-iloxi)-tris-(dimetilamino)-fosfonio-hexa-fluorfosfato (BOP), 1-hidroxi-7-azabenzotriazol (HOAT) o *N*-(3-dimetilamino-propil)-*N'*-etil-carbodiimida clorhidrato (EDC).

Esquema 3

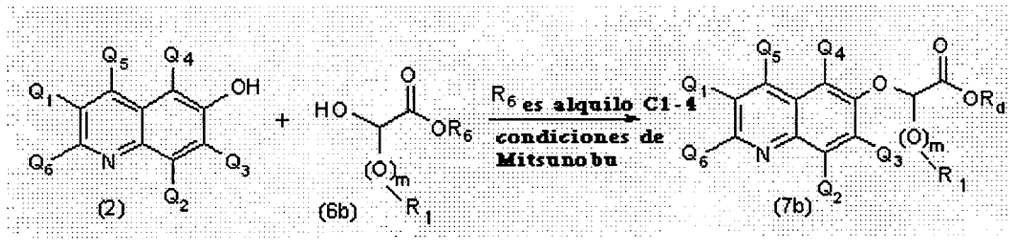


Los compuestos de la fórmula general (7a), donde R_6 es H, pueden prepararse mediante la intermediación de los compuestos de la fórmula general (7b), donde R_6 es alquilo C_{1-4}, como se muestra en el Esquema 3. Los ésteres de la fórmula general (7b), donde R_6 es alquilo C_{1-4}, pueden prepararse por medio de la reacción de un compuesto de la fórmula general (2) con un éster de la fórmula general (6a), en presencia de una base adecuada, tal como carbonato de potasio o hidruro de sodio, en un solvente adecuado, tal como *N,N*-dimetilformamida. Alternativamente, los compuestos de la fórmula general (7a), donde R_6 es H, pueden prepararse directamente por medio de la reacción de un compuesto de la fórmula general (2) con un ácido de la fórmula general (6a) donde R_6 es H. Los ésteres o ácidos de las fórmulas generales (6a) y (6b), respectivamente, pueden obtenerse en el mercado, o pueden ser preparados mediante métodos convencionales de la literatura, a partir de materiales comerciales disponibles en el mercado.

Alternativamente, como se muestra en el Esquema 4, los compuestos de la fórmula general (7b) pueden prepararse en condiciones de Mitsunobu por medio de la reacción de un compuesto de la fórmula general (2) con un compuesto de la

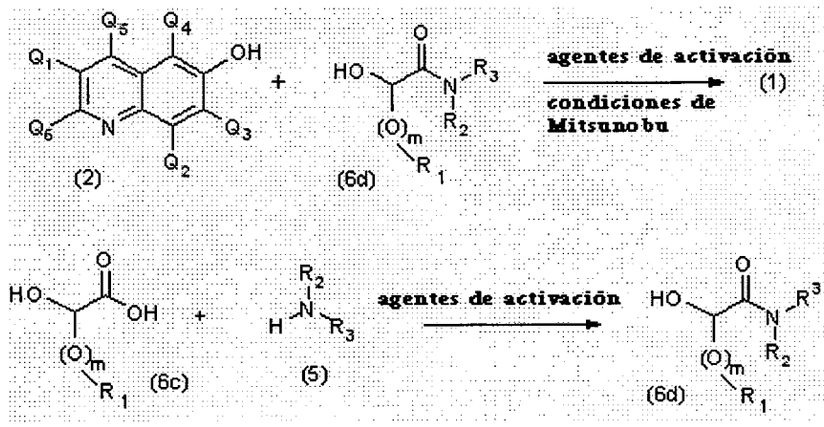
fórmula general (6b), donde R_6 es alquilo C_{1-4}, usando una fosfina, tal como trifenilfosfina, y un azoéster, tal como dietilazodicarboxilato.

Esquema 4



En otro enfoque para la preparación de compuestos de la fórmula general (1), expuesto en el Esquema 5, el compuesto de la fórmula general (6d) puede hacerse reaccionar con un compuesto de la fórmula general (2), en condiciones de Mitsunobu empleando una fosfina, tal como trifenilfosfina, y un azoéster, tal como dietilazodicarboxilato. Los compuestos de la fórmula general (6d) pueden prepararse a partir de un compuesto de la fórmula general (6c) y una amina de la fórmula general (5), usando reactivos de activación adecuados tales como 1-hidroxibenzotriazol y *N*-(3-dimetilaminopropil)-*N'*-etil-carbodiimida clorhidrato.

Esquema 5



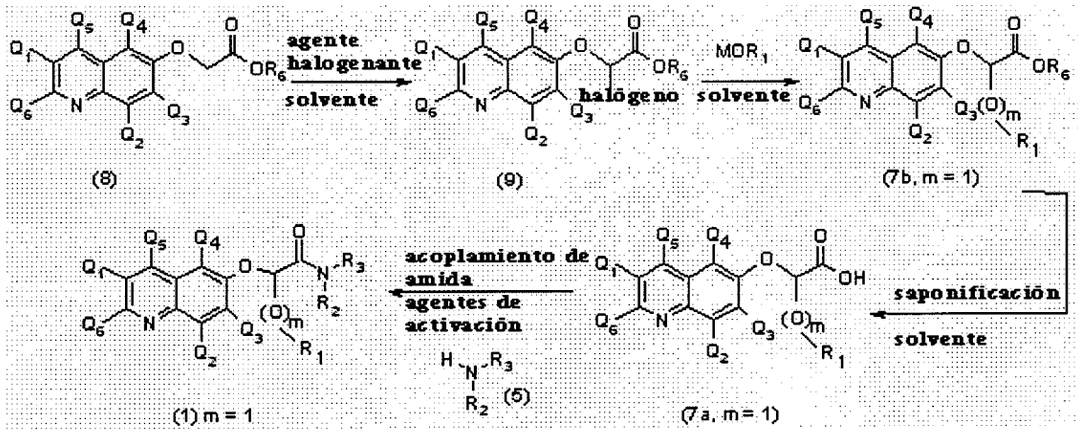
Los compuestos de la fórmula general (6c) son compuestos conocidos, o pueden ser preparados a partir de compuestos conocidos o que pueden

obtenerse en el mercado, de acuerdo con métodos conocidos por los expertos en el arte.

Además, los compuestos de la fórmula general (1) donde m es 1 pueden prepararse tal como se muestra en el Esquema 6. En consecuencia, los ésteres de la fórmula (8) pueden ser halogenados a fin de proporcionar haloésteres de la fórmula general (9), mediante el tratamiento con un agente de halogenación adecuado, tal como N-bromosuccinimida, en un solvente adecuado tal como tetracloruro de carbono, a entre temperatura ambiente y la temperatura de reflujo del solvente. Los haloésteres de la fórmula general (9) pueden hacerse reaccionar con un compuesto metálico alcalino MOR, donde M es un metal como sodio o potasio, en solvente tal como metanol o etanol, a entre 0°C y reflujo, preferentemente, a temperatura ambiente, de modo de proporcionar compuestos de la fórmula general (7b). Los ésteres (7b) pueden ser hidrolizados hasta ácidos de la fórmula general (7a), mediante el tratamiento con un hidróxido metálico alcalino, tal como hidróxido de sodio, en un alcohol acuoso, a entre temperatura ambiente y reflujo. Un ácido carboxílico de la fórmula general (7a) puede condensarse con una amina de la fórmula general (5), a fin de lograr un compuesto de la fórmula general (1), donde m es 1 y R_1 se define como con anterioridad, usando reactivos de activación tales como 1-hidroxibenzotriazol y *N*-(3-dimetilaminopropil)-*N'*-etilcarbodiimida clorhidrato.

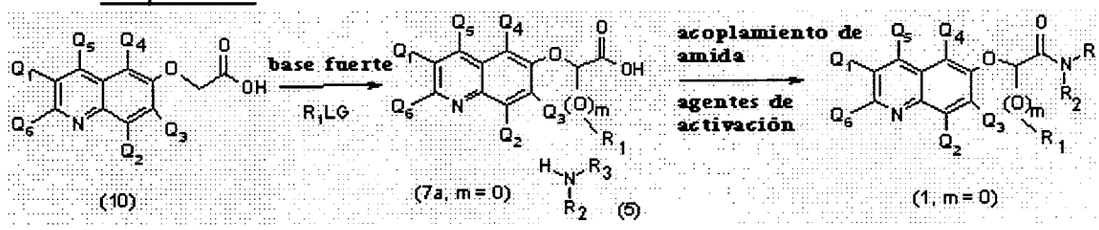
228

Esquema 6



Los compuestos de la fórmula general (1), donde m es 0, R_1 es alquilo C_{1-4}, alquenilo C_{3-4}, alquinilo C_{3-4}, o un grupo alcoxialquilo, pueden prepararse como se muestra en el Esquema 7. Por lo tanto, el derivado de ácido acético sustituido (10) puede tratarse con por lo menos dos equivalentes de una base, tal como diisopropilamida de litio, en un solvente adecuado tal como tetrahidrofurano, a una temperatura entre -78°C y temperatura ambiente, con un agente alquilante tal como R_1L a fin de proporcionar ácidos carboxílicos de la fórmula general (7a), con la acidificación.

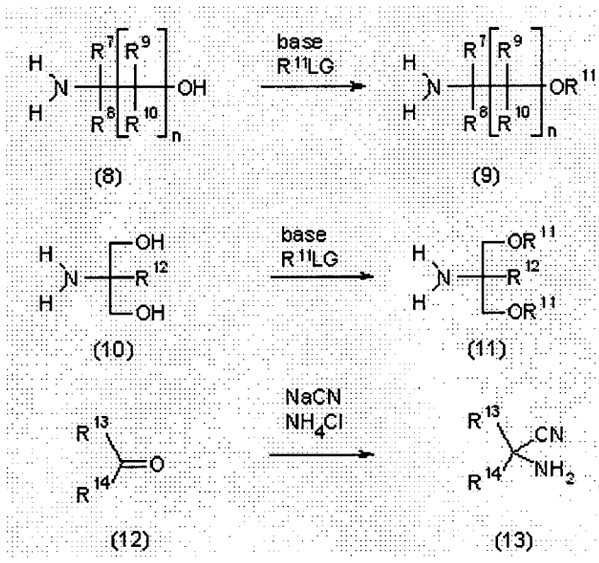
Esquema 7



Como se muestra en el Esquema 8, las aminas de la fórmula general (9) u (11), que son ejemplos de aminas de la fórmula general (5) donde R^2 es H, pueden prepararse por medio de la alquilación de un aminoalcohol de la fórmula general (8) o (10), usando una base adecuada, tal como *n*-butil litio o hidruro de sodio, seguida de la reacción con un reactivo alquilante adecuado $R^{11}LG$, tal

como un yoduro de alquilo, por ejemplo, yoduro de metilo, de manera de formar un compuesto alquilado de la fórmula general (9) u (11), respectivamente. Un derivado de carbonilo $R^{13}COR^{14}$ (12), por ejemplo, formaldehído, puede hacerse reaccionar con amoníaco, habitualmente, en forma de cloruro de amonio, y cianuro, convenientemente, en forma de una solución acuosa de cianuro de sodio, para proporcionar una α-cianoamina (13) (síntesis de Strecker).

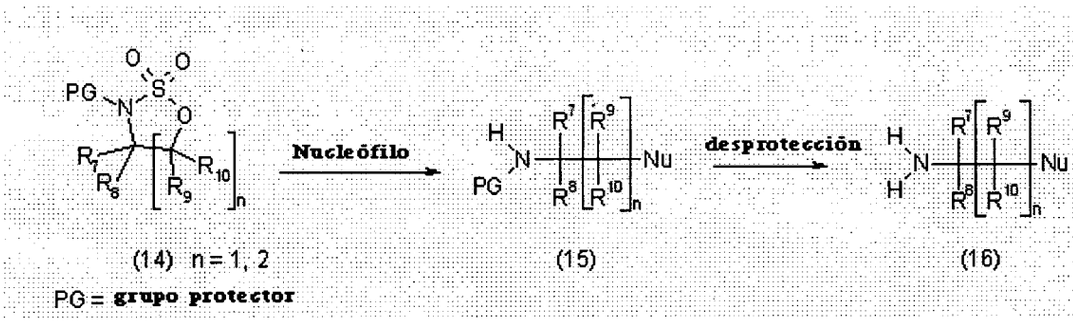
Esquema 8



Alternativamente, como se muestra en el Esquema 9, las aminas de la fórmula general (16), que son ejemplos de aminas de la fórmula general (5) donde R^2 es H, pueden prepararse por medio de la abertura nucleófila de sulfamidatos cíclicos de la fórmula general (14), donde PG es un grupo protector tal como *ter*-butil carbamato (BOC) o 4-metoxibencilo (PMB), empleando una diversidad de nucleófilos, tales como el fluoruro de tetra n-butil amonio (TBAF) y cianuro de sodio, seguida de la desprotección usando condiciones estándares (por ejemplo, HCl para la eliminación del grupo BOC, e hidrógeno y un catalizador a base de paladio, para la eliminación del grupo PMB).

230

Esquema 9

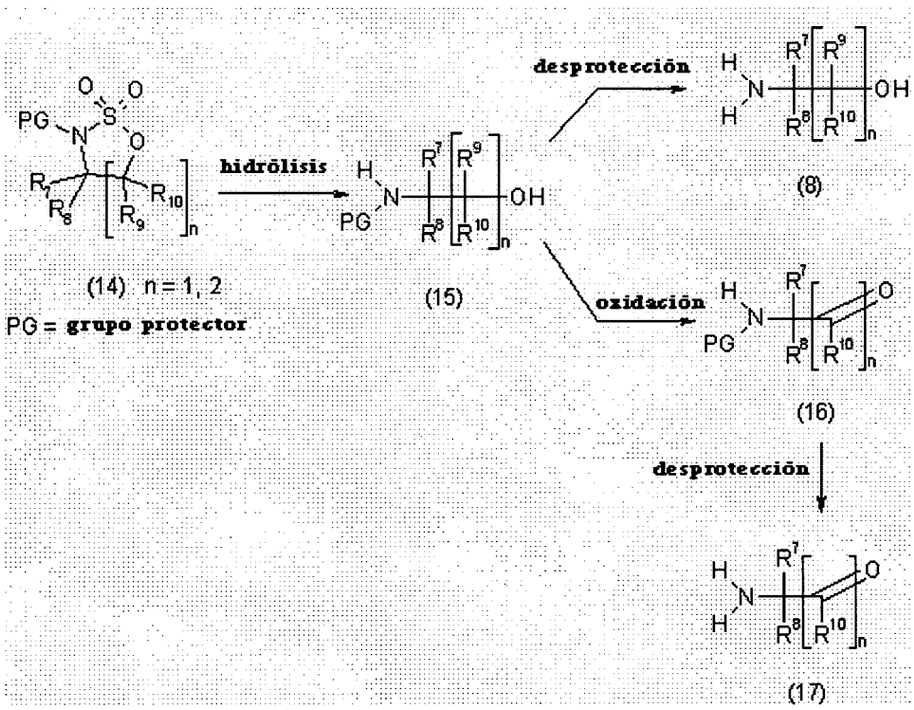


Los compuestos de la fórmula (14) pueden prepararse mediante métodos conocidos por los expertos en el arte (por ejemplo, como se describe en el *Journal of the American Chemical Society*, 2001, pp. 6935-6936).

Además, como se muestra en el Esquema 10, la hidrólisis del sulfamidato cíclico (14) proporciona el aminoalcohol N-protegido (15), que puede ser adicionalmente modificado por medio de métodos conocidos por los expertos en el arte. Por ejemplo, la desprotección de los compuestos de la fórmula general (15) usando condiciones convencionales (por ejemplo, HCl para la eliminación del grupo BOC, o hidrógeno y un catalizador a base de paladio, para la eliminación del grupo PMB) provee aminoalcoholes de la fórmula general (8), que son ejemplos de aminas de la fórmula general (5) donde R^2 es H. Alternativamente, cuando uno de R^9 y R^{10} es hidrógeno, la oxidación de los compuestos de la fórmula (15) con oxidantes tales como reactivos de yodo hipervalentes, por ejemplo, periodinano de Dess-Martin, proporciona compuestos oxidados de la fórmula (17), que son ejemplos de aminas de la fórmula general (5) donde R^2 es H, luego de la desprotección de los compuestos de la fórmula (16) empleando condiciones convencionales conocidas por los expertos en el arte.

231

Esquema 10



Otros derivados de las aminas de la fórmula general (5) pueden prepararse mediante la derivación de los compuestos de las fórmulas generales (15) y (16), empleando procedimientos estándares conocidos por los expertos en el arte.

Otras aminas de la fórmula general (5) o bien pueden obtenerse en el mercado, o pueden prepararse por medio de métodos convencionales de la literatura, conocidos por los expertos en el arte.

Las tioamidas (compuestos de la fórmula general (1) donde L = S) pueden prepararse a partir de las correspondientes amidas usando agentes tionantes, tales como pentasulfuro de fósforo, reactivos de Lawesson o Davy, o pueden prepararse a partir de los correspondientes tionoácidos o tionoésteres usando métodos convencionales de la literatura, o modificaciones convencionales.

Las quinolinas pueden obtenerse en el mercado, o pueden prepararse empleando métodos conocidos por los expertos en el arte, bien descriptos en libros de texto convencionales de química de heterocíclicos y en la literatura. Por ejemplo, dos referencias describen la síntesis de quinolinas 3 y/u 8 sustituidas:

Journal of the American Chemical Society (1955), 77; 4175; y *Journal of the American Chemical Society* (1950), 72; 393. Por lo tanto, pueden ser diseñadas numerosas vías de síntesis para las 6-hidroxiquinolinas de la fórmula general (2) de la presente invención, por cualquier experto en el arte. Ejemplos específicos de dichas reacciones se proveen en los Ejemplos 1; 5 y 6, de modo de permitir al experto en el arte la elaboración y el uso de quinolinas de la invención. Se entiende que estos ejemplos no cumplen la función, de manera alguna, de limitar el verdadero alcance de esta invención, sino que se presentan con propósitos ilustrativos.

Pueden prepararse otros compuestos de la invención mediante la transformación de los sustituyentes en los compuestos de la fórmula general (1), empleando procedimientos estándares conocidos por los expertos en el arte.

Los compuestos de la fórmula (1) son fungicidas activos, y pueden ser usados para el control de uno o más de los siguientes patógenos: *Pyricularia oryzae* (*Magnaporthe grisea*) en arroz y trigo, y otras especies *Pyricularia* en otros huéspedes; *Puccinia triticina* (o *recondita*), *Puccinia striiformis* y otras royas en trigo, *Puccinia hordei*, *Puccinia striiformis* y otras royas en cebada, y royas en otros huéspedes (por ejemplo, césped, centeno, café, peras, manzanas, maní, remolacha azucarera, vegetales y plantas ornamentales); *Erysiphe cichoracearum* en cucurbitáceas (por ejemplo, melón); *Blumeria* (o *Erysiphe*) *graminis* (mildiú polvoroso) en cebada, trigo, centeno y césped, y otros mildiús polvorosos en diversos huéspedes, tales como *Sphaerotheca macularis* en lúpulos, *Sphaerotheca fusca (Sphaerotheca fuliginea)* en cucurbitáceas (por ejemplo, pepino), *Leveillula taurica* en tomates, berenjenas y pimiento verde, *Podosphaera leucotricha* en manzanas, y *Uncinula necator* en parras; género *Cochliobolus*, género *Helminthosporium*, género *Drechslera* (género *Pyrenophora*), género *Rhynchosporium*, *Mycosphaerella graminicola* (*Septoria tritici)* y *Phaeosphaeria*

nodorum (*Stagonospora nodorum* o *Septoria nodorum*), *Pseudocercosporella herpotrichoides* y *Gaeumannomyces graminis* en cereales (por ejemplo, trigo, cebada, centeno), césped y otros huéspedes; *Cercospora arachidicola* y *Cercosporidium personatum* en maní, y otras especies *Cercospora* en otros huéspedes, por ejemplo, remolacha azucarera, bananas, soja y arroz; *Botrytis cinerea* (moho gris) en tomates, frutillas, vegetales, parras y otros huéspedes, y otras especies *Botrytis* en otros huéspedes; género *Alternaria* en vegetales (por ejemplo, zanahorias), colza de semilla oleaginosa, manzanas, tomates, papas, cereales (por ejemplo, trigo) y otros huéspedes; género *Venturia* (incluso *Venturia inaequalis* (costra)) en manzanas, peras, frutos de hueso, nogales y otros huéspedes; género *Cladosporium* en una gama de huéspedes, entre ellos, cereales (por ejemplo, trigo) y tomates; género *Monilinia* en frutos de hueso, nogales y otros huéspedes; género *Didymella* en tomates, césped, trigo, cucurbitáceas y otros huéspedes; género *Phoma* en colza de semilla oleaginosa, césped, arroz, papas, trigo y otros huéspedes; género *Aspergillus* y género *Aureobasidium* en trigo, madera y otros huéspedes; género *Ascochyta* en arvejas, trigo, cebada y otros huéspedes; género *Stemphylium* (género *Pleospora*) en manzanas, peras, cebollas y otros huéspedes; enfermedades estivales (por ejemplo, podredumbre amarga (*Glomerella cingulata*), podredumbre negra o mancha de hoja de moho azul (*Botryosphaeria obtusa*), mancha de fruto Brooks (*Mycosphaerella pomi*), roya de manzana Cedar (*Gymnosporangium juniperi-virginianae*), mancha ennegrecida (*Gloeodes pomigena*), mancha de mosca (*Schizothyrium pomi*) y podredumbre blanca (*Botryosphaeria dothidea*)) en manzanas y peras; *Plasmopara viticola* en parras; otros mildiús polvorosos, tales como *Bremia lactucae* en lechuga, género *Peronospora* en soja, tabaco, cebollas y otros huéspedes; *Pseudoperonospora humuli* en lúpulos y *Pseudoperonospora cubensis* en cucurbitáceas; género *Pythium* (incluso *Pythium ultimum*) en césped

y otros huéspedes; *Phytophthora infestans* en papas y tomates, y otras especies *Phytophthora* en vegetales, frutillas, palta, pimiento, ornamentales, tabaco, cacao y otros huéspedes; *Thanatephorus cucumeris* en arroz y césped, y otras especies *Rhizoctonia* en diversos huéspedes tales como trigo y cebada, maní, vegetales, algodón y césped; género *Sclerotinia* en césped, maní, papas, colza de semilla oleaginosa y otros huéspedes; género *Sclerotium* en césped, maní y otros huéspedes; *Gibberella fujikuroi* en arroz; género *Colletotrichum* en una gama de huéspedes, entre ellos, césped, café y vegetales; *Laetisaria fuciformis* en césped; género *Mycosphaerella* en bananas, maní, cítricos, nogales pacaneros, papaya y otros huéspedes; género *Diaporthe* en cítricos, soja, melón, peras, lupinos y otros huéspedes; género *Elsinoe* en cítricos, parras, olivos, nogales pacaneros y otros huéspedes; género *Verticillium* en una gama de huéspedes, entre ellos, lúpulos, papas y tomates; género *Pyrenopeziza* en colza de semilla oleaginosa y otros huéspedes; *Oncobasidium theobromae* en cacao que causa muerte periférica de línea vascular; género *Fusarium*, género *Typhula*, *Microdochium nivale*, género *Ustilago*, género *Urocystis*, género *Tilletia* y *Claviceps purpurea* en una variedad de huéspedes, en particular, trigo, cebada, césped y maíz; género *Ramularia* en remolacha azucarera, cebada y otros huéspedes; enfermedades poscosecha, en particular, de los frutos (por ejemplo, *Penicillium digitatum*, *Penicillium italicum* y *Trichoderma viride* en naranjas, *Colletotrichum musae* y *Gloeosporium musarum* en bananas, y *Botrytis cinerea* en uvas); otros patógenos en parras, en especial, *Eutypa lata*, *Guignardia bidwellii*, *Phellinus igniarus*, *Phomopsis viticola*, *Pseudopeziza tracheiphila* y *Stereum hirsutum*; otros patógenos en árboles (por ejemplo, *Lophodermium seditiosum*) o madera, en especial, *Cephaloascus fragrans*, género *Ceratocystis*, *Ophiostoma piceae*, género *Penicillium*, *Trichoderma pseudokoningii*, *Trichoderma viride*, *Trichoderma harzianum*, *Aspergillus niger*, *Leptographium lindbergi* y *Aureobasidium pullulans*; y vectores

fúngicos de enfermedades virales (por ejemplo, *Polymyxa graminis* en cereales como el vector del virus de mosaico amarillo de la cebada (BYMV, por sus siglas en inglés) y *Polymyxa betae* en remolacha azucarera como el vector de rizomanía).

