Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
INVENTARIO

PCT

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCIÓN

21. **EXPEDIENTE No.** 03-67453

54. **TÍTULO** "Derivado de Isoxazolina y herbicida que lo contiene como ingrediente activo

51. **CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL** C07D 26/10

71. **SOLICITANTE** Kumiai chemical Industry co., Ltd e Phaiq chemical Industry co. Ltd

DOMICILIO Tokio - Japón

74. **APODERADO** Emilio Forero
Codigo No. 2092

22. **BOGOTÁ, D. C.,**

37

64

(FORMA P-10)

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCI

PETITORIO

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 03067453 00000000 Folios: 277
Fecha (AMD): 2003-08-06 17:04:23
Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

dicación

03 067453 00

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

1 **SOLICITUD DE:**

☒ Patente de Invención. ☐ Patente de Modelo de Utilidad.

☐ Capítulo I. ☒ Capítulo II.

SOLICITANTE (71)

Nombre: **KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD. e IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO. LTD.**
sociedades constituidas y existentes bajo las leyes del Japón.

Dirección: 4-26 Ikenohata 1-chome, Taito-ku, Tokyo 110-0008 Japón.
Domicilio: Tokyo , Japón.

IDENTIFICACION

C.C. ☐ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐ Cual_____

Número: _____

3 **REPRESENTANTE O APODERADO**

Nombre: EMILIO FERRERO

Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35
Teléfono: 347 36 11
Fax:: 217 92 11
E-mail: clientes@camyp.com.
Domicilio: Bogotá, Colombia.

IDENTIFICACION

C.C. ☒ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐ Cual_____

Número: 438.019 T.P. 31.929

4 **INVENTOR (ES) (72)**

1- **Masao NAKATANI**
C/O K.I. CHEMICAL RESEARCH INSTITUTE CO. LTD.
408-1 Shioshinden, Fukude-cho,
Iwata-gun Shizuoka 437-1213,
Japón
2- Ryotaro KUGO
5-27-23, Okada, Sen-nan-shi,
Osaka 590-0531,
Japón
3- Masahiro MIYAZAKI
C/O K.I. CHEMICAL RESEARCH INSTITUTE CO. LTD.
408-1 Shioshinden, Fukude-cho,
Iwata-gun Shizuoka 437-1213,
Japón
4- Koichiro KAKU
276-1, Hiruike, Fukude-cho, Iwata–gun,
Shizuoka 437-1207,
Japón.
5- Makoto FUJINAMI
1809, Kamo, Kikugawa-cho, Ogasa-gun,
Shizuoka 439-0031,
Japón
6- Ryohei UENO
1809, Kamo, Kikugawa-cho, Ogasa-gun,
Shizuoka 439-0031,
Japón
7-.Satoru TAKAHASHI
5-18, Yoshino-cho,
Shizuoka-shi,
Shizuoka 420-0046,
Japón.

5 **PCT (86)**

Solicitud Internacional No. PCT/JP/02/01015 Fecha: 7 de febrero de 2002

Publicación Internacional No. WO 02/062770 A1 Fecha : 15 de agosto de 2002

(6) **Título (54)** DERIVADO DE ISOXAZOLINA Y HERBICIDA QUE LO CONTIENE COMO INGREDIENTE ACTIVO 2

(7) **Clasificación Internacional (51)** C07D 261/10

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

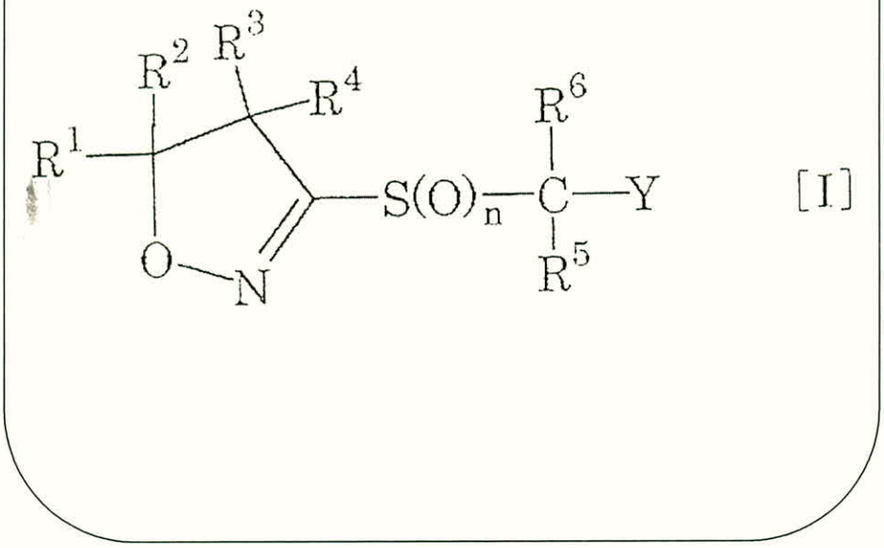
(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud
JP.	8 de febrero de 2001	2001-031784