Un compuesto de la fórmula (I) puede moverse en el tejido de la planta, en forma de acropétalo, basípeto, o localmente, contra uno o más hongos. Además, un compuesto de la fórmula (I) puede ser lo suficientemente volátil para ser activo en la fase de vapor, contra uno o más hongos en la planta.

Por lo tanto, la invención proporciona un método para combatir o controlar hongos fitopatógenos, que comprende la aplicación de una cantidad fungicidamente eficaz de un compuesto de la fórmula (I), o de una composición que contiene un compuesto de fórmula (I), a una planta, a una semilla de una planta, al sitio de la planta o semilla, o al suelo o a cualquier otro medio de crecimiento de plantas, por ejemplo, solución de nutrientes.

El término "planta", conforme a esta solicitud, comprende plántulas, cultivos de plantas útiles, arbustos y árboles. Además, el método fungicida de la invención abarca tratamientos protectores, curativos, generalizados, erradicadores y antiesporulantes.

Los cultivos de plantas útiles en los cuales puede emplearse la composición de acuerdo con la invención incluyen, especialmente, cereales, maíz, arroz, colza, remolacha azucarera, caña de azúcar, cultivos de plantación, algodón, soja, vegetales y flores. Debe entenderse que el término "cultivos" también abarca aquellos cultivos que se han vuelto tolerantes a herbicidas o a clases de herbicidas (por ejemplo, inhibidores de ALS, GS, EPSPS, PPO y HPPD), como consecuencia de métodos convencionales de cultivo o de ingeniería genética. Un ejemplo de cultivo que se ha vuelto tolerante, por ejemplo, a las imidazolinonas, tales como imazamox, por métodos convencionales de cultivo es

la colza de verano Clearfield® (canola). Ejemplos de cultivos que se han vuelto tolerantes a herbicidas por medio de métodos de la ingeniería genética incluyen, por ejemplo, variedades de maíz resistentes a glifosato y glufosinato, que pueden obtenerse en el mercado con las denominaciones comerciales RoundupReady® y LibertyLink®. Las malas hierbas que deben ser controladas pueden ser malas hierbas tanto monocotiledóneas como dicotiledóneas, tales como *Stellaria, Nasturtium, Agrostis, Digitaria, Avena, Setaria, Sinapis, Lolium, Solanum, Echinochloa, Scirpus, Monochoria, Sagittaria, Bromus, Alopecurus, Sorghum, Rottboellia, Cyperus, Abutilon, Sida, Xanthium, Amaranthus, Chenopodium, Ipomoea, Chrysanthemum, Galium, Viola* y *Veronica.*

Debe entenderse que los cultivos también abarcan aquellos que se han tornado resistentes a insectos nocivos por medio de métodos de la ingeniería genética, por ejemplo, maíz Bt (resistente al perforador del maíz europeo), algodón Bt (resistente al gorgojo del algodón) y, además, papas Bt (resistentes al escarabajo de Colorado). Ejemplos de maíz Bt son los híbridos de maíz Bt 176 de NK® (Syngenta Seeds). La toxina Bt es una proteína formada naturalmente por la bacteria de suelo *Bacillus thuringiensis*. Ejemplos de toxinas y de plantas transgénicas capaces de sintetizar dichas toxinas se describen en los documentos EP-A-451 878; EP-A-374 753; WO 93/07278; WO 95/34656; WO 03/052073; y EP-A-427 529. Ejemplos de plantas transgénicas que contienen uno o más genes que codifican para resistencia insecticida y expresan una o más toxinas son KnockOut® (maíz), Yield Gard® (maíz), NuCOTIN33B® (algodón), Bollgard® (algodón), NewLeaf® (papa), NatureGard® y Protexcta®. Los cultivos de plantas y su material de semillas pueden ser resistentes a herbicidas, y al mismo tiempo, resistentes a la alimentación de insectos (eventos transgénicos "acumulados"). Por ejemplo, las semillas pueden tener la capacidad de expresar una proteína Cry3 insecticidamente activa, y al mismo tiempo, pueden ser tolerantes a

glifosato. Debe entenderse que el término "cultivos" abarca también aquellos cultivos que se obtienen por métodos convencionales de cultivo o de ingeniería genética, y que contienen los así denominados rasgos de rendimiento (por ejemplo, mejor sabor, estabilidad de almacenamiento y contenido nutricional).

Se entiende que las áreas de cultivo abarcan la tierra donde ya crecen las plantas de cultivo, y la tierra propuesta para el cultivo de dichas plantas de cultivo.

Los compuestos de la fórmula (I) se usan, preferentemente, para propósitos agrícolas, hortícolas o para aplicaciones en césped, en forma de una composición.

A fin de aplicar un compuesto de la fórmula (I) a una planta, semilla de planta, al sitio de la planta o semilla, al suelo o a cualquier otro medio de crecimiento, habitualmente se formula un compuesto de la fórmula (I) en una composición que comprende, además del compuesto de la fórmula (I), un portador o diluyente inerte adecuado, y en forma opcional, un agente tensioactivo (ATA). Los ATA son agentes químicos que pueden modificar las propiedades de una interfaz (por ejemplo, interfaces líquida/sólida, líquida/aire o líquida/líquida), disminuyendo la tensión de interfaz y, de esa manera, conduciendo a cambios en otras propiedades (por ejemplo, dispersión, emulsión y humectación). Se prefiere que todas las composiciones (tanto formulaciones sólidas como líquidas) comprendan, en peso, 0,0001 a 95%, más preferentemente, 1 a 85%, por ejemplo, 5 a 60%, de un compuesto de la fórmula (I). La composición, en general, se usa para el control de hongos, de manera que se aplica un compuesto de la fórmula (I) en una proporción de desde 0,1 g hasta 10 kg por hectárea, preferentemente, desde 1 g hasta 6 kg por hectárea, más preferentemente, desde 1 g hasta 1 kg por hectárea.

Cuando se emplea en un abono de semillas, se usa un compuesto de la fórmula (I) en una proporción de 0,0001 g a 10 g (por ejemplo, 0,001 g ó 0,05 g),

preferentemente, 0,005 g a 10 g, más preferentemente, 0;005 g a 4 g, por kilogramo de semillas.

En otro aspecto, la presente invención proporciona una composición fungicida que comprende una cantidad fungicidamente eficaz de un compuesto de la fórmula (I) y un portador o diluyente adecuado para dicho compuesto.

En aun otro aspecto, la invención proporciona un método para combatir y controlar hongos en un sitio, que comprende el tratamiento de los hongos o del sitio de los hongos, con una cantidad fungicidamente eficaz de una composición que comprende un compuesto de la fórmula (I).

Las composiciones pueden seleccionarse de una cantidad de tipos de formulaciones, entre ellos, polvos para espolvoreo (PE), polvos solubles (PS), gránulos solubles en agua (GSA), gránulos dispersables en agua (GDA), polvos para mezclar con agua (PMA), gránulos (GR) (liberación lenta o rápida), concentrados solubles (SL), líquidos miscibles con aceite (LA), líquidos de volumen ultrabajo (UL), concentrados emulsionables (CE), concentrados dispersables (CD), emulsiones (tanto de aceite en agua (EA) como de agua en aceite (EAc)), microemulsiones (ME), concentrados de suspensión (CSUS), aerosoles, formulaciones para neblina/humo, suspensiones para cápsulas (SCAP) y formulaciones para tratamiento de semillas. El tipo de formulación seleccionado en cualquier caso dependerá del propósito particular contemplado y de las propiedades físicas, químicas y biológicas del compuesto de la fórmula (I).

Los polvos para espolvoreo (PE) se pueden preparar mezclando un compuesto de la fórmula (I) con uno o más diluyentes sólidos (por ejemplo, arcillas naturales, caolín, pirofilita, bentonita, alúmina, montmorilonita, kieselguhr, creta, tierra de diatomeas, fosfatos cálcicos, carbonatos de calcio y magnesio, azufre, cal, harinas, talco y otros portadores sólidos orgánicos e inorgánicos) y moliendo en forma mecánica la mezcla hasta obtener un polvo fino.

Los polvos solubles (PS) se pueden preparar mezclando un compuesto de la fórmula (I) con una o más sales inorgánicas solubles en agua (tales como bicarbonato de sodio, carbonato de sodio, o sulfato de magnesio) o uno o más sólidos orgánicos solubles en agua (tales como un polisacárido) y, opcionalmente, uno o más agentes humectantes, uno o más agentes dispersantes o una mezcla de dichos agentes, a fin de mejorar la dispersabilidad/solubilidad en agua. La mezcla luego es molida hasta obtener un polvo fino. Además se pueden granular composiciones similares, para formar gránulos solubles en agua (GSA).

Los polvos para mezclar con agua (PMA) se pueden preparar mezclando un compuesto de la fórmula (I) con uno o más portadores o diluyentes sólidos, uno o más agentes humectantes, preferentemente, uno o más agentes dispersantes, y en forma opcional, uno o más agentes de suspensión a fin de facilitar la dispersión en líquidos. La mezcla luego es molida hasta obtener un polvo fino. Además se pueden granular composiciones similares para formar gránulos dispersables en agua (GDA).

Los gránulos (GR) se pueden formar ya sea mediante la granulación de una mezcla de un compuesto de la fórmula (I) y uno o más portadores o diluyentes sólidos en polvo, ya sea a partir de gránulos vacíos previamente formados, que absorben un compuesto de la fórmula (I) (o una solución de dicho compuesto, en un agente adecuado) en un material granular poroso (tal como piedra pómez, arcillas de atapulguita, tierra de batán, kieselguhr, tierra de diatomeas o mazorcas de maíz molidas), o que adsorben un compuesto de la fórmula (I) (o una solución de dicho compuesto en un agente adecuado) en un material de núcleo duro (tal como arenas, silicatos, carbonatos minerales, sulfatos o fosfatos), y secando en caso de ser necesario. Los agentes utilizados comúnmente para auxiliar en la absorción o adsorción comprenden solventes (tales como solventes de hidrocarburos aromáticos y alifáticos, alcoholes, éteres,

cetonas y ésteres) y agentes para la adhesión (tales como acetatos de polivinilo, alcoholes de polivinilo, dextrinas, azúcares y aceites vegetales). Además, pueden agregarse a los gránulos uno o más aditivos (por ejemplo, un agente emulsionante, agente humectante o agente dispersante).

Los concentrados dispersables (CD) se pueden preparar disolviendo un compuesto de la fórmula (I) en agua o un solvente orgánico, tal como una cetona, un alcohol o éter glicólico. Estas soluciones pueden contener un agente tensioactivo (por ejemplo, para mejorar la dilución en agua o evitar la cristalización en un depósito de pulverización).

Los concentrados emulsionables (CE) o emulsiones de aceite en agua (EA) se pueden preparar disolviendo un compuesto de la fórmula (I) en un solvente orgánico (que en forma opcional, contiene uno o más agentes humectantes, uno o más agentes emulsionantes o una mezcla de dichos agentes). Los solventes orgánicos adecuados para el uso en CE comprenden hidrocarburos aromáticos (tales como alquilbencenos o alquilnaftalenos, ejemplificados por SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 y SOLVESSO 200; SOLVESSO es una marca registrada), cetonas (tales como ciclohexanona o metilciclohexanona), alcoholes (tales como alcohol bencílico, alcohol furfurílico o butanol), *N*-alquilpirrolidonas (tales como *N*-metilpirrolidona o *N*-octilpirrolidona), dimetilamidas de ácidos grasos (tales como dimetilamida de ácido graso C_8-C_{10}) e hidrocarburos clorados. Un producto de CE puede emulsionarse espontáneamente con el agregado de agua, a fin de producir una emulsión con suficiente estabilidad como para permitir la aplicación por medio de la pulverización mediante el equipamiento apropiado. La preparación de una EA supone la obtención de un compuesto de la fórmula (I), ya sea como un líquido (si no es líquido a temperatura ambiente, puede fusionarse a una temperatura razonable, en general, inferior a 70°C), ya sea en solución (mediante la disolución en un solvente apropiado), y luego, la emulsión de la solución o el

líquido resultante en agua que contiene uno o más ATA, en condiciones de alto corte, para obtener una emulsión. Los solventes adecuados para el uso en EA comprenden aceites vegetales, hidrocarburos clorados (tales como clorobencenos), solventes aromáticos (tales como alquilbencenos o alquilnaftalenos) y otros solventes orgánicos apropiados que tienen baja solubilidad en agua.

Las microemulsiones (ME) se pueden preparar mezclando agua con una combinación de uno o más solventes con uno o más ATA, para producir de manera espontánea una formulación líquida isotrópica termodinámicamente estable. Un compuesto de la fórmula (I) se presenta inicialmente ya sea en el agua, ya sea en la combinación de solvente/ATA. Los solventes adecuados para el uso en ME comprenden aquellos descriptos anteriormente para el uso en CE o EA. Una ME puede ser o bien un sistema de aceite en agua, o de agua en aceite (la determinación del sistema presente puede realizarse por medio de mediciones de conductividad), y puede ser adecuada para la mezcla de pesticidas solubles en agua y solubles en aceites en la misma formulación. Una ME es adecuada para la dilución en agua, ya que o bien permanece como una microemulsión, o forma una emulsión convencional de aceite en agua.

Los concentrados de suspensión (CSUS) pueden comprender suspensiones acuosas o no acuosas de partículas sólidas insolubles finamente divididas de un compuesto de la fórmula (I). Los CSUS se pueden preparar mediante la molienda de cuentas o bolas del compuesto sólido de la fórmula (I) en un medio adecuado, en forma opcional, con uno o más agentes dispersantes, a fin de producir una suspensión de partículas finas del compuesto. Pueden agregarse uno o más agentes humectantes en la composición, y se puede incluir un agente de suspensión a fin de reducir la velocidad a la cual se asientan las partículas. Alternativamente, un compuesto de la fórmula (I) se puede moler en

seco y agregar a agua que contiene agentes descriptos anteriormente, a fin de producir el producto final deseado.

Las formulaciones en aerosol comprenden un compuesto de la fórmula (I) y un propulsor adecuado (por ejemplo, *n*-butano). Un compuesto de la fórmula (I) también se puede disolver o dispersar en un medio apropiado (por ejemplo, agua o un líquido miscible con agua, tal como *n*-propanol), a fin de proporcionar composiciones para el uso en bombas de pulverización manuales, no presurizadas.

Puede mezclarse un compuesto de la fórmula (I) en estado seco con una mezcla pirotécnica, a fin de formar una composición adecuada para generar, en un espacio cerrado, un humo que contiene el compuesto.

Las suspensiones para cápsulas (SCAP) se pueden preparar de manera similar a la preparación de formulaciones EA, pero con una etapa adicional de polimerización, de modo de obtener una dispersión acuosa de gotas de aceite, en la cual cada gota de aceite está encapsulada por un caparazón polimérico y contiene un compuesto de la fórmula (I), y en forma opcional, un portador o diluyente para dicho compuesto. El caparazón polimérico puede elaborarse ya sea mediante una reacción de policondensación de interfaz, ya sea por medio de un procedimiento de coacervación. Las composiciones pueden proveer la liberación controlada del compuesto de la fórmula (I), y se pueden usar para el tratamiento de semillas. Además, un compuesto de la fórmula (I) puede ser formulado en una matriz polimérica biodegradable, a fin de lograr la liberación lenta y controlada del compuesto.

Una composición puede comprender uno o más aditivos a fin de mejorar el comportamiento biológico de la composición (por ejemplo, mejorando la humectación, retención o distribución sobre las superficies; la resistencia a la lluvia sobre las superficies tratadas; o la absorción o movilidad de un compuesto

de la fórmula (I)). Dichos aditivos incluyen agentes tensioactivos, aditivos para la pulverización a base de aceites, por ejemplo, ciertos aceites minerales o aceites de plantas naturales (tales como aceite de soja y de semilla de colza), y combinaciones de estos con otros coadyuvantes biomejoradores (ingredientes que pueden ayudar a la acción de un compuesto de la fórmula (I), o mejorar dicha acción).

Un compuesto de la fórmula (I) además se puede formular para el uso como un tratamiento de semillas, por ejemplo, como una composición en polvo, tal como un polvo para tratamiento de semillas en seco (SE), un polvo soluble en agua (SS) o un polvo dispersable en agua para tratamiento en suspensión (WS), o como una composición líquida, por ejemplo, un concentrado fluible (FS), una solución (LS) o una suspensión para cápsula (SCAP). Las preparaciones de composiciones SE, SS, WS, FS y LS son muy similares a aquellas, respectivamente, de composiciones PE, PS, PMA, CSUS y CD descriptas anteriormente. Las composiciones para el tratamiento de semillas pueden comprender un agente para auxiliar a la adhesión de la composición a las semillas (por ejemplo, un aceite mineral o una barrera formadora de película).

Los agentes humectantes, agentes dispersantes y agentes emulsionantes pueden ser agentes de la clase ATA del tipo catiónico, aniónico, anfótero o no iónico.

Los ATA adecuados del tipo catiónico comprenden compuestos de amonio cuaternario (por ejemplo, bromuro de cetiltrimetil amonio), imidazolinas y sales de aminas.

Los ATA aniónicos adecuados comprenden sales metálicas alcalinas de ácidos grasos, sales de monoésteres alifáticos de ácido sulfúrico (por ejemplo, laurilsulfato de sodio), sales de compuestos aromáticos sulfonados (por ejemplo, dodecilbencenosulfonato de sodio, dodecilbencenosulfonato de calcio,

butilnaftaleno sulfonato y mezclas de diisopropil- y triisopropil-naftaleno sulfonatos sódicos), éter sulfatos, éter sulfatos alcohólicos (por ejemplo, lauret-3-sulfato sódico), éter carboxilatos (por ejemplo, lauret-3-carboxilato sódico), ésteres de fosfato (productos de la reacción entre uno o más alcoholes grasos y ácido fosfórico (principalmente, monoésteres) o pentóxido de fósforo (principalmente, diésteres), por ejemplo, la reacción entre lauril alcohol y ácido tetrafosfórico; adicionalmente, estos productos pueden ser etoxilados), sulfosuccinamatos, parafina u olefina sulfonatos, tauratos y lignosulfonatos.

Los ATA adecuados del tipo anfótero comprenden betaínas, propionatos y glicinatos.

Los ATA apropiados del tipo no iónico abarcan productos de condensación de óxidos de alquileno, tales como óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de estos, con alcoholes grasos (tales como alcohol oleílico o alcohol cetílico) o con alquilfenoles (tales como octilfenol, nonilfenol u octilcresol); ésteres parciales derivados de ácidos grasos de cadena larga o anhídridos de hexitol; productos de condensación de dichos ésteres parciales con óxido de etileno; polímeros de bloques (que comprenden óxido de etileno y óxido de propileno); alcanolamidas; ésteres simples (por ejemplo, ésteres de polietilenglicol de ácidos grasos); óxidos de aminas (por ejemplo, óxido de lauril dimetil amina); y lecitinas.

Los agentes de suspensión adecuados comprenden coloides hidrófilos (tales como polisacáridos, polividona o carboximetilcelulosa de sodio) y arcillas de dilatación (tales como bentonita o atapulgita).

Puede aplicarse un compuesto de la fórmula (I) mediante cualquiera de los medios conocidos para la aplicación de compuestos fungicidas. Por ejemplo, se puede aplicar directamente, formulado o sin formular, a cualquier parte de la planta, por ejemplo, el follaje, los tallos, las ramas o raíces, a las semillas antes de

la plantación, o a otros medios de crecimiento o plantación de las plantas (tales como el suelo que rodea las raíces, suelo en general, agua de arrozales o sistemas de cultivo hidropónicos), o puede pulverizarse, espolvorearse, aplicarse por medio de sumergido, aplicarse como una formulación en crema o pasta, aplicarse como un vapor, o aplicarse mediante distribución o incorporación de una composición (tal como una composición granular o una composición envasada en una bolsa soluble en agua) en suelo o un entorno acuoso.

Un compuesto de la fórmula (I) además puede ser inyectado en las plantas o rociado sobre la vegetación, usando técnicas de pulverización electrodinámica u otros métodos de bajo volumen; o puede ser aplicado mediante sistemas de irrigación aérea o terrestre.

Las composiciones para el uso como preparaciones acuosas (dispersiones o soluciones acuosas), en general, se suministran en forma de un concentrado que contiene una alta proporción del ingrediente activo, en donde dicho concentrado se agrega a agua antes del uso. A menudo, es necesario que estos concentrados, que pueden abarcar CD, CSUS, CE, EA, ME, GSA, PS, PMA, GDA y SCAP, soporten largos períodos de almacenamiento, y que luego de dicho almacenamiento, puedan ser agregados a agua a fin de formar preparaciones acuosas que permanezcan homogéneas durante un lapso suficiente para permitir la aplicación mediante equipamiento convencional de pulverización. Dichas preparaciones acuosas pueden contener diversas cantidades de un compuesto de la fórmula (I) (por ejemplo, 0,0001 a 10% en peso), según el propósito de su uso.

Un compuesto de la fórmula (I) se puede usar en mezclas con fertilizantes (por ejemplo, fertilizantes que contienen nitrógeno, potasio o fósforo). Los tipos de formulaciones adecuados comprenden gránulos de fertilizante. Las mezclas contienen, apropiadamente, hasta 25% en peso del compuesto de la fórmula (I).

La invención, por lo tanto, provee además una composición de fertilizante que comprende un fertilizante y un compuesto de la fórmula (I).

Las composiciones de esta invención pueden contener otros compuestos que tienen actividad biológica, por ejemplo, micronutrientes o compuestos que tienen actividad fungicida similar o complementaria, o que poseen actividad reguladora del crecimiento de las plantas, herbicida, insecticida, nematicida o acaricida.

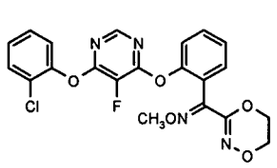
Mediante la incorporación de otro fungicida, la composición resultante puede tener un espectro de actividad más amplio, o un mayor nivel de actividad intrínseca que el compuesto de la fórmula (I) solo. Además, el otro fungicida puede tener un efecto sinérgico sobre la actividad fungicida del compuesto de la fórmula (I).

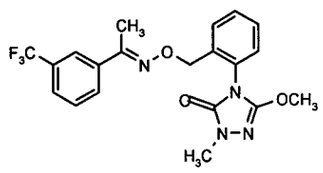
El compuesto de la fórmula (I) puede ser el único ingrediente activo de la composición, o puede estar en mezcla con uno o más ingredientes activos adicionales, por ejemplo, un pesticida, fungicida, sinergista, herbicida o regulador del crecimiento de las plantas, cuando sea apropiado. Un ingrediente activo adicional puede: proveer una composición que tiene un espectro de actividad más amplio o mayor persistencia en un lugar; provocar un efecto sinérgico de la actividad o complementar la actividad (por ejemplo, incrementando la velocidad de efecto, o superando la fuerza repelente) del compuesto de la fórmula (I); o ayudar a superar o evitar la manifestación de resistencia a componentes individuales. El ingrediente activo adicional particular dependerá de la utilidad propuesta de la composición.

Ejemplos de compuestos fungicidas que pueden incluirse en la composición de la invención son AC 382042 (*N*-(1-ciano-1,2-dimetilpropil)-2-(2,4-diclorofenoxi) propionamida), acibenzolar-S-metilo, alanicarb, aldimorph, anilazina, azaconazol, azafenidina, azoxiestrobina, benalaxil, benomil,

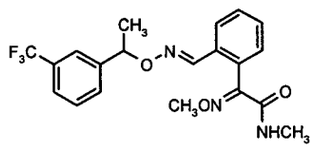
bentiavalicarb, biloxazol, bitertanol, blasticidina S, boscalid (nueva denominación de nicobifeno), bromuconazol, bupirimato, captafol, captano, carbendazim, carbendazim clorhidrato, carboxina, carpropamid, carvona, CGA 41396, CGA 41397, quinometionato, clorbenztiazona, clorotalonil, clorozolinato, clozilacona, compuestos que contienen cobre tales como oxicloruro de cobre, oxiquinolato de cobre, sulfato de cobre, talato de cobre y mezcla Bordeaux, ciamidazosulfamid, ciazofamid (IKF-916), ciflufenamid, cimoxanil, ciproconazol, ciprodinil, debacarb, di-2-piridil disulfuro, 1,1'-dióxido, diclofluanid, diclocimet, diclomezina, diclorano, dietofencarb, difenoconazol, difenzoquat, diflumetorim, *O,O*-di-*iso*-propil-*S*-bencil tiofosfato, dimefluazol, dimetconazol, dimetirimol, dimetomorph, dimoxiestrobina, diniconazol, dinocap, ditianona, cloruro de dodecil dimetil amonio, dodemorph, dodina, doguadina, edifenphos, epoxiconazol, etaboxam, etirimol, etil *(Z)*-*N*-bencil-*N*-([metil(metil-tioetilidenoaminoxicarbonil)amino]tio)-β-alaninato, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamid, fenoxanil (AC 382042), fenpiclonil, fenpropidina, fenpropimorph, fentina acetato, fentina hidróxido, ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonil, flumetover, flumorph, fluorimida, fluoxaestrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutolanil, flutriafol, folpet, fosetil-aluminio, fuberidazol, furalaxil, furametpir, guazatina, hexaconazol, hidroxisoxazol, himexazol, imazalil, imibenconazol, iminoctadina, iminoctadina triacetato, ipconazol, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb, isopropanil butil carbamato, isoprotiolano, kasugamicina, kresoxim-metilo, LY186054, LY211795, LY248908, mancozeb, maneb, mefenoxam, mepanipirim, mepronil, metalaxil, metalaxil M, metconazol, metiram, metiram-zinc, metominoestrobina, metrafenona, MON65500 (*N*-alil-4,5-dimetil-2-trimetilsililtiofen-3-carboxamida), miclobutanil, NTN0301, neoasozina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropilo, nuarimol, ofurace, compuestos de organomercurio, orisaestrobina, oxadixil, oxasulfurona, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxina, pefurazoato,

penconazol, pencicurona, óxido de fenazina, ácidos de fósforo, ftalida, picoxiestrobina, polioxina D, poliram, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propamocarb clorhidrato, propiconazol, propineb, ácido propiónico, proquinazid, protioconazol, piraclostrobina, pirazophos, pirifenox, pirimetanil, piroquilona, piroxifur, pirrolnitrina, compuestos de amonio cuaternario, quinometionato, quinoxifeno, quintozeno, siltiofam (MON 65500), S-imazalil, simeconazol, sipconazol, pentaclorofenato de sodio, espiroxamina, estreptomicina, azufre, tebuconazol, tecloftalam, tecnazeno, tetraconazol, tiabendazol, tifluzamida, 2-(tiocianometiltio)benzotiazol, tiofanato-metilo, tiram, tiadinil, timibenconazol, tolclofos-metilo, tolilfluanid, triadimefona, triadimenol, triazbutilo, triazóxido, triciclazol, tridemorph, trifloxiestrobina, triflumizol, triforina, triticonazol, validamicina A, vapam, vinclozolina, XRD-563, zineb, ziram, zoxamida y compuestos de las fórmulas:





y



Los compuestos de la fórmula (I) pueden mezclarse con suelo, turba u otro medio de raíz, para la protección de las plantas contra enfermedades fúngicas foliares, transportadas por el suelo o transportadas por las semillas.

Algunas mezclas pueden comprender ingredientes activos que tienen propiedades físicas, químicas o biológicas significativamente diferentes, de modo que no se prestan con facilidad al mismo tipo de formulación convencional. En estas circunstancias, pueden prepararse otros tipos de formulaciones. Por ejemplo, cuando un ingrediente activo es un sólido insoluble en agua y el otro es un líquido insoluble en agua, puede ser posible, no obstante, dispersar cada ingrediente activo en la misma fase acuosa continua, mediante la dispersión del

ingrediente activo sólido como una suspensión (usando una preparación análoga a la de un CSUS), y la dispersión del ingrediente activo líquido como una emulsión (usando una preparación análoga a la de una EA). La composición resultante es una formulación de suspoemulsión (SE).

La invención se ilustra por medio de los siguientes Ejemplos, en los cuales se utilizan las abreviaturas expuestas a continuación:

ml = mililitros
g = gramos
ppm = partes por millón
M^+ = ion de masa
s = singulete
d = doblete
br s = singulete amplio
t = triplete
DMSO = dimetilsulfóxido
RMN = resonancia magnética nuclear
HPLC = cromatografía líquida de alto rendimiento
q = cuartete
m = multiplete

Ejemplo 1.

Este ejemplo ilustra la preparación de 2-(3-bromo-quinolin-6-iloxi)-N-*ter*-butil-butiramida (Compuesto Nro. 12 de la Tabla 154) de acuerdo con el Esquema 3 donde m = 0.

Etapa 1: Preparación de éster etílico de ácido 2-(3-bromo-quinolin-6-iloxi)-butírico.

Se disolvió 3-bromo-quinolin-6-ol (11,3 g) (preparación descripta en la referencia: *Liebigs Ann. Chem.,* 1966, 98-106) en DMF seca (100 ml). Se agregaron éster etílico de ácido 2-bromo-butírico (11,05 g) y carbonato de potasio seco (20,9 g) a la mezcla, a temperatura ambiente. La suspensión resultante se agitó a 70°C durante 1 hora. Se vertió la mezcla de reacción en salmuera. Luego de la eliminación del precipitado y de la separación de las dos fases, la capa acuosa se extrajo dos veces con acetato de etilo (2 x 100 ml). Las capas

orgánicas se combinaron, se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se evaporaron, a fin de obtener éster etílico de ácido 2-(3-bromo-quinolin-6-iloxi)-butírico en forma de un aceite (17,8), que se usó en la siguiente etapa sin purificación adicional.

^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8,78 (1H,d); 8,15 (1H,d); 7,98 (1H,d); 7,42 (1H,d x d); 6,90 (1H,d); 4,70 (1H,t); 4,25 (2H,q); 2,08 (2H,m); 1,25 (3H, t); 1,13 (3H,t).

Etapa 2: Preparación de ácido 2-(3-bromo-quinolin-6-iloxi)-butírico.

A una suspensión de éster etílico de ácido 2-(3-bromo-quinolin-6-iloxi)-butírico (17,8 g) en una mezcla (500 ml) de tetrahidrofurano/agua (1/1) a 0°C, se agregó hidróxido de litio, monohidrato (2,31 g). La mezcla de reacción se dejó entibiar hasta temperatura ambiente y se agitó durante la noche. Se agregó acetato de etilo, y se separaron las dos fases. La fase acuosa se acidificó con ácido clorhídrico acuoso diluido, y luego se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas se combinaron, se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se evaporaron, a fin de obtener ácido 2-(3-bromo-quinolin-6-iloxi)-butírico en forma de un polvo de color marrón (13,1), que se usó en la siguiente etapa sin otra purificación.

^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8,70 (1H,d); 8,13 (1H,d); 7,92 (1H,d); 7,35 (1H, d x d); 6,90 (1H,d); 4,70 (1H,t); 3,3-2,5 (1H, br); 2,05 (2H,m); 1,10 (3H,t).

Etapa 3: Preparación de 2-(3-bromo-quinolin-6-iloxi)-N-ter-butil-butiramida.

Se agitaron, a temperatura ambiente, ácido 2-(3-bromo-quinolin-6-iloxi)-butírico (0,209 g), N-*ter*-butil amina (0,074 ml), 1-hidroxi-7-azabenzotriazol (HOAT) (0,097 g), clorhidrato de *N*-(3-dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida (EDC) (0,137 g) y trietilamina (0,098 ml) en N,N-dimetilformamida seca (7 ml), durante 3,5 horas. La mezcla de reacción se apagó con agua y se vertió en un cartucho Chromabond-XTR, y luego se eluyó con acetato de etilo (130 ml). La mezcla bruta se purificó mediante la HPLC de fase inversa (acetonitrilo-agua), a

fin de obtener 2-(3-bromo-quinolin-6-iloxi)-N-ter-butil-butiramida en forma de un aceite (0,16 g).

^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8,70 (1H,d); 8,12 (1H,d); 7,92 (1H,d); 7,32 (1H, d x d); 6,92 (1H,d); 6,05 (1H, br s); 4,43 (1H,m); 1,92 (2H, m); 1,20 (9H, s); 0,98 (3H, t).

Las siguientes amidas se prepararon usando un procedimiento similar.

Compuesto Nro. 47 de la Tabla 154: 2-(3-Bromo-quinolin-6-iloxi)-N-(2-metoxi-1,1-dimetil-etil)-butiramida, usando 2-metoxi-1,1-dimetil-etilamina.

^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8,75 (1H, d); 8,15 (1H, d); 7,96 (1H, d); 7,38 (1H, d x d); 7,0 (1H, d); 6,42 (1H, br s); 4,50 (1H, m); 3,25 (2H, m); 3,23 (3H, s); 2,02 (2H, m); 1,31 (3H, s); 1,24 (3H, s); 1,05 (3H, t).

Compuesto Nro. 52 de la Tabla 154: 2-(3-Bromo-quinolin-6-iloxi)-N-(1-ciano-2-metoxi-1-metil-etil)-butiramida, usando 2-amino-3-metoxi-2-metil-propionitrilo.

^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: mezcla diastereoisómera (9/1); diastereoisómero mayor: 8,72 (1H, d); 8,18 (1H, d x m); 7,95 (1H, d); 7,35 (1H, d x d); 6,98 (1H, m); 6,88 (1H, m br); 4,65 (1H, m); 3,6 (2H, m); 3,25 (3H, s); 2,05 (2H, m); 1,70 (3H, s); 1,05 (3H, t).

2-(3-Bromo-quinolin-6-iloxi)-N-ter-butil-3-metil-butiramida, usando ácido 2-(3-bromo-quinolin-6-iloxi)-3-metil-butírico y N-*ter*-butilamina. p. f.: (°C): 123-125; ^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8,78 (1H, d); 8,18 (1H, d); 8,01 (1H, d); 7,41 (1H, d x d); 7,02 (1H, d); 5,59 (1H, br s); 4,32 (1H, d); 2,3 (1H, m); 1,30 (9H, s); 1,09 (6H, m).

2-(3-Bromo-quinolin-6-iloxi)-N-(1-ciano-2-metoxi-1-metil-etil)-3-metil-butiramida, usando ácido 2-(3-bromo-quinolin-6-iloxi)-3-metil-butírico y 2-ciano-1-metoxi-prop-2-ilamina. P. f. (°C): 151-157; ^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: mezcla diastereoisómera (1/1); 8,80 (1H, d); 8,20 (1H, d); 8,02 (1H, d); 7,41 (1H, d x d);

7,02 (1H, m); 6,67 (1H, br m); 4,48 (1H, m); 3,68-3,45 (2H, m + s); 3,41 y 3,21 (3H, 2 x s); 2,36 (1H, m); 1,70 y 1,61 (3H, 2 x s); 1,10 (6H, m).

2-(3-Bromo-quinolin-6-iloxi)-N-*ter*-butil-2-ciclopropil-acetamida, usando ácido (3-bromo-quinolin-6-iloxi)-ciclopropil acético y N-*ter*-butilamina. P. f. (°C): 165-167; ^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8,78 (1H, d); 8,18 (1H, d); 8,00 (1H, d); 7,39 (1H, d x d); 6,98 (1H, d); 5,99 (1H, br s); 4,15 (1H, d); 1,3 (1H, m); 1,29 (9H, s); 0,75-0,50 (4H, 2 x m).

2-(3-Bromo-quinolin-6-iloxi)-2-ciclopropil-N-(2-metoxi-1,1-dimetil-etil)-acetamida, usando ácido (3-bromo-quinolin-6-iloxi)-ciclopropil acético y 2-metoxi-1,1-dimetil-etilamina. P. f. (°C): 139-141; ^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8,77 (1H, d); 8,18 (1H, d); 7,99 (1H, d); 7,40 (1H, d x d); 6,98 (1H, d); 6,33 (1H, br s); 4,15 (1H, d); 3,33-3,18 (2H, m); 3,22 (3H, s); 1,35 (1H, m); 1,31 (3H, s); 1,24 (3H, s); 0,75-0,47 (4H, 2 x m).

2-(3-Bromo-quinolin-6-iloxi)-N-(1-ciano-2-metoxi-1-metil-etil)-2-ciclopropil-acetamida, usando ácido (3-bromo-quinolin-6-iloxi)-ciclopropil acético y 2-ciano-1-metoxi-prop-2-ilamina. P. f. (°C): 119-121; ^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: mezcla diastereoisómera (1/1); 8,79 (1H, d); 8,20 (1H, m); 8,01 (1H, d); 7,40 (1H, d x d); 6,98 (1H, m); 6,74 y 6,68 (1H, 2 x br s); 4,29 (1H, m); 3,70-3,48 (2H, m + s); 3,42 y 3,23 (3H, 2 x s); 1,72 y 1,62 (3H, 2 x s); 1,38 (1H, m); 0,80-0,50 (4H, 2 x m).

Ejemplo 2.

Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-(3-bromo-quinolin-6-iloxi)-N-ter-butil-2-metoxi-acetamida (Compuesto Nro.12 de la Tabla 155) de acuerdo con el Esquema 6, donde m = 1.

Etapa 1: Preparación de éster metílico de ácido (3-bromo-quinolin-6-iloxi) acético.

Se disolvió 3-bromo-quinolin-6-ol (10,0 g) en DMF seca (100 ml). Se agregaron éster metílico de ácido bromo-acético (7,51 g) y carbonato de potasio

seco (18,5 g) a la mezcla, a temperatura ambiente. La suspensión resultante se agitó a 80°C durante 2 horas. La mezcla de reacción se vertió en salmuera, y la mezcla resultante se extrajo dos veces con acetato de etilo (2 x 100 ml). Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se evaporaron. La mezcla bruta se recristalizó en isopropanol, de manera de obtener éster metílico de ácido (3-bromo-quinolin-6-iloxi) acético (11,5 g) en forma de un sólido de color amarillo pálido.

^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8,78 (1H, d); 8,20 (1H, d), 8,0 (1H, d); 7,44 (1H, d x d); 6,92 (1H, d); 4,76 (2H, s); 3,85 (3H,s).

Etapa 2: Preparación de éster metílico de ácido bromo-(3-bromo-quinolin-6-iloxi) acético.

Una suspensión de éster metílico de ácido (3-bromo-quinolin-6-iloxi) acético (2,0 g), N-bromosuccinimida (1,80 g) y azo-isobutironitrilo (0,222 g) en tetracloruro de carbono (100 ml) se calentó hasta reflujo durante 3 h. La mezcla de reacción se enfrió hasta temperatura ambiente, se filtró y se concentró al vacío a fin de obtener éster metílico de ácido bromo-(3-bromo-quinolin-6-iloxi) acético (2,8 g) en forma de un sólido de color amarillo. La mezcla bruta se usó en la siguiente etapa, sin otra purificación.

^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8,87 (1H, d); 8,35 (1H, d); 8,12 (1H, d); 7,55 (1H, d x d); 7,41 (1H, d); 6,62 (1H, s); 3,98 (3H, s).

Etapa 3: Preparación de éster metílico de ácido (3-bromo-quinolin-6-iloxi) metoxi acético.

A una suspensión de éster metílico de ácido bromo-(3-bromo-quinolin-6-iloxi) acético (1,32 g) en metanol anhidro se le agregó carbonato de calcio (1,05 g). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2,5 h; se trató con cloroformo y se agitó adicionalmente a temperatura ambiente durante 10 minutos. La mezcla se separó mediante la filtración, y se evaporó el solvente. El

aceite bruto resultante se fraccionó por medio de la HPLC de fase inversa (eluyente: acetonitrilo/agua) a fin de obtener éster metílico de ácido (3-bromo-quinolin-6-iloxi) metoxi acético (0,5 g) en forma de un aceite de color amarillo.

^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8,80 (1H, d); 8,22 (1H, d); 8,02 (1H, d); 7,51 (1H, d x d); 7,30 (1H, d); 5,63 (1H, s); 3,87 (3H, s); 3,58 (3H, s).

Etapa 4: Preparación de ácido (3-bromo-quinolin-6-iloxi) metoxi acético.

Una suspensión de éster metílico de ácido (3-bromo-quinolin-6-iloxi) metoxi acético (0,495 g) e hidróxido de litio, monohidrato (0,070 g), en una mezcla (500 ml) de tetrahidrofurano/agua (1/1) se agitó a 0°C durante 2,5 h. La mezcla de reacción se dejó entibiar hasta temperatura ambiente; se agregó acetato de etilo, y se separaron las dos fases. La fase acuosa se acidificó con ácido clorhídrico acuoso diluido y luego se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas se combinaron, se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se evaporaron, a fin de obtener ácido (3-bromo-quinolin-6-iloxi) metoxi acético (0,39 g) en forma de un sólido de color blanco, que se usó en la siguiente etapa sin otra purificación.

^{1}H RMN (DMSO d_6) δ ppm: 8,82 (1H, d); 8,63 (1H, d); 7,99 (1H, d); 7,57 (1H, d x d); 7,50 (1H, d); 5,78 (1H, s); 3,46 (3H, s).

Etapa 5: Preparación de 2-(3-bromo-quinolin-6-iloxi)-N-ter-butil-2-metoxi acetamida.

Se agitaron ácido 2-(3-bromo-quinolin-6-iloxi)-butírico (0,052 g), N-*ter*-butil amina (0,024 g), (benzotriazol-1-iloxi)-tris-(dimetilamino)-fosfonio-hexafluorfosfato (BOP) (0,099 g), *N*-etildiisopropilamina (0,043 g) y N,N-dimetilaminopiridina (0,005 g) en N,N-dimetilformamida seca (4 ml), a temperatura ambiente durante un período de 8 horas. La mezcla de reacción se vertió sobre una solución de salmuera/acetato de etilo. La capa acuosa se separó y se lavó tres veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas se combinaron, se secaron sobre sulfato de

sodio, se filtraron y se evaporaron a presión reducida. La mezcla bruta resultante se purificó mediante la cromatografía en gel de sílice (eluyente: heptano/acetato de etilo: 1/1) de manera de obtener 2-(3-bromo-quinolin-6-iloxi)-N-*ter*-butil-2-metoxi acetamida (Compuesto Nro.12 de la Tabla 155) en forma de un aceite de color amarillo (0,046 g).

^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8,80 (1H, d); 8,22 (1H, d); 8,03 (1H, d); 7,52 (1H, d x d); 7,38 (1H, d); 6,45 (1H, br s); 5,36 (1H, s); 3,52 (3H, s); 1,38 (9H, s).

Las siguientes amidas se prepararon usando un procedimiento similar.