(9) **Comprobante de pago No.:** 03-50.621 **Fecha:** 21 de julio de 2003

(10) **Anexos:**

- [X] Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por $ 400.000.oo.
- [ ] Comprobante de pago por reivindicación de prioridad.
- [X] Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
- [X] Poderes, si fuere el caso.
- [ ] 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)
- [X] Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- [X] Traducción del examen preliminar 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.
- [ ] Otros

11 FIGURA CARACTERISTICA: 3



[I]

12 Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: EMILIO FERRERO

FIRMA :

C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

lllR -

特許協力条約に基づく国際出願

願　　書

出願人は、この国際出願が特許協力条約に従って処理されることを請求する。

受理官庁記入欄	
国際出願番号	
国際出願日	PCT 07.2.02 受領印
（受付印）	

出願人又は代理人の書類記号（希望する場合、最大１２字）: 02-PCT-01

第Ⅰ欄　発明の名称

イソオキサゾリン誘導体及びこれを有効成分とする除草剤

第Ⅱ欄　出願人　☐ この欄に記載した者は、発明者でもある。

氏名（名称）及びあて名：（姓・名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）

クミアイ化学工業株式会社
KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.
〒１１０－０００８　日本国東京都台東区池之端１丁目４番２６号
4-26, Ikenohata 1-chome, Taito-ku, Tokyo 110-0008 Japan

電話番号：03-3822-5177
ファクシミリ番号：
加入電信番号：
出願人登録番号：

国籍（国名）：日本国　JAPAN　　住所（国名）：日本国　JAPAN

この欄に記載した者は、次の指定国についての出願人である：
☐ すべての指定国　☑ 米国を除くすべての指定国　☐ 米国のみ　☐ 追記欄に記載した指定国

第Ⅲ欄　その他の出願人又は発明者

氏名（名称）及びあて名：（姓・名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）

イハラケミカル工業株式会社
IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.
〒１１０－０００８　日本国東京都台東区池之端１丁目４番２６号
4-26, Ikenohata 1-chome, Taito-ku, Tokyo 110-0008 Japan

この欄に記載した者は次に該当する：
☑ 出願人のみである。
☐ 出願人及び発明者である。
☐ 発明者のみである。（ここにレ印を付したときは、以下に記入しないこと）
出願人登録番号：

国籍（国名）：日本国　JAPAN　　住所（国名）：日本国　JAPAN

この欄に記載した者は、次の指定国についての出願人である：
☐ すべての指定国　☑ 米国を除くすべての指定国　☐ 米国のみ　☐ 追記欄に記載した指定国

☑ その他の出願人又は発明者が続葉に記載されている。

第Ⅳ欄　代理人又は共通の代表者、通知のあて名

次に記載された者は、国際機関において出願人のために行動する：　☑ 代理人　☐ 共通の代表者

氏名（名称）及びあて名：（姓・名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）

９１２４　弁理士　小　林　　雅　人　KOBAYASHI Masato
〒１６２－０８２５　日本国東京都新宿区神楽坂４丁目３番地
煉瓦塔ビル５階
5th Floor, Renga-toh Building, 3, Kagurazaka 4-chome,
Shinjuku-ku, Tokyo 162-0825 Japan