Compuesto Nro. 12 de la Tabla 99: N-ter-Butil-2-(3,8-dibromo-quinolin-6-iloxi)-2-metoxi-acetamida, usando ácido (3,8-dibromo-quinolin-6-iloxi)-metoxi acético y N-*ter*-butilamina. ^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8,89 (1H, d); 8,23 (1H, d); 7,88 (1H, d); 7,49 (1H, d); 6,45 (1H, br s); 5,35 (1H, s); 3,52 (3H, s); 1,39 (9H, s).

Compuesto Nro. 47 de la Tabla 155: 2-(3-Bromo-quinolin-6-iloxi)-2-metoxi-N-(2-metoxi-1,1-dimetil-etil)-acetamida, usando ácido (3-bromo-quinolin-6-iloxi)-metoxi-acético y 2-metoxi-1,1-dimetil-etilamina. ^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8,88 (1H, d); 8,21 (1H, d); 8,02 (1H, d); 7,51 (1H, d x d); 7,38 (1H, d); 6,8 (1H, br s); 5,38 (1H, s); 3,51 (3H, s); 3,37 (2H, m); 3,35 (3H, s); 1,39 (3H, s); 1,37 (3H, s).

Compuesto Nro. 52 de la Tabla 155: 2-(3-Bromo-quinolin-6-iloxi)-N-(1-ciano-2-metoxi-1-metil-etil)-2-metoxi-acetamida, usando ácido (3-bromo-quinolin-6-iloxi)-metoxi-acético y 2-ciano-1-metoxi-prop-2-ilamina. ^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: mezcla diastereoisómera (1/1); a) 8,81 (1H, d); 8,24 (1H, d); 8,02 (1H, d); 7,51 (1H, d x m); 7,41 (1H, d); 7,11 (1H, br s); 5,48 (1H, s); 3,75-3,6 (2H, m); 3,55 (3H, s); 3,51 (3H, s); 1,77 (3H, s); b) 8,81 (1H, d); 8,24 (1H, d); 8,02 (1H, d); 7,51 (1H, d x m); 7,38 (1H, d); 7,03 (1H, br s); 5,48 (1H, s); 3,75-3,6 (2H, m); 3,55 (3H, s); 3,44 (3H, s); 1,72 (3H, s).

Compuesto Nro. 12 de la Tabla 156: 2-(3-Bromo-quinolin-6-iloxi)-N-*ter*-butil-2-etoxi-acetamida, usando ácido (3-bromo-quinolin-6-iloxi)-etoxi-acético y N-*ter*-

butilamina. ^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8,79 (1H, d); 8,22 (1H, d); 8,01 (1H, d); 7,50 (1H, d x d); 7,38 (1H, d); 6,48 (1H, br s); 5,42 (1H, s); 3,85 (1H, m); 3,68 (1H, m); 1,39 (9H, s); 1,28 (3H, t).

Compuesto Nro. 47 de la Tabla 156: 2-(3-Bromo-quinolin-6-iloxi)-2-etoxi-N-(2-metoxi-1,1-dimetil-etil)-acetamida, usando ácido (3-bromo-quinolin-6-iloxi)-etoxi-acético y 2-metoxi-1,1-dimetil-etilamina. ^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8,79 (1H, d); 8,22 (1H, d); 8,01 (1H, d); 7,50 (1H, d x d); 7,37 (1H, d); 6,8 (1H, br s); 5,44 (1H, s); 3,85 (1H, m); 3,69 (1H, m); 3,38 (2H, m); 3,35 (3H, s); 1,39 (3H, s); 1,37 (3H, s); 1,28 (3H, t).

Compuesto Nro. 52 de la Tabla 156: 2-(3-Bromo-quinolin-6-iloxi)-N-(1-ciano-2-metoxi-1-metil-etil)-2-etoxi-acetamida, usando ácido (3-bromo-quinolin-6-iloxi)-etoxi-acético y 2-ciano-1-metoxi-prop-2-ilamina. ^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: mezcla diastereoisómera (1/1); a) 8,80 (1H, d); 8,24 (1H, d); 8,02 (1H, d); 7,49 (1H, d x m); 7,40 (1H, d); 7,13 (1H, br s); 5,52 (1H, s); 3,88 (1H, m); 3,72 (1H, m); 3,73-3,6 (2H, m); 3,51 (3H, s); 1,78 (3H, s); 1,29 (3H, t); b) 8,80 (1H, d); 8,24 (1H, d); 8,02 (1H, d); 7,49 (1H, d x m); 7,37 (1H, d); 7,03 (1H, br s); 5,52 (1H, s); 3,88 (1H, m); 3,72 (1H, m); 3,73-3,6 (2H, m); 3,45 (3H, s); 1,73 (3H, s); 1,29 (3H, t).

Ejemplo 3.

Este Ejemplo ilustra la preparación de éster metílico de ácido (3-bromo-quinolin-6-iloxi) metoxiacético de acuerdo con el Esquema 3, para m = 1.

Etapa 1: Preparación de éster metílico de ácido bromo-metoxi-acético.

Una suspensión de éster metílico de ácido metoxiacético (0,400 g), N-bromosuccinimida (0,752 g) y azo-isobutironitrilo (0,126 g) en tetracloruro de carbono (6 ml) se calentó a reflujo durante 20 horas. La mezcla de reacción se enfrió hasta temperatura ambiente, se separó mediante la filtración, y se concentró al vacío, a fin de obtener éster metílico de ácido bromometoxi-acético

(0,94 g) en forma de un líquido de color amarillo. La mezcla bruta se usó en la siguiente etapa sin otra purificación.

^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 6,01 (1H, s); 3,88 (3H, s); 3,60 (3H, s).

Etapa 2: Preparación de éster metílico de ácido (3-bromo-quinolin-6-iloxi) metoxiacético.

A una solución de *ter*-butóxido de potasio (0,308 g) en alcohol *ter*-butílico (5 ml) a temperatura ambiente, se agregó una solución de 3-bromo-quinolin-6-ol (0,454 g) en alcohol *ter*-butílico (1 ml). La solución resultante se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos. A continuación, se agregó una solución de éster metílico de ácido bromometoxi-acético (0,500 g) en alcohol *ter*-butílico (1 ml), junto con una cantidad catalítica de yoduro de potasio. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas, y luego se vertió en agua (25 ml)/cloroformo (25 ml). La capa acuosa se separó y se lavó tres veces con cloroformo. Las fases orgánicas se combinaron, se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron, y se evaporaron a presión reducida. La mezcla bruta resultante se purificó mediante la HPLC de fase inversa (eluyente: acetonitrilo/agua) a fin de obtener éster metílico de ácido (3-bromo-quinolin-6-iloxi) metoxiacético (0,177 g) en forma de un aceite de color amarillo. [^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8,80 (1H, d); 8,22 (1H, d); 8,02 (1H, d); 7,51 (1H, d x d); 7,30 (1H, d); 5,63 (1H, s); 3,87 (3H, s); 3,58 (3H, s)], que puede proporcionar compuestos de la fórmula general (1), como se muestra en el Esquema 3, de manera similar a la descripta en el Ejemplo 2, Etapas 4 y 5.

Ejemplo 4.

Este Ejemplo ilustra la preparación de clorhidrato de N-(3-fluor-1,1-dimetil-propil)amina, de acuerdo con el Esquema 9.

Etapa 1: Preparación de éster ter-butílico de ácido (3-fluor-1,1-dimetil-propil)-carbámico.

Se disolvió 4,4-dimetil-2,2-dioxo-(1,2,3)oxatiazinano (23,9 g) (preparado de acuerdo con el procedimiento descripto en: *J. Am. Chem. Soc.,*. 2001, *123*, 6935-6936) en CH_3CN seco (500 ml) en una atmósfera de nitrógeno. Se agregaron diisopropilamina de etilo (base de Hünig) (52,1 ml) y dimetilaminopiridina (DMAP) (1,8 g), seguidas de $(tBuOCO)_2O$ (56,9 g). La mezcla se agitó a 50°C durante 3 horas, y luego se vertió en agua y se diluyó con acetato de etilo. Se separó la fase orgánica, se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se evaporó a fin de obtener el producto bruto, que se purificó mediante la cromatografía instantánea (ciclohexano:acetato de etilo, 2:1), a fin de obtener 24,1 g de éster ter-butílico de ácido 4,4-dimetil-2,2-dioxo-(1,2,3)oxatiazinano-3-carboxílico puro en forma de un sólido de color amarillo. ^1H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 4,55 (1H, t); 2,30 (1H, t); 1,65 (6H, s); 1,52 (9H, s).

A una solución de TBAF (6,8 ml de una solución, 1 M, en THF) en CH3CN a temperatura ambiente, en una atmósfera de nitrógeno, se agregó éster ter-butílico de ácido 4,4-dimetil-2,2-dioxo-(1,2,3)oxatiazinano-3-carboxílico (1,5 g). La mezcla se agitó durante la noche, y luego se diluyó con éter (20 ml) y se apagó con HCl, 1 M (7 ml). Luego de la separación, la fase orgánica se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de sodio anhidro, se filtró y se concentró. El producto bruto se purificó por medio de la cromatografía instantánea (ciclohexano:acetato de etilo, 4:1) de manera de obtener 1,08 g de éster ter-butílico de ácido (3-fluor-1,1-dimetil-propil)-carbámico puro en forma de un aceite de color amarillo claro. ^1H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 4,65 (1H, t); 4,55 (1H, br s); 4,50 (1H, t); 2,15-2,05 (2H, m); 1,45 (9H, s); 1,30 (6H, s).

Etapa 2: Preparación de clorhidrato de N-(3-fluor-1,1-dimetil-propil)amina.

Una solución, 2 M, de HCl en éter etílico (25 ml) se agregó a éster ter-butílico de ácido (3-fluor-1,1-dimetil-propil)-carbámico (1,08 g) a temperatura ambiente, en una atmósfera de nitrógeno. La mezcla se agitó durante la noche; luego, se agregó nuevamente una solución, 2 M, de HCl en éter etílico (12 ml). Después de agitar durante 2 días, la mezcla se concentró, a fin de obtener un clorhidrato de N-(3-fluor-1,1-dimetil-propil)amina (0,77 g), en forma de un sólido puro como para ser utilizado en las siguientes etapas. ^{1}H RMN (DMSO-d_6) δ ppm: 4,62 (1H, t); 4,50 (1H, t); 3,70-3,45 (br s); 2,00-1,85 (2H, m); 1,20 (6H, s).

Ejemplo 5.

Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-(3-yodo-quinolin-6-iloxi)-N-(3-fluor-1,1-dimetil-propil) butiramida (Compuesto Nro. 275 de la Tabla 158) de acuerdo con el Esquema 3, donde m = 0.

Etapa 1: Preparación de éster etílico de ácido 2-(3-yodo-quinolin-6-iloxi)-butírico.

Paso 1: Preparación de 3-yodo-6-hidroxiquinolina.

A una mezcla agitada de 3-bromo-6-hidroxiquinolina (preparación descripta en la referencia: *Liebigs Ann. Chem.,* 1966, 98-106) (3,0 g), yoduro de sodio (4,0 g) y yoduro de cobre (0,25 g) en dioxano (19,5 ml) se agregó N,N,N',N'-tetrametil-etano-1,2-diamina (0,24 g) en un tubo sellado. La mezcla se agitó a 120°C durante 14 h, y al enfriarse, se trató con amoníaco acuoso, seguido de ácido clorhídrico acuoso. La extracción con acetato de etilo, el secado de la fase orgánica sobre sulfato de magnesio, la filtración y la evaporación a presión reducida lograron el producto deseado (M^+ 272) en forma de un polvo de color marrón claro, que se usó como tal en la siguiente etapa.

Paso 2: Se disolvió 3-yodo-quinolin-6-ol (1,0 g) de la Etapa 1, Paso 1, en DMF seca (20 ml). Se agregaron éster etílico de ácido 2-bromo-butírico (940 mg)

y carbonato de potasio seco (1,5 g) a la mezcla, a temperatura ambiente. La suspensión resultante se agitó a 50°C durante 3 horas. La mezcla de reacción se vertió en salmuera y se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y se evaporaron, de manera de obtener 0,86 g de éster etílico de ácido 2-(3-yodo-quinolin-6-iloxi)-butírico, luego de la cromatografía instantánea (ciclohexano:acetato de etilo, 6:1). ^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8,86 (1H, d); 8,36 (1H, d); 7,95 (1H, d); 7,41 (1H, dd); 6,85 (1H, d); 4,65 (1H, t); 4,22 (2H, q); 2,05 (2H, m); 1,25 (3H, t); 1,10 (3H, t).

Etapa 2: Preparación de ácido 2-(3-yodo-quinolin-6-iloxi)-butírico.

A una solución de éster etílico de ácido 2-(3-yodo-quinolin-6-iloxi)-butírico (860 mg) en tetrahidrofurano (9 ml) a temperatura ambiente, se agregó una solución acuosa, 0,5 M, de NaOH (5,4 ml). La mezcla de reacción se agitó durante 4 horas a temperatura ambiente. Se agregó acetato de etilo, y las dos fases se separaron. La fase acuosa se acidificó con HCl, 1 M (hasta pH 2-3), luego se extrajo con acetato de etilo dos veces. Las fases orgánicas se combinaron, se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y se evaporaron a fin de obtener 0,77 g de ácido 2-(3-yodo-quinolin-6-iloxi)-butírico bruto, que se usó en la siguiente etapa sin otra purificación. ^{1}H RMN (DMSO-d_6) δ ppm: 8,85 (1H, d); 8,20 (1H, d); 7,90 (1H, d); 7,45 (1H, dd); 7,20 (1H, d); 4,85 (1H, t); 2,00 (2H, m); 1,05 (3H, t).

Etapa 3: Preparación de 2-(3-yodo-quinolin-6-iloxi)-N-(3-fluor-1,1-dimetil-propil) butiramida.

Se agitaron ácido 2-(3-yodo-quinolin-6-iloxi)-butírico (100 mg), clorhidrato de N-(3-fluor-1,1-dimetil-propil) amina (44 mg), de la Etapa 2, Ejemplo 4, 1-hidroxi-7-azabenzotriazol (HOAT) (42 mg), O-(benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio tetrafluorborato (TBTU) (100 mg) y trietilamina (0,2 ml) en CH_3CN (7 ml) a

temperatura ambiente, durante la noche. La mezcla de reacción se apagó con una solución saturada de $NaHCO_3$ y se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con salmuera y se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se evaporó. El producto bruto se purificó mediante la cromatografía instantánea (ciclohexano:acetato de etilo, 3:1) de manera de obtener 0,12 g de 2-(3-yodo-quinolin-6-iloxi)-N-(3-fluor-1,1-dimetil-propil)-butiramida en forma de un aceite de color amarillo.

Compuesto 275 de la Tabla 158: ^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8,90 (1H, d); 8,40 (1H, d); 7,96 (1H, d); 7,40 (1H, dd); 6,95 (1H, d); 6,40 (1H, br s); 4,60-4,35 (3H, m); 2,20-1,95 (4H, m); 1,35 (3H, s); 1,32 (3H, s); 1,05 (3H, t).

Ejemplo 6

Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-(3-bromo-8-metil-quinolin-6-iloxi)-N-ter-butil-butiramida (Compuesto Nro. 12 de la Tabla 90) de acuerdo con el Esquema 3, donde m = 0.

Paso 1: Preparación de 3-bromo-6-hidroxi-8-metilquinolina.

Se suspendió 6-amino-3-bromo-8-metilquinolina (12 g) (preparación descripta en: *Journal of the American Chemical Society* (1955), pp. 4175-4176) en una mezcla de agua (5 ml) y ácido fosfórico (60 ml), y se calentó en un tubo de vidrio sellado a 180°C durante 3 días. La mezcla se enfrió hasta temperatura ambiente, se diluyó con agua y luego se llevó a pH 3-4 con hidróxido de sodio acuoso (2 M). El precipitado formado se filtró de la solución, se lavó con agua fría y se succionó hasta sequedad, a fin de obtener 3-bromo-6-hidroxi-8-metilquinolina en forma de un sólido de color gris.

1H RMN (d6-DMSO) δ ppm: 2,56 (3H, s); 3,50 (1H, bs); 6,91 (1H, d); 7,15 (1H, d); 8,38 (1h, d); 8,61 (1H, d).

Los procedimientos del Ejemplo 1, etapas 1-3, se repitieron, usando 3-bromo-6-hidroxi-8-metilquinolina del paso 1 anterior como material inicial, a fin de

proporcionar 2-(3-bromo-8-metil-quinolin-6-iloxi)-N-ter-butil-butiramida (Compuesto Nro.12 de la Tabla 90):

^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8,79 (1H, d); 8,14 (1H, d); 7,27 (1H, d); 6,83 (1H, d); 6,10 (1H, br s); 4,49 (1H, dd); 2,75 (3H, s); 2,06-1,93 (2H, m), 1,30 (9H, s), 1,05 (3H, t).

Las siguientes amidas se prepararon usando un procedimiento similar.

Compuesto Nro. 47 de la Tabla 90: 2-(3-Bromo-8-metil-quinolin-6-iloxi)-N-(2-metoxi-1,1-dimetil-etil)-butiramida, usando ácido 2-(3-bromo-8-metil-quinolin-6-iloxi)-butírico y 1-metoxi-2-metilprop-2-ilamina:

^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8,79 (1H, d); 8,15 (1H, d); 7,27 (1H, d); 6,84 (1H, d); 6,42 (1H, br s); 4,50 (1H, dd); 3,29 (2H, dd), 3,27 (3H, s), 2,76 (3H, s), 2,08-1,94 (2H, m), 1,33 (3H, s), 1,28 (3H, s), 1,06 (3H, t).

Compuesto Nro. 52 de la Tabla 90: 2-(3-Bromo-8-metil-quinolin-6-iloxi)-N-(ciano-metoximetil-metil-metil)-butiramida, usando ácido 2-(3-bromo-8-metil-quinolin-6-iloxi)-butírico y 2-ciano-1-metoxi-prop-2-ilamina:

^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: mezcla diastereoisómera; 8,78 (1H, m); 8,18-8,14 (1H, d); 7,27 (1H, m); 6,88-6,79 (2H, m), 4,70-4,62 (1H, m), 3,69-3,52 (2H, m), {3,43 (s) y 3,28 (s) 3H}, 2,74 (3H, s), 2,13-2,00 (2H, m), {1,72 (s) y 1,64 (s), 3H}, 1,10-1,06 (3H,m).

Ejemplo 7.

Este Ejemplo ilustra la preparación de clorhidrato de 1-metoxi-3-metilbut-3-ilamina de acuerdo con el Esquema 9.

Paso 1: Preparación de clorhidrato de 1-metoxi-3-metilbut-3-ilamina.

A una suspensión agitada de hidruro de sodio (0,30 g, dispersión al 80% en aceite mineral) en N,N-dimetilformamida seca (2 ml) en una atmósfera de nitrógeno a temperatura ambiente, se agregó, por goteo, una solución de 1-hidroxi-3-metilbut-3-ilamina (0,52 g) en N,N-dimetilformamida (5 ml). La mezcla se

agitó durante 3 horas; se le agregó yoduro de metilo (0,74 g) en N,N-dimetilformamida (5 ml) en un período de 5 minutos, luego la mezcla se agitó durante otras 2,25 horas, y se almacenó durante 18 horas a temperatura ambiente. La solución se diluyó con agua, se extrajo con acetato de etilo (tres veces), y los extractos combinados luego fueron extraídos con ácido clorhídrico diluido. El extracto ácido acuoso se evaporó a presión reducida y se codestiló con tolueno, a fin de eliminar el agua residual, de manera de obtener clorhidrato de 1-metoxi-3-metilbut-3-ilamina en forma de una goma de color amarillo.

^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 1,54 (6H, s); 1,96-2,00 (2H, t); 3,48 (3H, s); 3,62-3,66 (2H, t).

En un procedimiento similar, se hizo reaccionar 1-hidroxi-3-metilbut-3-ilamina con yoduro de etilo, a fin de obtener clorhidrato de 1-etoxi-3-metilbut-3-ilamina.

^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 1,20-1,24 (3H, t); 1,54 (6H, s); 1,96-2,00 (2H, t); 3,50 (2H, q); 3,66-3,70 (2H, t).

En un procedimiento similar, se hizo reaccionar 1-hidroxi-2-metilprop-2-ilamina con yoduro de metilo, a fin de obtener clorhidrato de 1-metoxi-2-metilprop-2-ilamina.

^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 1,47 (6H, s); 3,43 (3H, s); 3,44 (2H, s); 8,24 (3H bs).

En un procedimiento similar, se hizo reaccionar 1-hidroxi-2-metilprop-2-ilamina con bromuro de 4-fluorbencilo, a fin de obtener clorhidrato de 1-(4-fluorbenciloxi)-2-metilprop-2-ilamina.

^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 1,41 (6H, s); 3,46 (2H, s); 4,53 (2H, s); 7,00-7,04 (2H, m); 7,32-7,36 (2H, m); 8,30 (3H bs).

Ejemplo 8.

Tabla 161.

Los compuestos caracterizados en la Tabla 161 son de la fórmula general (I) donde Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno, L es O, R^2 es hidrógeno, y Q^1,Q^2, Q^3, m , R^1 y R^3 tienen los valores proporcionados en la tabla.

Comp. Nro.	Q^1	Q^2	Q^3	m	R^1	R^3	Información física/espectral
1	Br	H	H	1	Me	$C(CH_3)_3$	p. f. =104-105 °C
2	Br	H	H	1	Et	$C(CH_3)_3$	^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.79 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.00 (1H, d); 7.50 (1H, dd); 7.48 (1H, d); 6.48 (1H, s br); 5.41 (1H, s); 3.90 a 3.53 (2H, m); 1.38 (9H, s); 1.28 (3H, t).
3	Br	H	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.79 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.00 (1H, d); 7.51 (1H, dd); 7.48 (1H, d); 6.79 (1H, s br); 5.47 (1H, s); 3.50 (3H, s); 3.40 a 3.34 (5H, m); 1.40 (6H, d).
4	Br	H	H	1	Me	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.80 (1H, d); 8.23 (1H. d); 8.02 (1H, d); 7.51 (1H, m); 7.39 (1H, dd); 7.11, 7.03 (1H, s br, 2 isómeros); 5.49, 5.47 (1H, s, isómeros A + B); 3.74 a 3.60 (2H, m, isómeros A + B); 3.56 (3H, s); 3.51, 3.43 (3H, s, isómeros A + B); 1.77, 1.73 (3H, s, isómeros A + B).
5	Br	Br	H	1	Me	$C(CH_3)_3$	p. f. =154-157 °C
6	Br	H	H	1	Et	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.79 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.02

							(1H, d); 7.50 (1H, dd); 7.48 (1H, d); 6.81 (1H, s br); 5.43 (1H, s); 3.91 a 3.62 (2H, m); 3.39 (2H, s); 3.37 (3H, s); 1.38 (6H, d); 1.28 (3H, t).
7	Br	H	H	1	Et	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	^1H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.80 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.02 (1H, d); 7.48 (1H, m); 7.38 (1H, dd); 7.13, 7.03 (1H, s br, isómeros A + B); 5.53, 5.51 (1H, s, isómeros A + B); 3.92 a 3.83 (1H, m); 3.75 a 3.61 (3H, m); 3.50, 3.43 (3H, s, isómeros A + B); 1.77, 1.72 (3H, s, isómeros A + B); 1.38 (3H, m).
8	Br	Cl	H	1	Me	$C(CH_3)_3$	p. f. =130-134 °C
9	Br	Br	H	1	Et	$C(CH_3)_3$	p. f. =157-160 °C
10	Br	Br	H	1	Me	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	p. f. =120-122 °C
11	Br	Br	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	p. f. =80-83 °C
12	Br	H	H	1	CH_2(ciclopropilo)	$C(CH_3)_3$	^1H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.80 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.02 (1H, d); 7.50 (1H, dd); 7.38 (1H, d); 6.50 (1H, s br); 5.50 (1H, s); 3.65 a 3.55 (1H, m); 3.50 a 3.46 (1H, m); 1.40 (9H, s); 1.09 (1H, m); 0.53 (2H, d); 0.20 (2H, m).
13	Br	H	H	1	CH_2CHCH_2	$C(CH_3)_3$	^1H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.80 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.02 (1H, d); 7.51 (1H, dd); 7.49 (1H, d); 6.47 (1H, s br); 5.98 a 5.86 (1H, m); 5.46 (1H, s); 5.38 a 5.27 (2H, m); 4.33 (1H, dd); 4.18 (1H, dd); 1.39 (9H, s).

14	Br	H	H	1	CH_2CF_3	$C(CH_3)_3$	p. f. =127-130 °C
15	Br	H	H	1	$CH(CH3)_2$	$C(CH_3)_3$	^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.80 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.00 (1H, d); 7.49 (1H, dd); 7.38 (1H, d); 6.49 (1H, s br); 5.45 (1H, s); 4.03 (1H, quint.); 1.37 (9H, s); 1.27 (3H, d); 1.20 (3H, d).
16	Br	H	H	1	$(CH_2)_2OCH3$	$C(CH_3)_3$	p. f. =58-62 °C
17	Br	H	H	1	$CH(CH2F)_2$	$C(CH_3)_3$	p. f. =124-128 °C
18	Br	H	H	1	CH_2CCH	$C(CH_3)_3$	^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.80 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.01 (1H, d); 7.51 (1H, dd); 7.43 (1H, d); 6.43 (1H, s br); 5.62 (1H, s); 4.44 (2H, m); 2.47 (1H, s); 1.49 (9H, s).
19	Br	H	H	1	$(CH_2)_2SCH3$	$C(CH_3)_3$	^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.80 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.01 (1H, d); 7.51 (1H, dd); 7.39 (1H, d); 6.58 (1H, s br); 5.47 (1H, s); 4.00 a 3.93 (1H, m); 3.81 a 3.64 (1H, m); 2.73 (2H, m); 2.11 (3H, s); 1.39 (9H, s).
20	Br	H	H	1	CH_2CCCH3	$C(CH_3)_3$	^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.80 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.01 (1H, d); 7.52 (1H, dd); 7.42 (1H, d); 6.48 (1H, s br); 5.62 (1H, s); 4.47 a 4.34 (2H, m); 1.79 (3H, m); 1.39 (9H, s).
21	Br	H	H	1	CH_2CHF_2	$C(CH_3)_3$	p. f. =102-1106 °C
22	Br	Me	H	1	Me	$C(CH_3)_3$	p. f. =110-113 °C
23	Br	Me	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	p. f. =55-60 °C
24	Br	Me	H	1	Me	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	p. f. =95-99 °C
25	I	H	H	1	Me	$C(CH_3)_3$	p. f. =125-128 °C
26	I	Me	H	1	Me	$C(CH_3)_3$	p. f. =132-136 °C

27	Br	H	F	1	Me	$C(CH_3)_3$	p. f. =120-123 °C
28	Br	H	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH_2OH$	^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.82 (1H, d); 8.22 (1H, d); 8.02 (1H, d); 7.50 (1H, dd); 7.38 (1H, d); 6.70(1H, s br); 5.42 (1H, s); 3.89 (1H, t); 3.70 a 3.59 (2H, m); 3.52 (3H, s); 1.33 (6H, d).
29	Br	Me	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH_2OH$	^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.82 (1H, d); 8.20 (1H, d); 7.35 (1H, m); 7.20 (1H, d); 6.70(1H, s br); 5.41 (1H, s); 3.92 (1H, t); 3.70 a 3.60 (2H, m); 3.52 (3H, s); 2.78 (3H, s); 1.33 (6H, d).
30	I	H	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH_2OH$	^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.82 (1H, d); 8.47 (1H, d); 8.01 (1H, d); 7.51 (1H, dd); 7.35 (1H, d); 6.70 (1H, s br); 5.41 (1H, s); 3.90 (1H, s); 3.62 (2H, s); 3.51 (3H, s); 1.33 (6H, d).
31	I	Me	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH_2OH$	p. f. =105-107 °C
32	Br	H	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH(O)$	^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 9.39 (1H, s); 8.81 (1H, d); 8.23 (1H, d); 8.02 (1H, d); 7.52 (1H, dd); 7.39 (1H, d); 7.22 (1H, s br); 5.47 (1H, s); 3.54 (3H, s); 1.46 (6H, d).
33	Br	Me	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH(O)$	p. f. =148-150 °C
34	I	H	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH(O)$	^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 9.39 (1H, s); 8.93 (1H, d); 8.46 (1H, d); 8.01 (1H, d); 7.52 (1H, dd); 7.33 (1H, d); 7.22 (1H, s br); 5.47 (1H, s); 3.54 (3H, s); 1.46 (6H, d).
35	I	Me	H	1	Me	$C(CH_3)_2CH(O)$	p. f. =174-175 °C
36	H	H	H	0	Et	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	p. f. =134-136 °C
37	H	H	H	0	Et	$C(CH_3)CH(C(O)CH3)OH$	p. f. =130-132 °C

38	Br	H	H	0	CH(Me)$_2$	$C(CH_3)_3$	p. f. =123-125 °C
39	Br	H	H	0	CH(Me)$_2$	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	p. f. =151-157 °C
40	Br	H	H	0	ciclo-propilo	$C(CH_3)_3$	p. f. =165-167 °C
41	Br	H	H	0	ciclo-propilo	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	p. f. =119-121 °C
42	Br	H	H	0	ciclo-propilo	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	p. f. =139-141 °C
43	Br	H	H	0	Et	$C(CH_3)_3$	^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.69 (1H, sm); 8.10 (1H, sm); 7.92 (1H, d); 7.32 (1H, dm); 6.92 (sm); 6.0 (1H, br s); 4.43 (1H, m); 1.95 (2H, m); 1.22 (9H, s); 0.96 (3H, t).
44	Br	H	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.75 (1H, sm); 8.16 (1H, sm); 7.98 (1H, d); 7.38 (1H, dm); 7.00 (sm); 6.4 (1H, br s); 4.51 (1H, m); 3.33-3.20 (2H, m); 3.23 (3H, s); 2.0 (2H, m); 1.30 (3H, s); 1.23 (3H, s); 1.05 (3H, t).
45	Br	H	H	0	Et	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.72 (isómero A, 1H, sm); 8.68 (isómero B, 1H, sm); 8.18 (isómero A, 1H, sm); 8.10 (isómero B, 1H, sm); 7.98 (isómero A, 1H, d); 7.92 (isómero B, 1H, d); 7.42 (isómero B, 1H, dm); 7.38 (isómero A, 1H, dm); 7.0 (isómero A, 1H, sm); 6.95 (isómero B, 1H, sm); 6.90+6.85 (isómero A + B, 1H, 2 br s); 4.7-4.6 (isómero A + B, 1H, m); 3.75-3.50

							(isómero A + B, 2H, m); 3.40 y 3.25 (isómeros A + B, 3H, 2s); 2.15-1.95 (isómeros A + B, 2H, m); 1.70 (isómero A, 3H, s); 1.60 (isómero B, 3H, s); 1.15 (isómero B, 3H, t); 1.04 (isómero A, 3H, t).
46	Br	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_3$	p. f. =138-140°C
47	Br	Me	H	0	Et	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	p. f. =89-90°C
48	I	H	H	0	Et	$C(CH_3)_3$	p. f. =125-126 °C
49	I	H	H	0	Et	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	p. f. =100-101 °C
50	I	H	H	0	Et	$C(CH_3)(CH_2)_2F$	^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.90 (1H,d); 8.40 (1H,d); 7.96 (1H,d); 7.40 (1H,dd); 6.95 (1H,d); 6.40 (1H,br s); 4.60-4.35 (3H,m); 2.20-1.95 (4H,m); 1.35 (3H,s); 1.32 (3H,s); 1.05 (3H,t).
51	Br	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	p. f. =117-120°C
52	Br	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH_2OH$	p. f. =99-100°C
53	Br	Cl	H	0	Et	$C(CH_3)_3$	p. f. =126-127°C
54	Br	Cl	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	p. f. =139-140°C
55	Br	Cl	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH_2OH$	p. f. =125-127°C
56	Br	Cl	H	0	Et	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	p. f. =105-106°C
57	Br	Me	H	0	Me	$C(CH_3)_3$	p. f. =155-157°C
58	Br	Me	H	0	Me	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	p. f. =104-106°C
59	Br	Me	H	0	Me	$C(CH_3)_2CH_2OH$	p. f. =98-99°C
60	Br	Me	H	0	Me	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	p. f. =136-138°C
61	Br	Cl	H	0	Me	$C(CH_3)_3$	p. f. =148-150°C
62	Br	Cl	H	0	Me	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	p. f. =122-123°C
63	Br	Cl	H	0	Me	$C(CH_3)_2CH_2OH$	p. f. =102-104°C
64	Br	Cl	H	0	Me	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	p. f. =144-146°C
65	Br	H	H	0	$(CH_2)_2F$	$C(CH_3)_3$	p. f. =126-128 °C
66	Br	H	H	0	$(CH_2)_2OMe$	$C(CH_3)_3$	p. f. =109-111 °C
67	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)(CN)CH_2OCH_3$	^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.94 (1H, d, isómero A + B); 8.40 (1H, dd, isómero A + B); 7.27 (1H, m, isómero A + B); 6.85-6.75 (2H, m, isómero A + B);

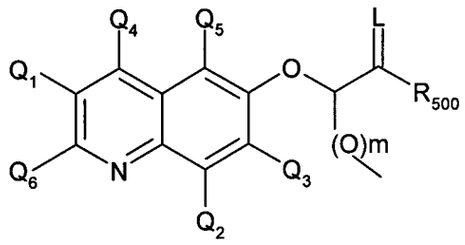
							4.67 (1H, m, isómero A + B); 3.72-3.46 (2H, m, isómero A + B); 3.45 (3H, s, isómero A); 3.29 (3H, s, isómero B); 2.74 (3H, s, isómero A + B); 2.10-2.00 (1H, m, 2H); 1.72 (3H, s, isómero A); 1.63 (3H, s, isómero B); 1.12-0.60 (3H, m, isómero A + B)
68	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2(CH_2)_2SCH_3$	^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.95 (1H, d); 8.42 (1H, d); 7.30 (1H, d); 6.82 (1H, d); 6.13 (1H, s); 4.50 (1H, dd); 2.78 (3H, s); 2.31-2.22 (2H, m); 2.08-1.95 (4H, m); 1.98 (3H, s); 1.31 (3H, s); 1.29 (3H, s); 1.08 (3H, t)
69	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2(CH_2)_2S(O)CH_3$	p. f. =101-102 °C
70	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2(CH_2)_2S(O)_2CH_3$	p. f. =85-86 °C
71	I	H	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH_2CCH$	^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.91 (1H, d); 8.41 (1H, d), 8.00 (1H, d); 7.42 (1H, dd); 6.99 (1H, d); 6.29 (1H, s); 4.52 (1H, dd); 2.7-2.55 (2H, m); 2.10-1.98 (2H, m); 1.72 (1H, t); 1.38 (3H, s); 1.09 (3H, t)
72	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH_2CCH$	^{1}H RMN ($CDCl_3$) δ ppm: 8.90 (1H, d); 8.37 (1H, d); 7.29 (1H, d); 6.30 (1H, d); 6.28 (1H, s); 4.50 (1H, dd); 2.72 (3H, s); 2.7-2.55 (2H, m); 2.01-1.97 (2H, m); 1.74 (1H, t); 1.37 (3H, s); 1.07 (3H, t)
73	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_3$	p. f. =139-140 °C
74	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	p. f. =136-138 °C
75	I	H	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH_2OH$	p. f. =88-90°C

76	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH(O)$	p. f. =153-154°C
77	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH_2OH$	p. f. =103-105°C
78	I	H	H	0	Et	$C(CH_3)_2CH(O)$	p. f. =148-150°C
79	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2(CH_2)_2S(O)(NH)CH_3$	p. f. =58-59°C
80	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2(CH_2)_2S(O)(NCH_2CCH)CH_3$	p. f. =51-52°C
81	I	Me	H	0	Et	$C(CH_3)_2(CH_2)_2S(O)(NC_6H_4pCl)CH_3$	p. f. =58-59°C

Ejemplo 9.

Tabla 162.

Los compuestos caracterizados en la Tabla 162 son de la fórmula general (100) donde Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno, L es O y Q^1,Q^2, Q^3, m y R^{500} tienen los valores proporcionados en la tabla.



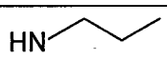
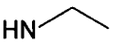
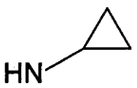
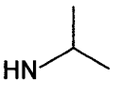
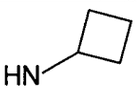
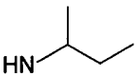
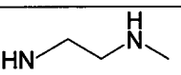
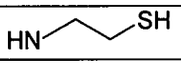
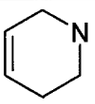
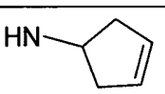
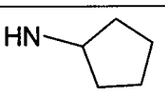
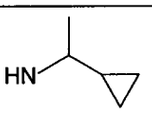
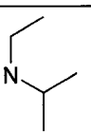
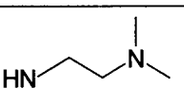
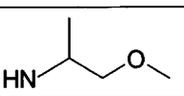
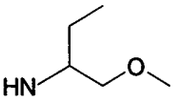
(100)

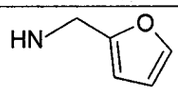
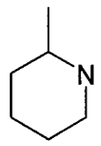
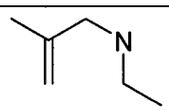
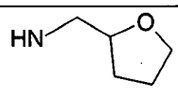
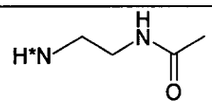
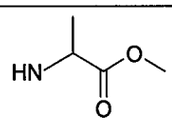
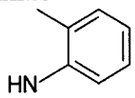
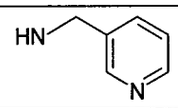
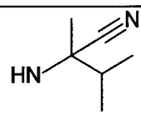
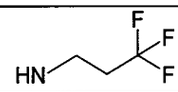
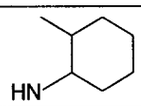
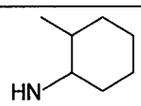
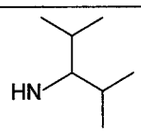
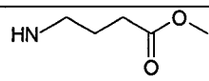
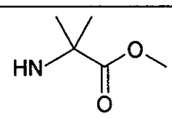
Se usó el siguiente método para el análisis LC-MS:

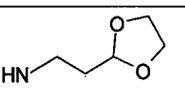
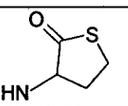
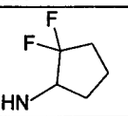
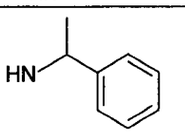
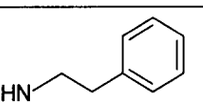
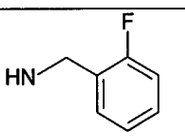
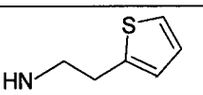
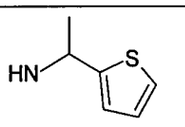
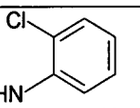
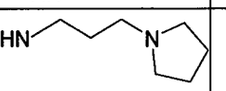
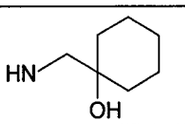
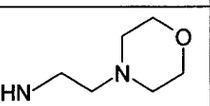
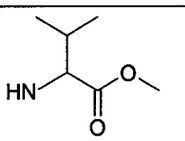
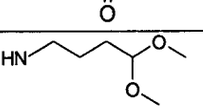
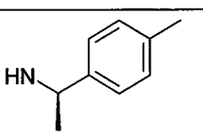
Método A: Método (Water Alliance 2795 LC) con las siguientes condiciones de gradiente de HPLC (Solvente A: 0,1% de ácido fórmico en agua/acetonitrilo (9:1) y solvente B: 0,1% de ácido fórmico en acetonitrilo).

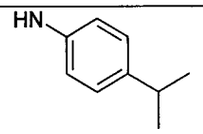
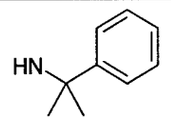
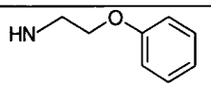
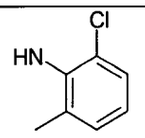
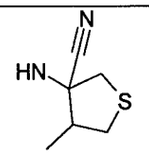
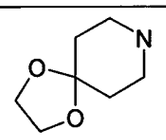
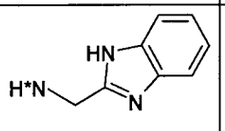
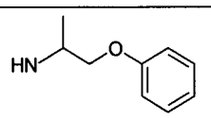
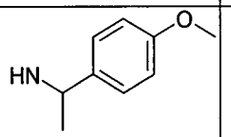
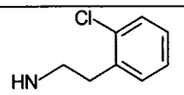
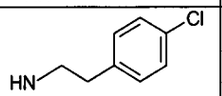
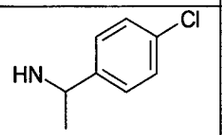
Tiempo (minutos)	A (%)	B (%)	Caudal (ml/min)
0	90	10	1,7
2,5	0	100	1,7
2,8	0	100	1,7
2,9	90	10	1,7

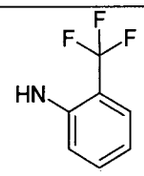
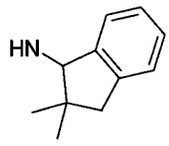
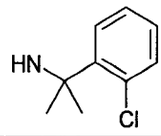
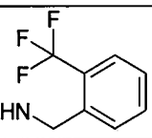
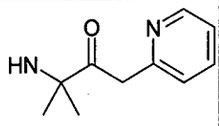
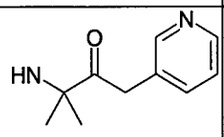
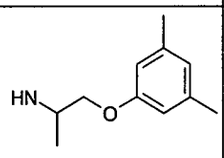
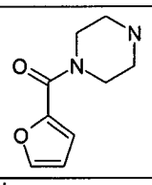
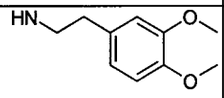
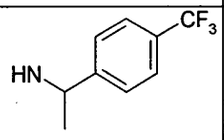
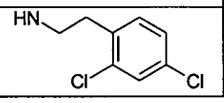
Tipo de columna: Water Atlantis dc18; longitud de columna: 20 mm; diámetro interno de columna: 3 mm; tamaño de partícula: 3 micrones; temperatura: 40°C.