電話番号：03-3266-0655
ファクシミリ番号：03-3266-0675
加入電信番号：
代理人登録番号：

☐ 通知のためのあて名：代理人又は共通の代表者が選任されておらず、上記枠内に特に通知が送付されるあて名を記載している場合は、レ印を付す。

願書の備考参照

5
4

第III欄の続き　その他の出願人又は発明者

この続葉を使用しないときは、この用紙を願書に含めないこと。

氏名（名称）及びあて名：（姓・名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）
中谷　昌央　NAKATANI Masao
〒437－1213　日本国静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の1
株式会社ケイ・アイ研究所内
c/o K・I CHEMICAL RESEARCH INSTITUTE CO., LTD.
408-1, Shioshinden, Fukude-cho, Iwata-gun,Shizuoka 437-1213 Japan

この欄に記載した者は次に該当する：
☐出願人のみである。
☑出願人及び発明者である。
☐発明者のみである。（ここにレ印を付したときは、以下に記入しないこと）

出願人登録番号：

国籍（国名）：日本国　JAPAN
住所（国名）：日本国　JAPAN

この欄に記載した者は、次の指定国についての出願人である：
☐すべての指定国　☐米国を除くすべての指定国　☑米国のみ　☐追記欄に記載した指定国

氏名（名称）及びあて名：（姓・名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）
久語　良太郎　KUGO Ryotaro
〒590－0531　日本国大阪府泉南市岡田5丁目27番23号
5-27-23, Okada, Sen-nan-shi, Osaka 590-0531 Japan

この欄に記載した者は次に該当する：
☐出願人のみである。
☑出願人及び発明者である。
☐発明者のみである。（ここにレ印を付したときは、以下に記入しないこと）

出願人登録番号：

国籍（国名）：日本国　JAPAN
住所（国名）：日本国　JAPAN

この欄に記載した者は、次の指定国についての出願人である：
☐すべての指定国　☐米国を除くすべての指定国　☑米国のみ　☐追記欄に記載した指定国

氏名（名称）及びあて名：（姓・名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）
宮崎　雅弘　MIYAZAKI Masahiro
〒437－1213　日本国静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の1
株式会社ケイ・アイ研究所内
c/o K・I CHEMICAL RESEARCH INSTITUTE CO., LTD.
408-1, Shioshinden, Fukude-cho, Iwata-gun, Shizuoka 437-1213 Japan

この欄に記載した者は次に該当する：
☐出願人のみである。
☑出願人及び発明者である。
☐発明者のみである。（ここにレ印を付したときは、以下に記入しないこと）

出願人登録番号：

国籍（国名）：日本国　JAPAN
住所（国名）：日本国　JAPAN

この欄に記載した者は、次の指定国についての出願人である：
☐すべての指定国　☐米国を除くすべての指定国　☑米国のみ　☐追記欄に記載した指定国

氏名（名称）及びあて名：（姓・名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）
角　康一郎　KAKU Koichiro
〒437－1207　日本国静岡県磐田郡福田町蛭池276番地の1
276-1, Hiruike, Fukude-cho, Iwata-gun, Shizuoka 437-1207 Japan

この欄に記載した者は次に該当する：
☐出願人のみである。
☑出願人及び発明者である。
☐発明者のみである。（ここにレ印を付したときは、以下に記入しないこと）

出願人登録番号：

国籍（国名）：日本国　JAPAN
住所（国名）：日本国　JAPAN

この欄に記載した者は、次の指定国についての出願人である：
☐すべての指定国　☐米国を除くすべての指定国　☑米国のみ　☐追記欄に記載した指定国

☐その他の出願人又は発明者が他の続紙に記載されている。

願書の備考参照

6 6

第III欄の続き　その他の出願人又は発明者

この続葉を使用しないときは、この用紙を願書に含めないこと。

氏名（名称）及びあて名：（姓・名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）
藤　波　　周　　FUJINAMI Makoto
〒４３９－００３１　日本国静岡県小笠郡菊川町加茂１８０９番地
1809, Kamo, Kikugawa-cho, Ogasa-gun, Shizuoka 439-0031 Japan

この欄に記載した者は次に該当する：
☐ 出願人のみである。
☑ 出願人及び発明者である。
☐ 発明者のみである。（ここにレ印を付したときは、以下に記入しないこと）
出願人登録番号：

国籍（国名）：日本国　JAPAN
住所（国名）：日本国　JAPAN

この欄に記載した者は、次の指定国についての出願人である：
☐ すべての指定国　☐ 米国を除くすべての指定国　☑ 米国のみ　☐ 追記欄に記載した指定国

氏名（名称）及びあて名：（姓・名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）
上　野　　良　平　　UENO Ryohei
〒４３９－００３１　日本国静岡県小笠郡菊川町加茂１８０９番地
1809, Kamo, Kikugawa-cho, Ogasa-gun, Shizuoka 439-0031 Japan