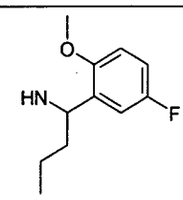
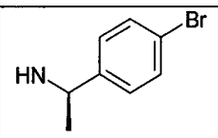
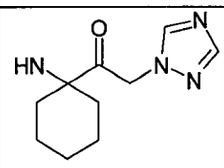
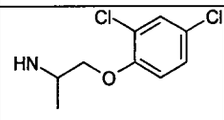
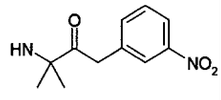
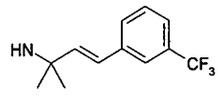
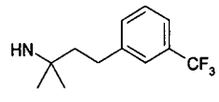
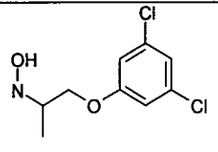
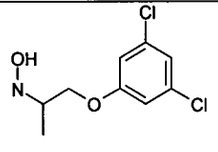
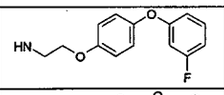
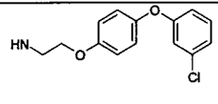
Comp. Nro.	Q1	Q2	Q3	m	R^1	R^{500}	T. R. (min)	M + H
1	I	Me	H	0	Et		1.60	413.1
2	I	Me	H	0	Et		1.30	385.0
3	I	Me	H	0	Et		1.50	399.0
4	I	Me	H	0	Et		1.50	411.0
5	I	Me	H	0	Et		1.60	413.1
6	I	Me	H	0	Et		1.70	425.1
7	I	Me	H	0	Et		1.70	427.1
8	I	Me	H	0	Et		0.80	428.1
9	I	Me	H	0	Et		1.50	431.0
10	I	Me	H	0	Et		1.70	437.1
11	I	Me	H	0	Et		1.70	437.1
12	I	Me	H	0	Et		1.70	439.1
13	I	Me	H	0	Et		1.80	439.1
14	I	Me	H	0	Et		1.80	441.1
15	I	Me	H	0	Et		0.75	442.1
16	I	Me	H	0	Et		1.50	443.1
17	I	Me	H	0	Et		1.30	443.1

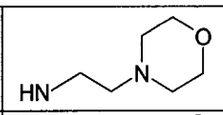
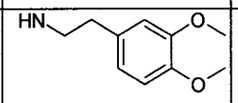
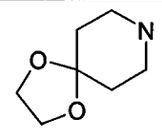
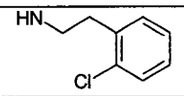
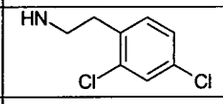
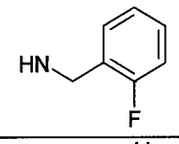
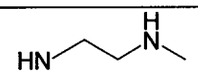
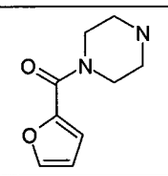
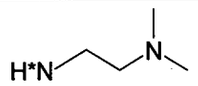
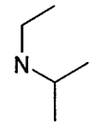
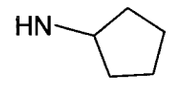
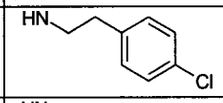
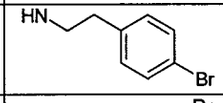
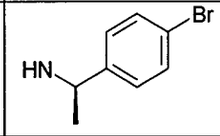
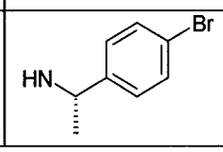
18	I	Me	H	0	Et		1.70	451.0
19	I	Me	H	0	Et		1.80	453.1
20	I	Me	H	0	Et		1.90	453.1
21	I	Me	H	0	Et		1.50	455.1
22	I	Me	H	0	Et		1.10	456.1
23	I	Me	H	0	Et		1.50	457.1
24	I	Me	H	0	Et		1.90	461.1
25	I	Me	H	0	Et		0.91	462.1
26	I	Me	H	0	Et		1.70	466.1
27	I	Me	H	0	Et		1.70	467.0
28	I	Me	H	0	Et		2.00	467.1
29	I	Me	H	0	Et		2.00	467.1
30	I	Me	H	0	Et		2.10	469.1
31	I	Me	H	0	Et		1.46	471.1
32	I	Me	H	0	Et		1.60	471.1

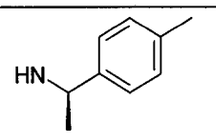
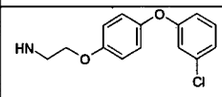
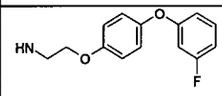
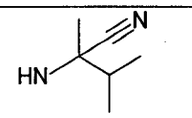
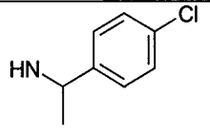
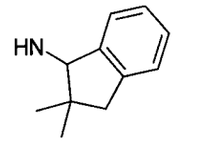
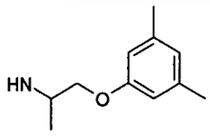
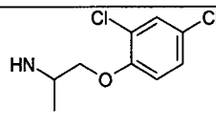
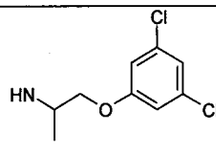
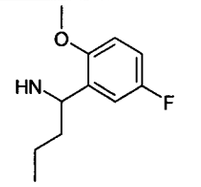
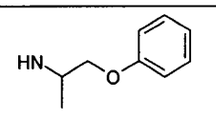
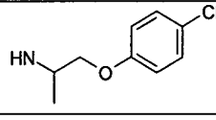
33	I	Me	H	0	Et		1.40	471.1
34	I	Me	H	0	Et		1.50	471.0
35	I	Me	H	0	Et		1.70	475.1
36	I	Me	H	0	Et		1.80	475.1
37	I	Me	H	0	Et		1.80	475.1
38	I	Me	H	0	Et		1.80	479.1
39	I	Me	H	0	Et		1.80	481.0
40	I	Me	H	0	Et		1.80	481.0
41	I	Me	H	0	Et		2.10	481.0
42	I	Me	H	0	Et		0.90	482.1
43	I	Me	H	0	Et		1.60	483.1
44	I	Me	H	0	Et		0.90	484.1
45	I	Me	H	0	Et		1.80	485.1
46	I	Me	H	0	Et		1.50	487.1
47	I	Me	H	0	Et		2.00	489.1

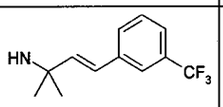
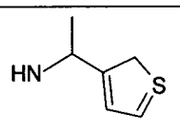
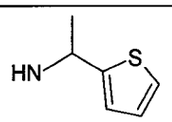
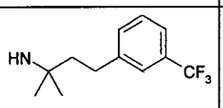
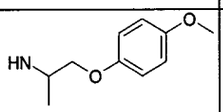
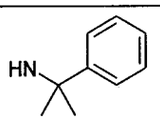
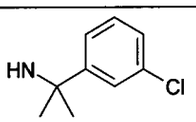
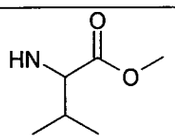
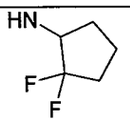
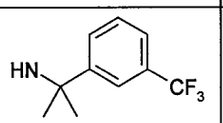
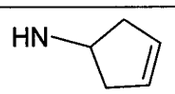
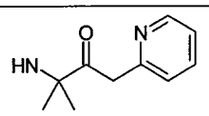
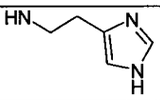
48	I	Me	H	0	Et		2.20	489.1
49	I	Me	H	0	Et		2.00	489.1
50	I	Me	H	0	Et		1.80	491.1
51	I	Me	H	0	Et		1.90	495.0
52	I	Me	H	0	Et		1.70	496.0
53	I	Me	H	0	Et		1.60	497.1
54	I	Me	H	0	Et		1.00	501.1
55	I	Me	H	0	Et		1.90	505.1
56	I	Me	H	0	Et		1.80	505.1
57	I	Me	H	0	Et		2.00	509.0
58	I	Me	H	0	Et		2.00	509.0
59	I	Me	H	0	Et		2.00	509.0

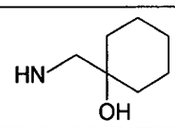
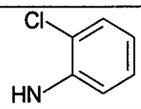
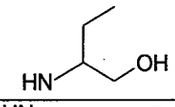
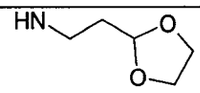
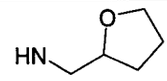
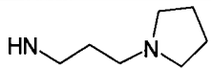
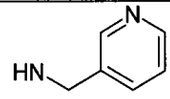
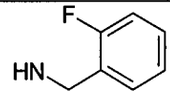
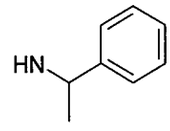
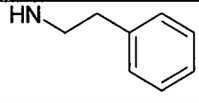
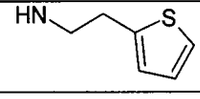
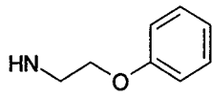
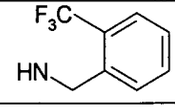
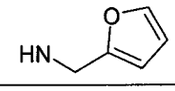
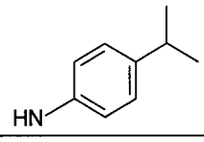
60	I	Me	H	0	Et		2.10	515.0
61	I	Me	H	0	Et		2.20	515.1
62	I	Me	H	0	Et		2.10	523.1
63	I	Me	H	0	Et		2.00	529.1
64	I	Me	H	0	Et		1.10	532.1
65	I	Me	H	0	Et		0.94	532.1
66	I	Me	H	0	Et		2.20	533.1
67	I	Me	H	0	Et		1.50	534.1
68	I	Me	H	0	Et		1.70	535.1
69	I	Me	H	0	Et		2.00	543.1
70	I	Me	H	0	Et		2.10	543.0

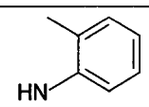
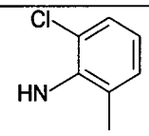
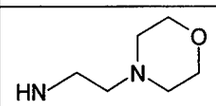
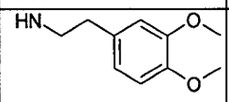
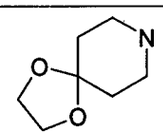
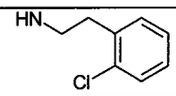
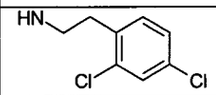
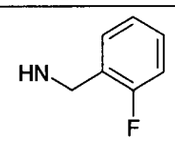
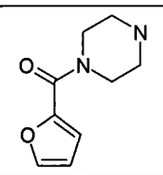
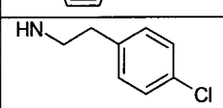
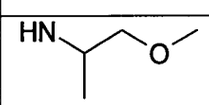
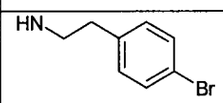
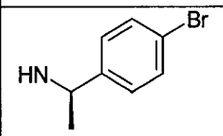
71	I	Me	H	0	Et		2.10	551.1
72	I	Me	H	0	Et		2.00	553.0
73	I	Me	H	0	Et		1.60	562.1
74	I	Me	H	0	Et		2.20	573.0
75	I	Me	H	0	Et		1.90	576.1
76	I	Me	H	0	Et		2.30	583.1
77	I	Me	H	0	Et		2.30	585.1
78	I	Me	H	0	Et		1.90	589.0
79	I	Me	H	0	Et		2.14	589.0
80	I	Me	H	0	Et		2.20	601.1
81	I	Me	H	0	Et		2.30	617.1

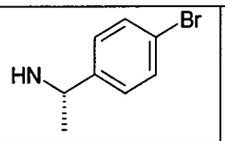
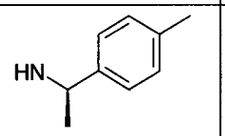
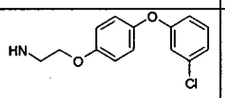
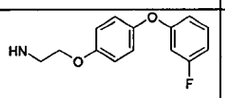
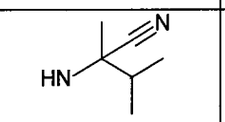
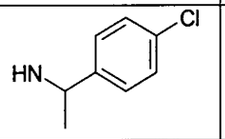
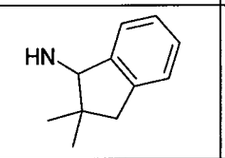
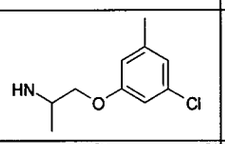
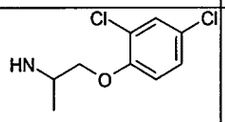
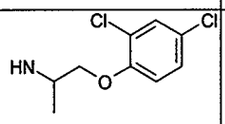
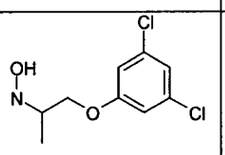
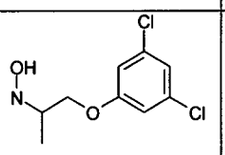
82	Br	H	H	1	Me		0.40	424.1
83	Br	H	H	1	Me		1.39	475.1
84	Br	H	H	1	Me		1.30	437.1
85	Br	H	H	1	Me		1.68	449.0
86	Br	H	H	1	Me		1.84	483.0
87	Br	H	H	1	Me		1.49	419.0
88	Br	H	H	1	Me		0.39	368.1
89	Br	H	H	1	Me		1.22	474.1
90	Br	H	H	1	Me		0.38	382.1
91	Br	H	H	1	Me		1.53	381.1
92	Br	H	H	1	Me		1.44	379.1
93	Br	H	H	1	Me		1.68	449.0
94	Br	H	H	1	Me		1.72	493.0
95	Br	H	H	1	Me		1.73	493.0
96	Br	H	H	1	Me		1.73	493.0

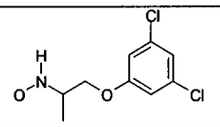
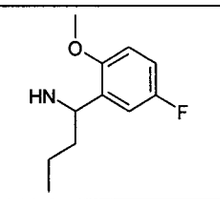
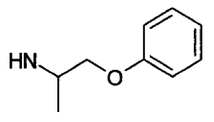
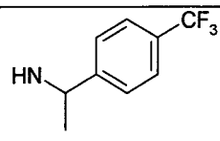
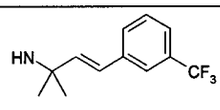
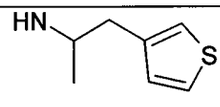
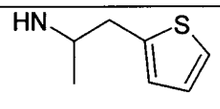
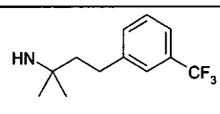
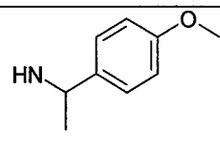
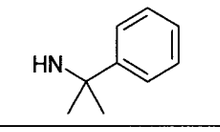
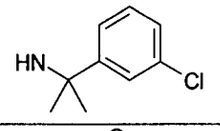
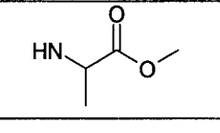
97	Br	H	H	1	Me		1.65	429.1
98	Br	H	H	1	Me		2.03	557.0
99	Br	H	H	1	Me		1.90	541.1
100	Br	H	H	1	Me		1.40	406.1
101	Br	H	H	1	Me		1.70	449.0
102	Br	H	H	1	Me		1.87	455.1
103	Br	H	H	1	Me		1.87	473.1
104	Br	H	H	1	Me		1.91	513.0
105	Br	H	H	1	Me		1.9	529.0
106	Br	H	H	1	Me		1.87	491.1
107	Br	H	H	1	Me		1.63	445.1
108	Br	H	H	1	Me		1.80	483.0

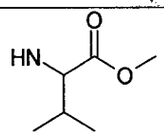
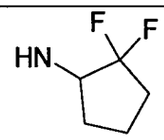
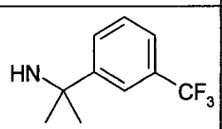
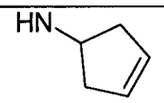
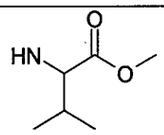
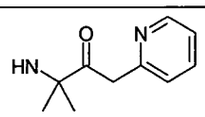
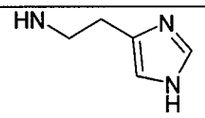
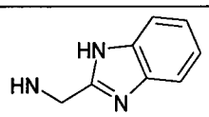
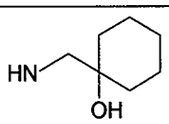
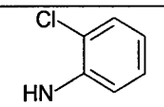
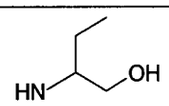
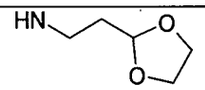
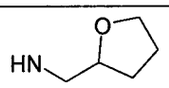
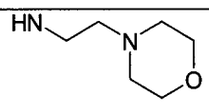
109	Br	H	H	1	Me		2.00	523.1
110	Br	H	H	1	Me		1.51	421.0
111	Br	H	H	1	Me		1.51	421.0
112	Br	H	H	1	Me		2.10	525.1
113	Br	H	H	1	Me		1.54	445.1
114	Br	H	H	1	Me		1.70	429.1
115	Br	H	H	1	Me		1.80	463.0
116	Br	H	H	1	Me		1.49	425.1
117	Br	H	H	1	Me		1.43	415.0
118	Br	H	H	1	Me		1.86	497.1
119	Br	H	H	1	Me		1.40	377.0
120	Br	H	H	1	Me		0.80	472.1
121	Br	H	H	1	Me		0.43	405.0

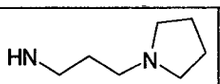
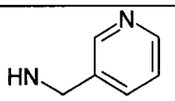
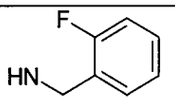
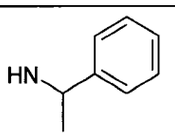
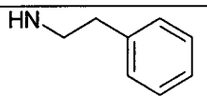
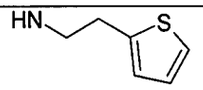
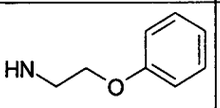
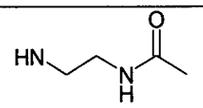
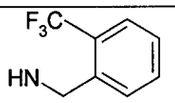
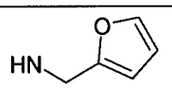
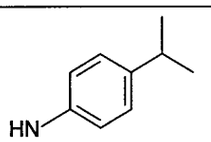
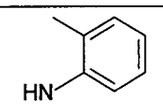
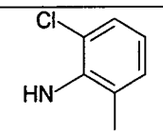
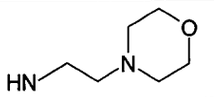
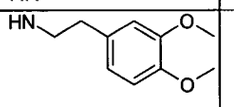
122	Br	H	H	1	Me		1.26	423.1
123	Br	H	H	1	Me		1.79	421.0
124	Br	H	H	1	Me		1.00	383.1
125	Br	H	H	1	Me		1.10	411.0
126	Br	H	H	1	Me		1.13	395.1
127	Br	H	H	1	Me		0.50	422.1
128	Br	H	H	1	Me		0.36	402.0
129	Br	H	H	1	Me		1.49	419.0
130	Br	H	H	1	Me		1.54	415.1
131	Br	H	H	1	Me		1.55	415.1
132	Br	H	H	1	Me		1.50	421.0
133	Br	H	H	1	Me		1.52	431.1
134	Br	H	H	1	Me		1.70	469.0
135	Br	H	H	1	Me		1.32	391.0
136	Br	H	H	1	Me		1.92	429.1

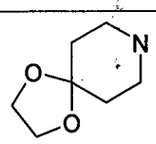
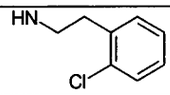
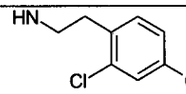
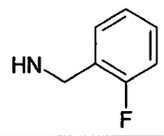
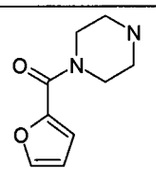
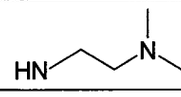
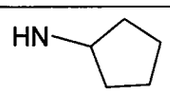
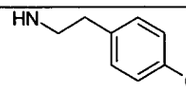
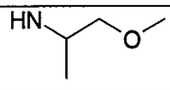
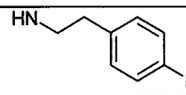
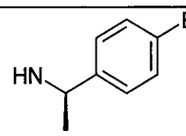
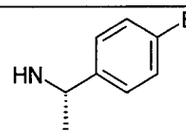
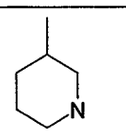
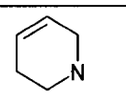
137	Br	H	H	1	Me		1.58	401.0
138	Br	H	H	1	Me		1.60	435.0
139	I	H	H	0	Et		0.68	470.1
140	I	H	H	0	Et		1.50	521.1
141	I	H	H	0	Et		1.40	483.1
142	I	H	H	0	Et		1.80	495.0
143	I	H	H	0	Et		2.00	529.0
144	I	H	H	0	Et		1.60	465.0
145	I	H	H	0	Et		1.30	520.1
146	I	H	H	0	Et		1.80	495.0
147	I	H	H	0	Et		1.30	429.1
148	I	H	H	0	Et		1.83	539.0
149	I	H	H	0	Et		1.80	539.0

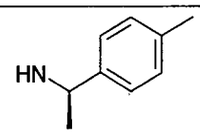
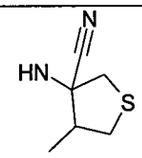
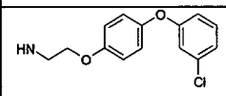
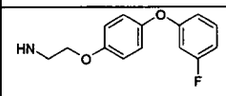
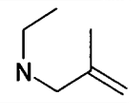
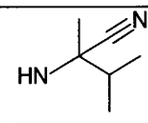
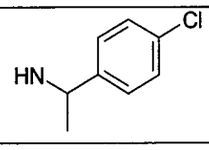
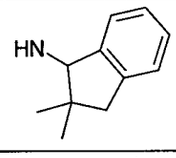
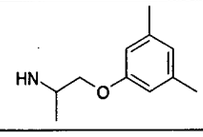
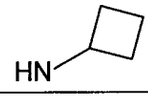
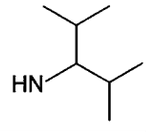
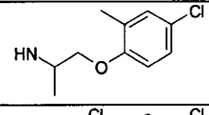
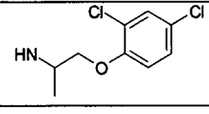
150	I	H	H	0	Et		1.83	539.0
151	I	H	H	0	Et		1.79	475.1
152	I	H	H	0	Et		2.13	603.0
153	I	H	H	0	Et		2.00	587.1
154	I	H	H	0	Et		1.60	452.1
155	I	H	H	0	Et		1.81	495.0
156	I	H	H	0	Et		2.00	501.1
157	I	H	H	0	Et		2.00	539.1
158	I	H	H	0	Et		2.00	559.0
159	I	H	H	0	Et		1.99	559.0
160	I	H	H	0	Et		1.80	575.0
161	I	H	H	0	Et		2.00	575.0

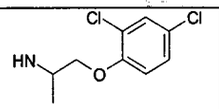
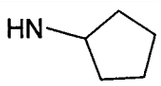
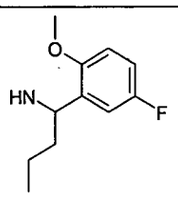
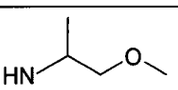
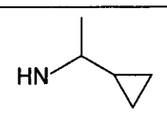
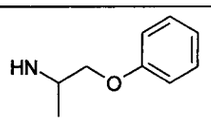
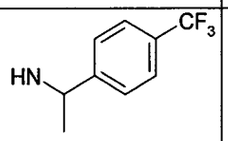
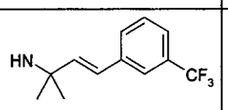
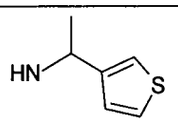
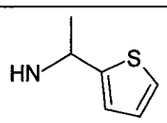
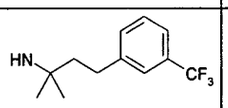
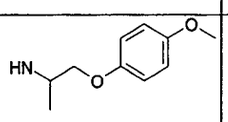
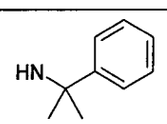
162	I	H	H	0	Et		2.30	575.0
163	I	H	H	0	Et		1.99	537.1
164	I	H	H	0	Et		1.80	491.1
165	I	H	H	0	Et		1.90	529.1
166	I	H	H	0	Et		2.20	569.1
167	I	H	H	0	Et		1.60	467.0
168	I	H	H	0	Et		1.66	467.0
169	I	H	H	0	Et		2.20	571.1
170	I	H	H	0	Et		1.64	491.1
171	I	H	H	0	Et		1.80	475.1
172	I	H	H	0	Et		1.90	509.0
173	I	H	H	0	Et		1.40	443.0