この欄に記載した者は次に該当する：
☐ 出願人のみである。
☑ 出願人及び発明者である。
☐ 発明者のみである。（ここにレ印を付したときは、以下に記入しないこと）
出願人登録番号：

国籍（国名）：日本国　JAPAN
住所（国名）：日本国　JAPAN

この欄に記載した者は、次の指定国についての出願人である：
☐ すべての指定国　☐ 米国を除くすべての指定国　☑ 米国のみ　☐ 追記欄に記載した指定国

氏名（名称）及びあて名：（姓・名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）
高　橋　　智　　TAKAHASHI Satoru
〒４２０－００４６　日本国静岡県静岡市吉野町５番地の１８
5-18, Yoshino-cho, Shizuoka-shi, Shizuoka 420-0046 Japan
日本国　JAPAN　　日本国　JAPAN

この欄に記載した者は次に該当する：
☐ 出願人のみである。
☑ 出願人及び発明者である。
☐ 発明者のみである。（ここにレ印を付したときは、以下に記入しないこと）
出願人登録番号：

国籍（国名）：日本国　JAPAN
住所（国名）：日本国　JAPAN

この欄に記載した者は、次の指定国についての出願人である：
☐ すべての指定国　☐ 米国を除くすべての指定国　☑ 米国のみ　☐ 追記欄に記載した指定国

氏名（名称）及びあて名：（姓・名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）

この欄に記載した者は次に該当する：
☐ 出願人のみである。
☐ 出願人及び発明者である。
☐ 発明者のみである。（ここにレ印を付したときは、以下に記入しないこと）
出願人登録番号：

国籍（国名）：
住所（国名）：

この欄に記載した者は、次の指定国についての出願人である：
☐ すべての指定国　☐ 米国を除くすべての指定国　☐ 米国のみ　☐ 追記欄に記載した指定国

☐ その他の出願人又は発明者が他の続葉に記載されている。

第Ⅴ欄　国の指定　(該当する□にレ印を付すこと；少なくとも1つの□にレ印を付すこと)。

規則4.9(a)の規定に基づき次の指定を行う。ほかの種類の保護又は取扱をいずれかの指定国（又はOAPI）で求める場合には追記欄に記載する。

広域特許

☑ＡＰ　ＡＲＩＰＯ特許：ＧＨガーナ Ghana，ＧＭガンビア Gambia，ＫＥケニア Kenya，ＬＳレソト Lesotho，ＭＷマラウイ Malawi，ＭＺモザンビーク Mozambique，ＳＤスーダン Sudan，ＳＬシエラ・レオネ Sierra Leone，ＳＺスワジランド Swaziland，ＴＺタンザニア United Republic of Tanzania，ＵＧウガンダ Uganda，ＺＭザンビア Zambia，ＺＷジンバブエ Zimbabwe，及びハラレプロトコルと特許協力条約の締約国である他の国 *(他の種類の保護又は取り扱いを求める場合には点線上に記載する)*

☑ＥＡ　ユーラシア特許：ＡＭアルメニア Armenia，ＡＺアゼルバイジャン Azerbaijan，ＢＹベラルーシ Belarus，ＫＧキルギスタン Kyrgyzstan，ＫＺカザフスタン Kazakhstan，ＭＤモルドヴァ Republic of Moldova，ＲＵロシア Russian Federation，ＴＪタジキスタン Tajikistan，ＴＭトルクメニスタン Turkmenistan，及びユーラシア特許条約と特許協力条約の締約国である他の国

☑ＥＰ　ヨーロッパ特許：ＡＴオーストリア Austria，ＢＥベルギー Belgium，ＣＨ and ＬＩスイス及びリヒテンシュタイン Switzerland and Liechtenstein，ＣＹキプロス Cyprus，ＤＥドイツ Germany，ＤＫデンマーク Denmark，ＥＳスペイン Spain，ＦＩフィンランド Finland，ＦＲフランス France，ＧＢ英国 United Kingdom，ＧＲギリシャ Greece，ＩＥアイルランド Ireland，ＩＴイタリア Italy，ＬＵルクセンブルグ Luxembourg，ＭＣモナコ Monaco，ＮＬオランダ Netherlands，ＰＴポルトガル Portugal，ＳＥスウェーデン Sweden，ＴＲトルコ Turkey，及びヨーロッパ特許条約と特許協力条約の締約国である他の国

☑ＯＡ　ＯＡＰＩ特許：ＢＦブルキナ・ファソ Burkina Faso，ＢＪベナン Benin，ＣＦ中央アフリカ Central African Republic，ＣＧコンゴ Congo，ＣＩコートジボアール Côte d'Ivoire，ＣＭカメルーン Cameroon，ＧＡガボン Gabon，ＧＮギニア Guinea，ＧＱ赤道ギニア Equatorial Guinea，ＧＷギニア・ビサオ Guinea-Bissau，ＭＬマリ Mali，ＭＲモーリタニア Mauritania，ＮＥニジェール Niger，ＳＮセネガル Senegal，ＴＤチャド Chad，ＴＧトーゴ Togo，及びアフリカ知的所有権機構のメンバー国であり特許協力条約の締約国である他の国 *(他の種類の保護又は取り扱いを求める場合には点線上に記載する)*

国内特許 *(他の種類の保護又は取り扱いを求める場合には点線上に記載する)*

☑ＡＥアラブ首長国連邦 United Arab Emirates
☑ＡＧアンティグア・バーブーダ Antigua and Barbuda
☑ＡＬアルバニア Albania
☑ＡＭアルメニア Armenia
☑ＡＴオーストリア Austria
☑ＡＵオーストラリア Australia
☑ＡＺアゼルバイジャン Azerbaijan
☑ＢＡボスニア・ヘルツェゴヴィナ Bosnia and Herzegovina
☑ＢＢバルバドス Barbados
☑ＢＧブルガリア Bulgaria
☑ＢＲブラジル Brazil
☑ＢＹベラルーシ Belarus
☑ＢＺベリーズ Belize
☑ＣＡカナダ Canada
☑ＣＨand ＬＩスイス及びリヒテンシュタイン Switzerland and Liechtenstein
☑ＣＮ中国 China
☑ＣＯコロンビア Colombia
☑ＣＲコスタリカ Costa Rica
☑ＣＵキューバ Cuba
☑ＣＺチェコ Czech Republic
☑ＤＥドイツ Germany
☑ＤＫデンマーク Denmark
☑ＤＭドミニカ Dominica
☑ＤＺアルジェリア Algeria
☑ＥＣエクアドル Equador
☑ＥＥエストニア Estonia
☑ＥＳスペイン Spain
☑ＦＩフィンランド Finland
☑ＧＢ英国 United Kingdom
☑ＧＤグレナダ Grenada
☑ＧＥグルジア Georgia
☑ＧＨガーナ Ghana
☑ＧＭガンビア Gambia
☑ＨＲクロアチア Croatia
☑ＨＵハンガリー Hungary
☑ＩＤインドネシア Indonesia
☑ＩＬイスラエル Israel
☑ＩＮインド India
☑ＩＳアイスランド Iceland
☐ＪＰ日本 Japan
☑ＫＥケニア Kenya
☑ＫＧキルギスタン Kyrgyzstan
☑ＫＰ北朝鮮 Democratic People's Republic of Korea
☑ＫＲ韓国 Republic of Korea
☑ＫＺカザフスタン Kazakhstan
☑ＬＣセント・ルシア Saint Lucia
☑ＬＫスリ・ランカ Sri Lanka
☑ＬＲリベリア Liberia
☑ＬＳレソト Lesotho
☑ＬＴリトアニア Lithuania
☑ＬＵルクセンブルグ Luxembourg
☑ＬＶラトヴィア Latvia
☑ＭＡモロッコ Morocco
☑ＭＤモルドヴァ Republic of Moldova
☑ＭＧマダガスカル Madagascar
☑ＭＫマケドニア旧ユーゴスラヴィア共和国 The former Yugoslav Republic of Macedonia
☑ＭＮモンゴル Mongolia
☑ＭＷマラウイ Malawi
☑ＭＸメキシコ Mexico
☑ＭＺモザンビーク Mozambique
☑ＮＯノルウェー Norway
☑ＮＺニュー・ジーランド New Zealand
☑ＯＭオマーン Oman
☑ＰＨフィリピン Philippines
☑ＰＬポーランド Poland
☑ＰＴポルトガル Portugal
☑ＲＯルーマニア Romania
☑ＲＵロシア Russian Federation
☑ＳＤスーダン Sudan
☑ＳＥスウェーデン Sweden
☑ＳＧシンガポール Singapore
☑ＳＩスロヴェニア Slovenia
☑ＳＫスロヴァキア Slovakia
☑ＳＬシエラ・レオネ Sierra Leone
☑ＴＪタジキスタン Tajikistan
☑ＴＭトルクメニスタン Turkmenistan
☑ＴＮチュニジア Tunisia
☑ＴＲトルコ Turkey
☑ＴＴトリニダッド・トバゴ Trinidad and Tobago
☑ＴＺタンザニア United Republic of Tanzania
☑ＵＡウクライナ Ukraine
☑ＵＧウガンダ Uganda
☑ＵＳ米国 United States of America
☑ＵＺウズベキスタン Uzbekistan
☑ＶＮベトナム Viet Nam
☑ＹＵユーゴスラヴィア Yugoslavia
☑ＺＡ南アフリカ共和国 South Africa
☑ＺＭザンビア Zambia
☑ＺＷジンバブエ Zimbabwe