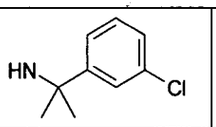
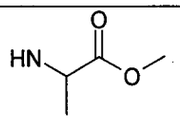
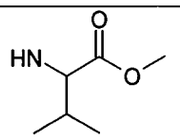
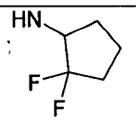
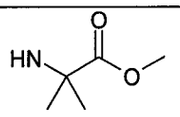
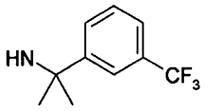
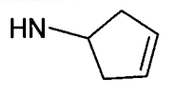
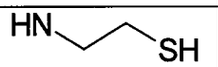
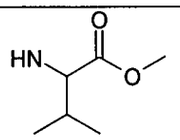
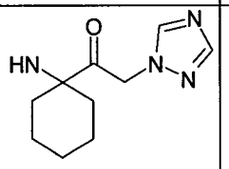
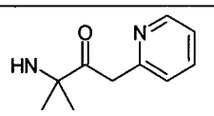
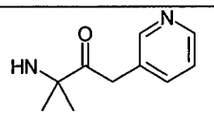
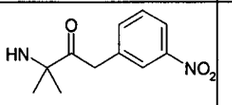
174	I	H	H	0	Et		1.60	471.1
175	I	H	H	0	Et		1.60	461.0
176	I	H	H	0	Et		1.99	543.1
177	I	H	H	0	Et		1.50	423.0
178	I	H	H	0	Et		1.60	471.1
179	I	H	H	0	Et		0.98	518.1
180	I	H	H	0	Et		0.70	451.1
181	I	H	H	0	Et		0.87	487.1
182	I	H	H	0	Et		1.40	469.1
183	I	H	H	0	Et		2.00	467.0
184	I	H	H	0	Et		1.17	429.1
185	I	H	H	0	Et		1.27	457.1
186	I	H	H	0	Et		1.30	441.1
187	I	H	H	0	Et		0.73	470.1

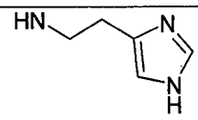
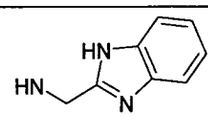
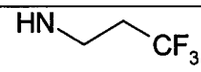
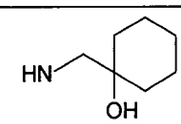
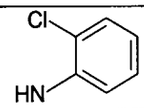
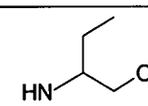
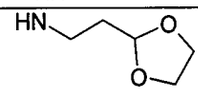
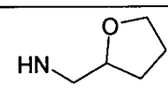
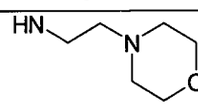
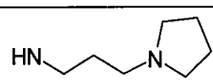
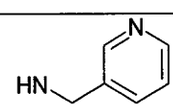
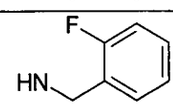
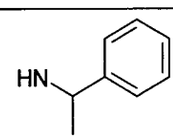
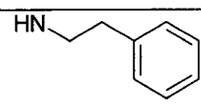
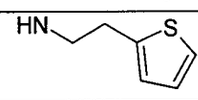
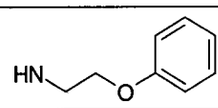
188	I	H	H	0	Et		0.73	468.1
189	I	H	H	0	Et		0.77	448.0
190	I	H	H	0	Et		1.64	465.0
191	I	H	H	0	Et		1.68	461.1
192	I	H	H	0	Et		1.69	461.1
193	I	H	H	0	Et		1.60	467.0
194	I	H	H	0	Et		1.60	477.1
195	I	H	H	0	Et		0.95	442.1
196	I	H	H	0	Et		1.80	515.0
197	I	H	H	0	Et		1.50	437.0
198	I	H	H	0	Et		2.05	475.1
199	I	H	H	0	Et		1.73	447.0
200	I	H	H	0	Et		1.70	481.0
201	Br	H	H	0	Et		0.50	422.1
202	Br	H	H	0	Et		1.60	473.1

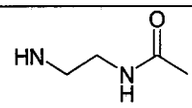
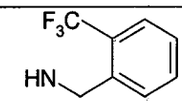
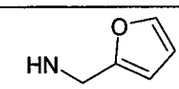
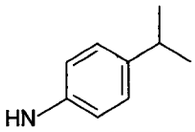
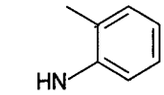
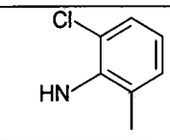
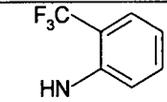
203	Br	H	H	0	Et		1.40	435.1
204	Br	H	H	0	Et		1.80	447.0
205	Br	H	H	0	Et		2.00	481.0
206	Br	H	H	0	Et		1.70	417.1
207	Br	H	H	0	Et		1.40	472.1
208	Br	H	H	0	Et		0.60	380.1
209	Br	H	H	0	Et		1.60	377.1
210	Br	H	H	0	Et		1.80	447.0
211	Br	H	H	0	Et		1.40	381.1
212	Br	H	H	0	Et		1.90	491.0
213	Br	H	H	0	Et		1.90	491.0
214	Br	H	H	0	Et		1.90	491.0
215	Br	H	H	0	Et		1.70	391.1
216	Br	H	H	0	Et		1.50	375.1

217	Br	H	H	0	Et		1.80	427.1
218	Br	H	H	0	Et		1.60	434.0
219	Br	H	H	0	Et		2.20	555.1
220	Br	H	H	0	Et		2.10	539.1
221	Br	H	H	0	Et		1.80	391.1
222	Br	H	H	0	Et		1.60	404.1
223	Br	H	H	0	Et		1.80	447.0
224	Br	H	H	0	Et		2.00	453.1
225	Br	H	H	0	Et		2.00	471.1
226	Br	H	H	0	Et		1.50	363.1
227	Br	H	H	0	Et		1.90	407.1
228	Br	H	H	0	Et		2.00	491.1
229	Br	H	H	0	Et		2.00	511.0

230	Br	H	H	0	Et		2.10	511.0
231	Br	H	H	0	Et		1.60	377.1
232	Br	H	H	0	Et		2.00	489.1
233	Br	H	H	0	Et		1.40	381.1
234	Br	H	H	0	Et		1.60	377.1
235	Br	H	H	0	Et		1.80	443.1
236	Br	H	H	0	Et		1.90	481.1
237	Br	H	H	0	Et		2.20	521.1
238	Br	H	H	0	Et		1.70	419.0
239	Br	H	H	0	Et		1.70	419.0
240	Br	H	H	0	Et		2.20	523.1
241	Br	H	H	0	Et		1.70	443.1
242	Br	H	H	0	Et		1.90	427.1

243	Br	H	H	0	Et		2.00	461.1
244	Br	H	H	0	Et		1.40	395.1
245	Br	H	H	0	Et		1.70	423.1
246	Br	H	H	0	Et		1.60	413.1
247	Br	H	H	0	Et		1.50	409.1
248	Br	H	H	0	Et		2.00	495.1
249	Br	H	H	0	Et		1.60	375.1
250	Br	H	H	0	Et		2.00	369.0
251	Br	H	H	0	Et		1.70	423.1
252	Br	H	H	0	Et		1.50	500.1
253	Br	H	H	0	Et		1.00	470.1
254	Br	H	H	0	Et		0.90	470.1
255	Br	H	H	0	Et		1.80	514.1

256	Br	H	H	0	Et		0.50	403.1
257	Br	H	H	0	Et		0.80	439.1
258	Br	H	H	0	Et		1.60	405.0
259	Br	H	H	0	Et		1.50	421.1
260	Br	H	H	0	Et		2.00	419.0
261	Br	H	H	0	Et		1.20	381.1
262	Br	H	H	0	Et		1.30	409.1
263	Br	H	H	0	Et		1.40	393.1
264	Br	H	H	0	Et		0.60	422.1
265	Br	H	H	0	Et		0.60	420.1
266	Br	H	H	0	Et		0.70	400.1
267	Br	H	H	0	Et		1.70	417.1
268	Br	H	H	0	Et		1.70	413.1
269	Br	H	H	0	Et		1.70	413.1
270	Br	H	H	0	Et		1.70	419.0
271	Br	H	H	0	Et		1.70	429.1

272	Br	H	H	0	Et		1.00	394.1
273	Br	H	H	0	Et		1.90	467.1
274	Br	H	H	0	Et		1.50	389.0
275	Br	H	H	0	Et		2.10	427.1
276	Br	H	H	0	Et		1.80	399.1
277	Br	H	H	0	Et		1.80	433.0
278	Br	H	H	0	Et		2.00	453.0

Ejemplo 10.

Este Ejemplo ilustra las propiedades fungicidas de los compuestos de la fórmula (1).

Los compuestos se evaluaron en un ensayo de disco de hoja, con los métodos que se describen a continuación. Los compuestos de ensayo se disolvieron en DMSO y se diluyeron en agua hasta 200 ppm. En el caso del ensayo en *Pythium ultimum*, se disolvieron en DMSO y se diluyeron en agua a 20 ppm.

Erysiphe graminis f. sp. tritici (mildiú polvoroso del trigo): se colocaron segmentos de hoja de trigo en agar, en una placa de 24 receptáculos, y se rociaron con una solución del compuesto de ensayo. Después de dejar secar por completo, durante entre 12 y 24 horas, los discos de hoja se inocularon con una suspensión de esporas del hongo. Luego de la apropiada incubación, se evaluó la

actividad de un compuesto, cuatro días después de la inoculación, como actividad fungicida preventiva.

Puccinia recondita f. sp. tritici (roya marrón del trigo): se colocaron segmentos de hoja de trigo en agar, en una placa de 24 receptáculos, y se rociaron con una solución del compuesto de ensayo. Después de dejar secar por completo, durante entre 12 y 24 horas, los discos de hoja se inocularon con una suspensión de esporas del hongo. Luego de la apropiada incubación, se evaluó la actividad de un compuesto, nueve días después de la inoculación, como actividad fungicida preventiva.

Septoria nodorum (roncha de gluma del trigo): se colocaron segmentos de hoja de trigo en agar, en una placa de 24 receptáculos, y se rociaron con una solución del compuesto de ensayo. Después de dejar secar por completo, durante entre 12 y 24 horas, los discos de hoja se inocularon con una suspensión de esporas del hongo. Luego de la apropiada incubación, se evaluó la actividad de un compuesto, cuatro días después de la inoculación, como actividad fungicida preventiva.

Pyrenophora teres (roncha en redecilla de la cebada): se colocaron segmentos de hoja de cebada en agar, en una placa de 24 receptáculos, y se rociaron con una solución del compuesto de ensayo. Después de dejar secar por completo, durante entre 12 y 24 horas, los discos de hoja se inocularon con una suspensión de esporas del hongo. Luego de la apropiada incubación, se evaluó la actividad de un compuesto, cuatro días después de la inoculación, como actividad fungicida preventiva.

Pyricularia oryzae (ráfaga del arroz): se colocaron segmentos de hoja de arroz en agar, en una placa de 24 receptáculos, y se rociaron con una solución del compuesto de ensayo. Después de dejar secar por completo, durante entre 12 y 24 horas, los discos de hoja se inocularon con una suspensión de esporas del

hongo. Luego de la apropiada incubación, se evaluó la actividad de un compuesto, cuatro días después de la inoculación, como actividad fungicida preventiva.

Botrytis cinerea (moho gris): se colocaron discos de hoja de haba en agar, en una placa de 24 receptáculos, y se rociaron con una solución del compuesto de ensayo. Después de dejar secar por completo, durante entre 12 y 24 horas, los discos de hoja se inocularon con una suspensión de esporas del hongo. Luego de la apropiada incubación, se evaluó la actividad de un compuesto, cuatro días después de la inoculación, como actividad fungicida preventiva.

Phytophthora infestans (tizón tardío de la papa en tomate): se colocaron discos de hoja de tomate en agar de agua, en una placa de 24 receptáculos, y se rociaron con una solución del compuesto de ensayo. Después de dejar secar por completo, durante entre 12 y 24 horas, los discos de hoja se inocularon con una suspensión de esporas del hongo. Luego de la apropiada incubación, se evaluó la actividad de un compuesto, cuatro días después de la inoculación, como actividad fungicida preventiva.

Plasmopara viticola (mildiú lanuginoso de la parra): se colocaron discos de hoja de parra en agar, en una placa de 24 receptáculos, y se rociaron con una solución del compuesto de ensayo. Después de dejar secar por completo, durante entre 12 y 24 horas, los discos de hoja se inocularon con una suspensión de esporas del hongo. Luego de la apropiada incubación, se evaluó la actividad de un compuesto, siete días después de la inoculación, como actividad fungicida preventiva.

Septoria tritici (roncha de la hoja): se mezclaron directamente conidios del hongo de almacenamiento criogénico, con caldo de cultivo de nutrientes (caldo de dextrosa de papa, PDB). Después de colocar una solución (DMSO) de los compuestos de ensayo en una placa de microvaloración (formato de 96

receptáculos), se agregó el caldo de nutrientes que contenía las esporas fúngicas. Las placas de ensayo se incubaron a 24°C, y se determinó la inhibición de crecimiento en forma fotométrica, después de 72 horas.

Fusarium culmorum (podredumbre de raíz): se mezclaron directamente conidios del hongo de almacenamiento criogénico, con caldo de cultivo de nutrientes (caldo de dextrosa de papa, PDB). Después de colocar una solución (DMSO) de los compuestos de ensayo en una placa de microvaloración (formato de 96 receptáculos), se agregó el caldo de nutrientes que contenía las esporas fúngicas. Las placas de ensayo se incubaron a 24°C, y se determinó la inhibición de crecimiento en forma fotométrica, después de 48 horas.

Pythium ultimum (enfermedad de los almácigos): se mezclaron fragmentos micélicos del hongo, preparados a partir de un cultivo líquido fresco, en caldo de cultivo de dextrosa de papa. Se diluyó con agua una solución del compuesto de ensayo en dimetilsulfóxido, hasta 20 ppm, y luego se colocó en una placa de microvaloración de 96 receptáculos, y se agregó el caldo de cultivo de nutrientes que contenía las esporas fúngicas. La placa de ensayo se incubó a 24°C, y se determinó la inhibición de crecimiento en forma fotométrica luego de las 48 horas.

Los siguientes compuestos (número de compuesto primero, seguido del número de la tabla entre paréntesis) proporcionaron por lo menos 60% de control de las siguientes infecciones fúngicas, en una proporción de 200 ppm:

Plasmopara viticola, compuestos 12 (95), 12 (99), 12 (156), 12 (159), 38 (154), 47 (91), 47 (99), 47 (118), 47 (156), 52 (90), 52 (118), 52 (156), 60 (154), 85 (118), 85 (158), 34 (161), 25 (161), 23 (161), 16 (161), 11 (161), 8 (161), 7 (161), 6 (161), 5 (161), 2 (161), 1 (161), 78 (161), 77 (161), 74 (161), 72 (161), 71 (161), 70 (161), 67 (161), 65 (161), 47 (161), 44 (161), 42 (161), 32 (162), 64 (162), 90 (162), 91 (162), 115 (162), 177 (162), 222 (162), 247 (162).

Phytophthora infestans, compuestos 12 (156), 12 (158), 12 (159), 47 (154), 47 (156), 52 (118), 34 (161), 25 (161), 6 (161), 2 (161), 78 (161), 77 (161), 76 (161), 75 (161), 67 (161), 50 (161), 48 (161), 44 (161), 32 (162), 122 (162), 179 (162), 189 (162).

Botrytis cinerea, compuestos 24 (161), 8 (161), 6 (161), 5 (161), 78 (161), 73 (161), 72 (161), 60 (161), 57 (161), 56 (161), 54 (161), 53 (161), 51 (161), 49 (161), 48 (161), 47 (161), 46 (161), 41 (161), 81 (161), 4 (162), 150 (162), 155 (162), 169 (162), 174 (162), 176 (162), 177 (162), 185 (162), 246 (162).

Pyrenophora teres, compuestos 77 (161), 76 (161), 67 (161), 51 (161), 47 (161).

Erysiphe graminis f. sp. tritici, 12 (91), 12 (94), 12 (95), 12 (99), 12 (118), 12 (119), 12 (154), 12 (155), 12 (156), 12 (159), 39 (90), 39 (94), 47 (90), 47 (91), 47 (94), 47 (99), 47 (118), 47 (155), 47 (156), 52 (91), 52 (94), 52 (99), 52 (118), 52 (154), 52 (155), 52 (158), 85 (118), 264 (158), 275 (158), 290 (154), 35 (161), 34 (161), 33 (161), 31 (161), 30 (161), 29 (161), 27 (161), 26 (161), 25 (161), 24 (161), 23 (161), 22 (161), 11 (161), 10 (161), 8 (161), 7 (161), 6 (161), 5 (161), 4 (161), 3 (161), 2 (161), 1 (161), 77 (161), 76 (161), 74 (161), 73 (161), 72 (161), 71 (161), 70 (161), 69 (161), 68 (161), 67 (161), 65 (161), 64 (161), 62 (161), 61 (161), 60 (161), 59 (161), 58 (161), 57 (161), 56 (161), 55 (161), 54 (161), 53 (161), 52 (161), 51 (161), 50 (161), 49 (161), 48 (161), 47 (161), 46 (161), 45 (161), 44 (161), 43 (161), 79 (161), 80 (161), 2 (162), 3 (162), 16 (162), 25 (162), 32 (162), 33 (162), 46 (162), 64 (162), 77 (162), 91 (162), 147 (162), 154 (162), 170 (162), 177 (162), 183 (162), 185 (162), 189 (162), 226 (162).

Pyricularia oryzae, compuestos 12 (159), 287 (155); 26 (161), 25 (161), 24 (161), 23 (161), 8 (161), 6 (161), 77 (161), 76 (161), 67 (161), 51 (161), 47 (161), 109 (162), 110 (162), 117 (162), 138 (162), 177 (162).

Puccinia recondita f. sp. tritici, compuestos 47 (94), 47 (118), 52 (118), 85 (158), 23 (161), 11 (161), 6 (161), 74 (161), 72 (161), 71 (161), 67 (161), 58 (161), 54 (161), 16 (162).

Septoria nodorum, compuestos 12 (119), 12 (159), 47 (91), 47 (94), 47 (99), 47 (118), 47 (156), 85 (118), 26 (161), 25 (161), 23 (161), 11 (161), 77 (161), 74 (161), 73 (161), 72 (161), 71 (161), 67 (161), 54 (161), 48 (161), 47 (161), 46 (161), 16 (162), 32 (162), 107 (162), 183 (162), 190 (162), 265 (162).

Septoria tritici, compuestos 12 (90), 12 (91), 12 (94), 12 (99), 12 (103), 12 (118), 12 (119), 12 (155), 12 (156), 12 (159), 38 (158), 39 (94), 39 (118), 47 (91), 47 (99), 47 (118), 47 (155), 52 (91), 52 (94), 52 (99), 52 (118), 85 (118), 85 (158), 95 (155), 181 (154), 181 (155), 189 (155), 189 (158), 190 (155), 275 (158), 290 (154), 35 (161), 33 (161), 32 (161), 31 (161), 29 (161), 27 (161), 26 (161), 25 (161), 24 (161), 23 (161), 22 (161), 11 (161), 10 (161), 9 (161), 8 (161), 6 (161), 5 (161), 3 (161), 2 (161), 1 (161), 78 (161), 77 (161), 76 (161), 74 (161), 73 (161), 72 (161), 71 (161), 70 (161), 68 (161), 67 (161), 62 (161), 60 (161), 59 (161), 58 (161), 57 (161), 56 (161), 55 (161), 54 (161), 53 (161), 52 (161), 51 (161), 50 (161), 49 (161), 48 (161), 47 (161), 46 (161), 81 (161), 1 (162), 2 (162), 3 (162), 4 (162), 5 (162), 6 (162), 7 (162), 8 (162), 9 (162), 10 (162), 11 (162), 13 (162), 16 (162), 17 (162), 18 (162), 21 (162), 23 (162), 25 (162), 26 (162), 32 (162), 33 (162), 34 (162), 36 (162), 46 (162), 49 (162), 52 (162), 54 (162), 56 (162), 59 (162), 64 (162), 65 (162), 67 (162), 87 (162), 92 (162), 101 (162), 114 (162), 115 (162), 130 (162), 147 (162), 154 (162), 155 (162), 167 (162), 171 (162), 177 (162), 183 (162), 191 (162), 197 (162), 199 (162), 226 (162), 234 (162), 268 (162).

Fusarium culmorum, compuestos 12 (91), 12 (95), 12 (103), 12 (118), 12 (119), 12 (155), 12 (159), 39 (118), 52 (158), 275 (158), 27 (161), 26 (161), 25 (161), 22 (161), 8 (161), 1 (161), 73 (161), 53 (161), 48 (161), 46 (161), 43 (161), 3 (162), 32 (162).

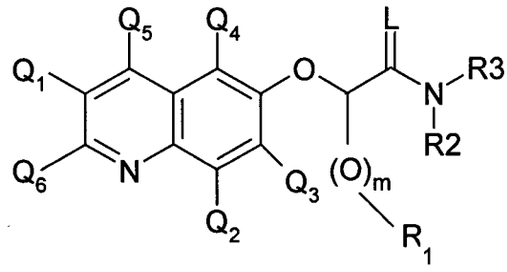
Los siguientes compuestos (número de compuesto en primer lugar, seguido del número de la tabla entre paréntesis) proporcionaron por lo menos 60% de control de la siguiente infección fúngica, en una proporción de 20 ppm:

Pythium ultimum, compuestos 12 (118), 12 (158), 12 (159), 39 (118), 39 (158), 47 (118), 52 (118), 34 (161), 30 (161), 25 (161), 1 (161), 78 (161), 77 (161), 76 (161), 75 (161), 70 (161), 50 (161), 49 (161), 48 (161), 43 (161), 37 (161), 36 (161), 23 (162), 32 (162), 54 (162), 64 (162), 65 (162), 147 (162), 177 (162), 179 (162), 181 (162), 185 (162), 189 (162), 195 (162), 253 (162), 254 (162).