以下の□は、この様式の施行後に特許協力条約の締約国となった国を指定するためのものである。

☐　☐　☐
☐　☐　☐

指定の確認の宣言：出願人は、上記の指定に加えて、規則4.9(b)の規定に基づき、特許協力条約の下で認められる他の全ての国の指定を行う。但し、追記欄にこの宣言から除く旨の表示をした国は、指定から除かれる。出願人は、これらの追加される指定が確認を条件としていること、並びに優先日から15月が経過する前にその確認がなされない指定は、この期間の経過時に、出願人によって取り下げられたものとみなされることを宣言する。*(指定の確認は、指定を特定する通知の提出と指定手数料及び確認手数料の納付からなる。この確認は、優先日から15月以内に受理官庁へ提出しなければならない。)*

第VI欄　優先権主張

以下の先の出願に基づく優先権を主張する：

先の出願日 (日．月．年)	先の出願番号	先の出願		
		国内出願：国名	広域出願：＊広域官庁名	国際出願：受理官庁名
(1) 08.02.01	特願 2001-031784	日本国　JAPAN		
(2)				
(3)				
(4)				
(5)				

☐ 他の優先権の主張（先の出願）が追記欄に記載されている。

上記の先の出願（ただし、*米国際出願の受理官庁に対して出願されたものに限る*）のうち、以下のものについて、出願書類の認証謄本を作成し国際事務局へ送付することを、受理官庁（日本国特許庁の長官）に対して請求する

☐すべて　☐優先権(1)　☐優先権(2)　☐優先権(3)　☐優先権(4)　☐優先権(5)　☐その他は追記欄参照

＊先の出願がＡＲＩＰＯ出願である場合には、当該先の出願を行った工業所有権の保護のためのパリ条約同盟国若しくは世界貿易機関の加盟国の少なくとも1ヶ国を表示しなければならない (規則 4.10(b)(ii))：

第VII欄　国際調査機関

国際調査機関（ＩＳＡ）の選択（２以上の国際調査機関が国際調査を実施することが可能な場合、いずれかを選択し二文字コードを記載。）

ＩＳＡ／JP

先の調査結果の利用請求；当該調査の照会（*先の調査が、国際調査機関によって既に実施又は請求されている場合*）

出願日（日．月．年）　　出願番号　　国名（又は広域官庁名）

第VIII欄　申立て

この出願は以下の申立てを含む。*（下記の該当する欄をチェックし、右にそれぞれの申立て数を記載）*　　申立て数

☐第VIII欄(i)　発明者の特定に関する申立て　：＿＿＿＿

☐第VIII欄(ii)　出願し及び特許を与えられる国際出願日における出願人の資格に関する申立て　：＿＿＿＿

☐第VIII欄(iii)　先の出願の優先権を主張する国際出願日における出願人の資格に関する申立て　：＿＿＿＿

☐第VIII欄(iv)　発明者である旨の申立て（米国を指定国とする場合）　：＿＿＿＿

☐第VIII欄(v)　不利にならない開示又は新規性喪失の例外に関する申立て　：＿＿＿＿

願書の備考参照

第IX欄　照合欄；出願の言語

この国際出願の紙様式の枚数は次のとおりである。
(a) 紙形式での枚数

願書（申立てを含む）……	6	枚
明細書（配列表を除く）……	268	枚
請求の範囲……	8	枚
要約書……	1	枚
図面……		枚
小計……	283	枚
明細書の配列表部分……		枚

（紙形式での出願の場合はその枚数
コンピュータ読み取り可能な形式の有無を問わない。
下記(b)参照）

合　計　283 枚

(b)コンピュータ読み取り可能な形式による配列表部分

(i) ☐ コンピュータ読み取り可能な形式のみ（実施細則第 801 号(a)(i)）

(ii) ☐ 紙形式に追加（実施細則第 801 号(a)(ii)）

配列表部分を含む媒体の種類（フレキシブルディスク、CD-ROM、CD-R その他）と枚数
（追加的写しは右欄 9．(ii)に記載）

この国際出願には、以下にチェックしたものが添付されている。

		数
1.	☑ 手数料計算用紙	1
	☑ 納付する手数料に相当する特許印紙を貼付した書面	1
	☑ 国際事務局の口座への振込を証明する書面	1
2.	☐ 個別の委任状の原本	
3.	☐ 包括委任状の原本	
4.	☐ 包括委任状の写し（あれば包括委任状番号）	
5.	☐ 記名押印（署名）の欠落についての説明書	
6.	☐ 優先権書類（上記第VI欄の（ ）の番号を記載する）：	
7.	☐ 国際出願の翻訳文（翻訳に使用した言語名を記載する）：	
8.	☐ 寄託した微生物又は他の生物材料に関する書面	
9.	☐ コンピュータ読み取り可能なヌクレオチド又はアミノ酸配列表（媒体の種類（フレキシブルディスク、CD-ROM、CD-R その他）と枚数も表示する）	
	(i) ☐ 規則 13 の 3 に基づき提出する国際調査のための写し（国際出願の一部を構成しない）	
	(ii) ☐ （左欄(b)(i)又は(b)(ii)にレ印を付した場合のみ）規則 13 の 3 に基づき提出する国際調査のための写しを含む追加的写し	
	(iii) ☐ 国際調査のための写しの同一性、又は左欄に記載した配列表部分を含む写しの同一性についての陳述書を添付	
10.	☐ その他（書類名を具体的に記載）：	

要約書とともに提示する図面：

本国際出願の言語：　日本語

第X欄　出願人、代理人又は非通の代表者の記名押印

各人の氏名（名称）を記載し、その次に押印する。

小林　雅人

受理官庁記入欄

1．国際出願として提出された書類の実際の受理の日

3．国際出願として提出された書類を補完する書面又は図面であってその後期間内に受理されたものの実際の受理の日（訂正日）

4．特許協力条約第１１条（２）に基づく必要な補完の期間内の受理の日

5．出願人により特定された国際調査機関　ＩＳＡ／

6．☐ 調査手数料未払いにつき、国際調査機関に調査用写しを送付していない。

2．図面
☐ 受理された
☐ 不足図面がある

国際事務局記入欄

記録原本の受理の日：

様式ＰＣＴ／ＲＯ／１０１（最終用紙）（２００１年３月版）

手数料計算用紙の備考参照

10
10

この用紙は、国際出願の一部を構成せず、国際出願の用紙の枚数に算入しない。

PCT

手数料計算用紙

願書付属書

受理官庁記入欄	
国際出願番号	
受理官庁の日付印	

出願人又は代理人の書類記号
02-PCT-01

出願人
クミアイ化学工業株式会社
イハラケミカル工業株式会社

所定の手数料の計算

1．及び2．特許協力条約に基づく国際出願に関する法律（国内法）第18条第1項第1号の規定による手数料 *(注1)*
（送付手数料[T]及び調査手数料[S]の合計）

90000 円 | T+S

3．国際手数料 *(注2)*

基本手数料
国際出願に含まれる用紙の枚数 283 枚

b1 最初の30枚まで…… 47800 円 | b1

b2 253（30枚を超える用紙の枚数） × 1100（用紙一枚の手数料） = 278300 円 | b2

b3 追加的部分（明細書の一部がコンピュータ読み取り可能な形式のみの場合（第801号(a)(i)）又はコンピュータ読み取り可能な形式と紙形式の両方である場合（第801号(a)(ii)）