300

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula general I:



(I)

donde:

Q^1, Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6, de manera independiente entre sí, son hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, azido, alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido, cicloalquilo C_{3-6} opcionalmente sustituido, cicloalquiloC_{3-6}alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido, alquenilo C_{2-6} opcionalmente sustituido, alquinilo C_{2-6} opcionalmente sustituido, alcoxi C_{1-6} opcionalmente sustituido, alqueniloxi C_{2-6} opcionalmente sustituido, alquiniloxi C_{2-6} opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, ariloxi opcionalmente sustituido, aril-alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, aril-alcoxi(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, heteroariloxi opcionalmente sustituido, heteroaril-alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, heteroaril-alcoxi(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, $-SF_5$ o $-S(O)_u$alquilo(C_{1-6}), donde u es 0, 1 ó 2, y el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halógeno; o

Q^1, Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6, de modo independiente entre sí, son $-OSO_2$alquilo(C_{1-4}), donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halógeno; o

Q^1, Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6, de manera independiente entre sí, son $-CONR^uR^v$, $-COR^u$, $-CO_2R^u$, $-CR^u{=}NR^v$, $-NR^uR^v$, $-NR^uCOR^v$, $-NR^uCO_2R^v$, $-SO_2NR^uR^v$ o $-NR^uSO_2R^w$, donde R^w es alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido, y R^u y R^v, de

modo independiente entre sí, son hidrógeno o alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido con halógeno; o, en el caso de $-CONR^uR^v$ o $-SO_2NR^uR^v$, R^uR^v pueden unirse para formar un anillo heterocíclico o carbocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene un heteroátomo seleccionado de azufre, oxígeno y NR^o, donde R^o es hidrógeno o alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido; o, en el caso de $-CR^u=NR^v$, R^v es hidrógeno, hidroxilo, o alcoxi C_{1-6};

R^1 es alquilo C_{1-4}, cicloalquilo C_{3-5}, alquenilo C_{2-4} o alquinilo C_{2-4} donde los grupos alquilo, alquenilo y alquinilo están opcionalmente sustituidos en su átomo de carbono terminal, con uno, dos o tres átomos de halógeno, con un grupo ciano, con un grupo alquilcarbonilo C_{1-4}, con un grupo alcoxicarbonilo C_{1-4} o con un grupo hidroxi; o R_1 es alcoxialquilo, alquiltioalquilo, alquilsulfinilalquilo o alquilsulfonilalquilo donde el número total de átomos de carbono es 2 ó 3; o R_1 es un grupo alcoxi C_{1-4} de cadena recta;

R^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-8}, cicloalquilo C_{3-4}, alquenilo C_{2-8}, ciano-alquilo(C_{1-4}), alcoxiC_{1-4}-alquilo(C_{1-4}), alcoxiC_{1-4}alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-4}) o benciloxi-alquilo(C_{1-4}), donde el anillo fenilo está opcionalmente sustituido con alcoxi C_{1-4};

R^3 es $-(CR^aR^b)_p(CR^cR^d)_q(X)_r(CR^eR^f)_sR^4$, donde:

R^a, R^b, R^c, R^d, R^e y R^f, de manera independiente entre sí, son hidrógeno, alquilo C_{1-4}, halógeno, ciano, hidroxi, alcoxi C_{1-4} o alcoxicarbonilo C_{1-4}; o

R^aR^b, R^cR^d o R^eR^f pueden unirse para formar un anillo heterocíclico o carbocíclico de 3 a 8 miembros que contiene un heteroátomo seleccionado de azufre, oxígeno y NR^o, donde R^o es hidrógeno o alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido;

X es (CO), (CO)O, O(CO), O, $S(O)_t$, donde t es 0, 1 o 2, o X es NH o Nalquilo(C_{1-6});

p, r y s, independientemente entre sí, son 0 ó 1;

q es 0, 1 o 2,

R^4 es alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido, alquenilo C_{2-6} opcionalmente sustituido; o

cuando por lo menos uno de p, q, r y s es 1, R^4 es $-CH_2-C\equiv C-R^5$, donde

R^5 es hidrógeno, alquilo C_{1-8} opcionalmente sustituido con halógeno, hidroxi, alcoxi C_{1-6}, alcoxiC_{1-3}alcoxi(C_{1-3}), ciano, alquilcarboniloxi C_{1-4}, aminocarboniloxi, mono- o di-alquilo(C_{1-4})aminocarboniloxi, tri-alquilo(C_{1-4})sililoxi o -$S(O)_g$alquilo(C_{1-6}), donde g es 0, 1 o 2, o R^5 es cicloalquilo C_{3-6} opcionalmente sustituido con halógeno, hidroxi, alcoxi C_{1-6}, alcoxiC_{1-3}alcoxi(C_{1-3}), ciano, alquilcarboniloxi C_{1-4}, aminocarboniloxi, mono- o di-alquilo(C_{1-4})aminocarboniloxi, tri-alquilo(C_{1-4})sililoxi o -$S(O)_g$alquilo(C_{1-6}), donde g es 0, 1 o 2, o

R^5 es cicloalquiloC_{3-6}alquilo(C_{1-4}), donde la porción alquilo y/o cicloalquilo está opcionalmente sustituida con halógeno, hidroxi, alcoxi C_{1-6}, alcoxiC_{1-3}alcoxi(C_{1-3}), ciano, alquiloC_{1-4}carboniloxi, aminocarboniloxi, mono- o di-alquilo(C_{1-4})aminocarboniloxi, tri-alquilo(C_{1-4})sililoxi o -$S(O)_g$alquilo(C_{1-6}), donde g es 0, 1 o 2, o

R^5 es arilo opcionalmente sustituido, aril-alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido, ariloxi-alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o heteroaril-alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido, o heteroariloxi-alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido; o

R^4 es cicloalquilo C_{3-6} opcionalmente sustituido, cicloalquenilo C_{5-6} opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o un anillo de 5 a 8 miembros opcionalmente sustituido que en forma opcional contiene un heteroátomo seleccionado de azufre, oxígeno o NR^0, donde R^0 es hidrógeno o alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido; o

R^2 y R^3 pueden unirse para formar un anillo de 5 ó 6- miembros opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C_{1-4}, mono- o di-alquilo(C_{1-4})aminocarbonilo, y que en forma opcional contiene un heteroátomo

seleccionado de azufre, oxígeno y NR^{00}, donde R^{00} es alquilo C_{1-4} opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi C_{1-6} o ciano; o R^{00} es fenilo opcionalmente sustituido con nitro, alquilo C_{1-4}, halo-alquilo(C_{1-4}), alquilcarbonilo C_{1-4} o heteroarilo; o R^2 y R^3 pueden unirse para formar un biciclo de 6,6 miembros opcionalmente sustituido;

L es azufre u oxígeno; y

m es 0 o 1; y

sales y N-óxidos de los compuestos de la fórmula I.

2. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno; Q^1, Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6 se definen como en la reivindicación 1.

3. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 2, donde Q^2 es metilo o etilo.

4. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es halógeno, arilo o heteroarilo; Q^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno; y Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6 se definen de acuerdo con la reivindicación 1.

5. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 4, donde Q^2 es metilo o etilo.

6. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es arilo; Q^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno y Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6 se definen de acuerdo con la reivindicación 1.

7. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 6, donde Q^2 es metilo o etilo.

8. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es heteroarilo; Q^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno; y Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6 se definen de acuerdo con lo descripto en la reivindicación 1.

9. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 8, donde Q^2 es metilo o etilo.

10. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 y Q^3, de manera independiente entre sí, son hidrógeno o halógeno; y Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno.

11. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 10, donde Q^1 y Q^3, de manera independiente entre sí, son flúor, cloro, bromo, o yodo.

12. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 10, donde Q^1 es cloro, bromo o yodo, y Q^3 es flúor o cloro.

13. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es arilo o heteroarilo; Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno y Q^3 es hidrógeno o halógeno.

14. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 13, donde Q^1 es tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, halo, o fenilo sustituido con halo o alcoxi, o piridilo sustituido con halo o alcoxi.

15. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 13, donde Q^3 es hidrógeno, flúor o cloro.

16. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1, Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno, y Q^3 es hidrógeno, halógeno o alquilo opcionalmente sustituido.

17. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 16, donde Q^3 es hidrógeno, flúor o cloro.

18. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es halógeno; Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno, y Q^3 es hidrógeno o alquilo opcionalmente sustituido.

19. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 18, donde Q^1 es cloro, bromo o yodo.

305

20. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 18, donde Q^3 es metilo.

21. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 y Q^2 son halógeno, y Q^3 es hidrógeno o alquilo opcionalmente sustituido, y Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno.

22. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 21, donde Q^1 es cloro, bromo o yodo.

23. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 21, donde Q^3 es metilo.

24. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es bromo, y Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6, de manera independiente entre sí, son hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno.

25. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 24, donde Q^2 es halógeno, y Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno.

26. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 24, donde Q^2 es metilo o etilo, y Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno.

27. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 24, donde Q^3 es flúor o cloro, y Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno.

28. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es yodo, y Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6, de manera independiente entre sí, son hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno.

29. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 28, donde Q^2 es halógeno, y Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno.

30. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 28, donde Q^2 es metilo o etilo, y Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno.

31. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 28, donde Q^3 es flúor o cloro, y Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno.

32. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es cloro, y Q^2, Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6, de modo independiente entre sí, son hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno.

33. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 32, donde Q^2 es halógeno, y Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno.

34. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 32, donde Q^2 es metilo o etilo, y Q^3, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno.

35. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 32, donde Q^3 es flúor o cloro, y Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno.

36. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es cloro, bromo o yodo.

37. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es flúor.

38. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^3 es hidrógeno o halógeno.

39. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 38, donde Q^3 es hidrógeno, flúor o cloro.

40. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 39, donde Q^3 es flúor.

41. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es bromo, Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno, y Q^3 es hidrógeno, flúor o cloro.

42. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 41, donde Q^3 es flúor.

43. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 41, donde Q^3 es cloro.

44. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 41, donde Q^3 es hidrógeno.

45. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es yodo, Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno, y Q^3 es hidrógeno, flúor o cloro.

46. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 45, donde Q^1 es yodo, Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno, y Q^3 es flúor.

47. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 45, donde Q^1 es yodo, Q^2, Q^4, Q^5 y Q^6 son hidrógeno, y Q^3 es cloro.

48. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 45, donde Q^3 es hidrógeno.

49. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es hidrógeno, halógeno, alquenilo C_{2-4} opcionalmente sustituido, alquinilo C_{2-4} opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido.

50. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde R^1 es alquilo C_{1-4}.

51. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 50, donde R^1 es metilo o etilo.

52. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 51, donde R^1 es metilo.

53. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 51, donde R^1 es etilo.

54. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde R^1 es metilo o etilo, Q^1 es hidrógeno o halógeno, Q^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno, y Q^3 es hidrógeno o halógeno.

55. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 54, donde Q^1 es cloro, bromo o yodo, Q^2 es hidrógeno, metilo, etilo, cloro o bromo, y Q^3 es flúor o bromo.

56. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde R^2 es hidrógeno o metilo.

57. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 56, donde R^2 es hidrógeno.

58. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde R^1 es metilo o etilo; R^2 es hidrógeno, Q^1 es hidrógeno o halógeno; Q^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno, y Q^3 es hidrógeno o halógeno.

59. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 58, donde Q^1 es cloro, bromo o yodo; Q^2 es hidrógeno, metilo, etilo, cloro o bromo, y Q^3 es hidrógeno, flúor o bromo.

60. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde R^3 es terbutilo, 1-halo-2-metilprop-2-ilo, 1,1-dihalo-2-metilprop-2-ilo, 1,1,1-trihalo-2-metilprop-2-ilo, 1-alcoxi-2-metilprop-2-ilo, 1-alqueniloxi-2-metilprop-2-ilo, 1-alquiniloxi-2-metilprop-2-ilo, 1-ciano-2-metil-prop-2-ilo, 1-alcoxialcoxi-2-metil-prop-2-ilo, 1-halo-3-metilbut-3-ilo, 1-alcoxi-3-metilbut-3-ilo, 1-alqueniloxi-3-metilbut-3-ilo, 1-alquiniloxi-3-metilbut-3-ilo, 1-ciano-3-metilbut-3-ilo, 2-cianoprop-2-ilo, 2-metoxicarbonilprop-2-ilo, 2-alcoxi(C_{1-2})carbonilprop-2-ilo o 2-metilaminocarbonilprop-2-ilo, 1-alquiltio-2-metilprop-2-ilo, 2-ciano-1-alcoxiprop-2-ilo, 2-ciano-1-haloprop-2-ilo, 1-alcoxi-prop-2-ilo, 1-halo-prop-2-ilo, 1-cianoalquil-3-metilbut-3-ilo, 1-haloalquil-3-metilbut-3-ilo; y R^1, R^2, Q^1, Q^2 y Q^3 se definen conforme a lo descripto en la reivindicación 1.

61. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 60, donde R^1 es metilo o etilo; R^2 es hidrógeno; Q^1 es hidrógeno o halógeno; Q^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno; y Q^3 es hidrógeno o halógeno.

62. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 61, donde Q^1 es cloro, bromo o yodo, Q^2 es hidrógeno, metilo, etilo, cloro o bromo, y Q^3 es hidrógeno, flúor, cloro o bromo.

63. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 60, donde R^3 es terbutilo, 1-halo-2-metilprop-2-ilo, 1-metoxi-2-metilprop-2-ilo, 1-etoxi-2-metilprop-2-ilo, 1-aliloxi-2-metilprop-2-ilo, 1-(prop-2-iniloxi)-2-metilprop-2-ilo, 2-ciano-1-metoxiprop-2-ilo, 2-ciano-1-haloprop-2-ilo, 2-ciano-1-etoxiprop-2-ilo, 2-ciano-1-(prop-2-iniloxi)-prop-2-ilo; y R^1, R^2, Q^1, Q^2 y Q^3 se definen de acuerdo con lo descripto en la reivindicación 1.

64. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde R^4 es alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido con alcoxiC_{1-4}-alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-4}), donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo, mono- o di-alquilamino(C_{1-6}) o tri-alquilo(C_{1-4})sililo; o R^4 es alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido con benciloxi-alquilo(C_{1-4}), donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo, mono- o di-alquilamino(C_{1-6}) o tri-alquilo(C_{1-4})sililo; o R^4 es alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido con alqueniloxi C_{2-6}, alquiniloxi C_{2-6} o -S(O)$_x$alquilo(C_{1-6}), donde x es 0, 1 o 2, y el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo, mono- o di-alquilamino(C_{1-6}); R^4 es $-CH_2-C\equiv C-R^5$, donde R^5 es hidrógeno, alquilo C_{1-8} opcionalmente sustituido con halógeno, hidroxi, alcoxi C_{1-6}, alcoxiC_{1-3}alcoxi(C_{1-3}), ciano; y R^1, R^2, Q^1, Q^2 y Q^3 se definen de acuerdo con lo descripto en la reivindicación 1.

65. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 64, donde R^1 es metilo o etilo; R^2 es hidrógeno; Q^1 es hidrógeno o halógeno; Q^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno, y Q^3 es hidrógeno o halógeno.

66. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 65, donde Q^1 es cloro, bromo o yodo; Q^2 es hidrógeno, metilo, etilo, cloro o bromo, y Q^3 es hidrógeno, flúor, cloro o bromo.

67. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde los anillos o las porciones arilo opcionalmente sustituido y heteroarilo opcionalmente sustituido de los valores R_5 están opcionalmente sustituidos con halógeno, ciano, nitro, azido, alquilo C_{1-6}, halo-alquilo(C_{1-6}), cicloalquilo C_{3-6}, cicloalquiloC_{3-6}alquilo(C_{1-4}), alquenilo C_{2-6}, halo-alquenilo(C_{2-6}), alquinilo C_{2-6}, halo-alquinilo(C_{2-6}), alcoxi C_{1-6}, halo-alcoxi(C_{1-6}), alqueniloxi C_{2-6}, halo-alqueniloxi(C_{2-6}), alquiniloxi C_{2-6}, halo-alquiniloxi(C_{2-6}), arilo, ariloxi, aril-alquilo(C_{1-6}), aril-alcoxi(C_{1-6}), heteroarilo, heteroariloxi, heteroaril-alquilo(C_{1-6}), heteroaril-alcoxi(C_{1-6}), $-SF_5$, -S(O)$_g$alquilo(C_{1-4}) donde g es 0, 1 o 2, y el alquilo está opcionalmente sustituido

con halo; o R^5 está opcionalmente sustituido con -OSO_2alquilo(C_{1-4}), donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo; o R^5 está opcionalmente sustituido con -$CONR^gR^h$, -COR^g, -CO_2R^g, -R^{gg}=NR^h, -NR^gR^h, -NR^gCOR^h, -$NR^gCO_2R^h$, -$SO_2NR^gR^h$ o –$NR^gSO_2R^i$, donde R^i es alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido con halógeno, y R^{gg} es alquileno C_{1-6} y R^g y R^h, de modo independiente entre sí, son hidrógeno o alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido con halógeno; o, en el caso de –$CONR^gR^h$ o -$SO_2NR^gR^h$, R^gR^h pueden unirse para formar un anillo heterocíclico o carbocíclico de 5 ó 6 miembros, que contiene un heteroátomo seleccionado de azufre, oxígeno o NR^0, donde R^0 es hidrógeno o alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido, y R^1, R^2, Q^1, Q^2 y Q^3 se definen de acuerdo con lo descripto en la reivindicación 1.

68. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 67, donde R^1 es metilo o etilo, R^2 es hidrógeno, Q^1 es hidrógeno o halógeno, Q^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno, y Q^3 es hidrógeno o halógeno.

69. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 67, donde Q^1 es cloro, bromo o yodo, Q^2 es hidrógeno, metilo, etilo, cloro o bromo, y Q^3 es hidrógeno, flúor, cloro o bromo.

70. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde el arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o anillo de 5 a 8 miembros opcionalmente sustituido R^4 está opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, nitro, azido, alquilo C_{1-6}, halo-alquilo(C_{1-6}), cicloalquilo C_{3-6}, cicloalquiloC_{3-6}alquilo(C_{1-4}), alquenilo C_{2-6}, halo-alquenilo(C_{2-6}), alquinilo C_{2-6}, halo-alquinilo(C_{2-6}), alcoxi C_{1-6}, halo-alcoxi(C_{1-6}), alqueniloxi C_{2-6}, halo-alqueniloxi(C_{2-6}), alquiniloxi C_{2-6}, halo-alquiniloxi(C_{2-6}), -SF_5, -$S(O)_x$alquilo(C_{1-6}), donde x es 0, 1 o 2, y el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo; o R^4 está opcionalmente sustituido con -OSO_2alquilo(C_{1-4}), donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halógeno, -$CONR^xR^y$, -$CON(OR^x)R^y$, -COR^x, -CO_2R^x, -CR^x=NR^y,

$-NR^xR^y$, $-NR^xCOR^y$, $-NR^xCO_2R^y$, $-SO_2NR^xR^y$ o $-NR^xSO_2R^z$, donde R^z es alquilo C_{1-8} opcionalmente sustituido con halógeno, y R^x y R^y, de modo independiente entre sí, son hidrógeno o alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido con halógeno, y R^1, R^2, Q^1, Q^2 y Q^3 se definen de acuerdo con lo descripto en la reivindicación 1.

71. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 70, donde R^1 es metilo o etilo; R^2 es hidrógeno; Q^1 es hidrógeno o halógeno; Q^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o halógeno; y Q^3 es hidrógeno o halógeno.

72. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 71, donde Q^1 es cloro, bromo o yodo, Q^2 es hidrógeno, metilo, etilo, cloro o bromo, y Q^3 es hidrógeno, flúor, cloro o bromo.

73. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde L es oxígeno.

74. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde m es 0.

75. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde m es 1.

76. Un proceso para la preparación de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, como se describe en esta solicitud.

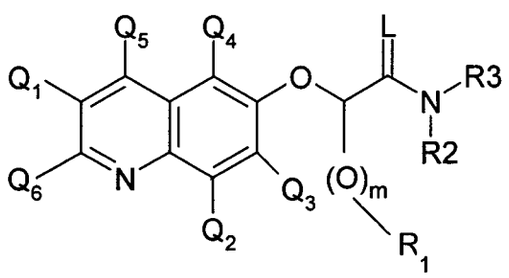
77. Una composición fungicida que comprende una cantidad fungicidamente eficaz de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 y un diluyente o portador adecuado para dicho compuesto.

78. Un método para combatir o controlar hongos fitopatógenos, que comprende la aplicación de una cantidad fungicidamente eficaz de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, a una planta, a una semilla de una planta, al lugar de la planta o semilla, o al suelo o a cualquier otro medio de crecimiento de plantas.

312

RESUMEN

Compuestos de la fórmula general



(I),

donde los sustituyentes se definen de acuerdo con la reivindicación 1, útiles como fungicidas.

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
TARJETA ARCHIVO PROPIETARIOS

PATENTE DE INVENCION ____ PCT __X__ MODELO DE UTILIDAD ____ DISEÑO INDUSTRIAL ___

(21) N° de solicitud: (22) Fecha de solicitud:
(51) Clasificación Internacional :

(71)Solicitante(s) **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**

(72) Inventor(es) **LAURA QUARANTA, HANS-GEORG BRUNNER, RENAUD BEAUDEGNIES, FREDRIK CEDERBAUM, FIONA MURPHY KESSABI**

(74) Apoderado: **DRA. MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO**

(30) Prioridad	(31) **No. Prioridad**	32) **Fecha**	(33) **País**
	0704906.7	**14/03/2007**	**GB**

(85) Fecha inicio fase nacional:
(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT
Fecha de presentación de la solicitud: **12/03/2008**
No. de solicitud **PCT/EP2008/001974**

(87) Publicación internacional
Fecha: **18/09/2008**
N° publicación: **WO 2008/110355 A1**

(54) Titulo: **DERIVADOS DE QUINOLINA COMO FUNGICIDAS**

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL TRÁMITE

	USUARIO	RADICADOR
PATENTE DE INVENCION (X) MODELO DE UTILIDAD ( )	(X)	(✓)
- Indicación de que se solicita la concesión de una patente	(X)	(✓)
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud	(X)	(✓)
- Descripción de la invención	(X)	(✓)
- Dibujos de ser estos pertinentes	( )	(✓)
- Comprobante de pago de las tasas establecidas	(X)	(✓)

COMPLETA (X) 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 ( )

EZQUEMA DE TRAZADO ( )

- 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 del Esquema de Trazado	( )	( )
- Comprobante de pago de las tasas establecidas	( )	( )

COMPLETA ( ) INCOMPLETA ( )

Firma responsable: _____

Fecha: _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 09-097220- -00000-0000
Fecha: 2009-09-10 15:26:30 Dep. 2020 NUECREACIONI
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 314