400 × ＿＿＿＿（用紙一枚の手数料） = 円 | b3

b1, b2 及び b3 に記入した金額を加算し、合計額を B に記入 326100 円 | B

指定手数料
国際出願に含まれる指定数 92 *(注3)*

5（1支払うべき指定手数料の数（上限は5））*(注4)* × 10300（1指定当たりの手数料（円））= 51500 円 | D

B及びDに記入した金額を加算し、合計額をIに記入…… 377600 円 | I

4．納付すべき手数料の合計

T+S 及び I に記入した金額を加算し、総額を合計に記入…… 467600 円

合　計

(注1) 送付手数料及び調査手数料については、合計金額を特許印紙をもって納付しなければならない。

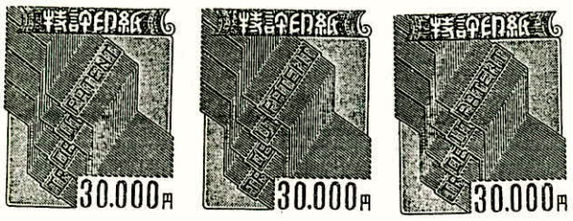
(注2) 国際手数料については、受理官庁である日本国特許庁の長官が告示する国際事務局の口座へ振込みを証明する書面を提出することにより納付しなければならない。

(注3) 願書第V欄でレ印を記した□の数。

(注4) 指定数を記入する。ただし、5指定以上は一律5とする。

様式PCT／RO／101（付属書）（2002年1月版）

手数料計算用紙の備考参照



送付手数料・調査手数料　９０，０００円

ご利用明細

ご来店いただき
ありがとうございます。

東京三菱銀行

年月日	取扱店番	お取引内容
140206	005220 3	お振込

受付通番	銀行番号	支店番号	口座番号
4124			[redacted]

時刻	税込手数料	お取引金額
13.43	￥315★	￥377,600★

お取扱いできない場合	残高

ご案内 ********** おつり ￥100★ **********

お振込先は
東京三菱銀行
虎ノ門支店
普通　2074896
WIPO-PCT GENEVA様
ご依頼人は
ｺﾊﾞﾔｼ　ﾏｻﾄ様
電話　0332660655

基本手数料	326,100円
指定手数料	51,500円
合　計	377,600円

13/73

特許協力条約

発信人　日本国特許庁（受理官庁）

出願人代理人

小林　雅人

殿

あて名

〒162－0825

東京都新宿区神楽坂４丁目３番地　煉瓦塔ビル５階　小林・吉村特許事務所

PCT／JP02／01015　　RO105

RECEIVED 01.12.20 K&Y

PCT

国際出願番号及び国際出願日の通知書

（法施行規則第２２条、第２３条）
〔PCT規則２０．５（c）〕

	発送日（日．月．年） 19．02．02	
出願人又は代理人の書類記号　02－PCT－01	重要な通知	
国際出願番号 PCT／JP02／01015	国際出願日（日．月．年） 07．02．02	優先日（日．月．年） 08．02．01
出願人（氏名又は名称） クミアイ化学工業株式会社		

1．この国際出願は、上記の国際出願番号及び国際出願日が付与されたことを通知する。

記録原本は、19日02月02年に国際事務局に送付した。

注　　意

a．　国際出願番号は、特許協力条約を表示する「PCT」の文字、斜線、受理官庁を表示する２文字コード（日本の場合JP）、西暦年の最後から２桁の数字、斜線、及び５桁の数字からなっています。

b．　国際出願日は、「特許協力条約に基づく国際出願に関する法律」第４条第１項の要件を満たした国際出願に付与されます。

c．　あて名等を変更したときは、速やかにあて名の変更届等を提出して下さい。

d．　電子計算機による漢字処理のため、漢字の一部を当用漢字、又は、仮名に置き換えて表現してある場合もありますので御了承下さい。

e．　この通知に記載された出願人のあて名、氏名（名称）に誤りがあるときは申出により訂正します。

f．　国際事務局は、受理官庁から記録原本を受領した場合には、出願人にその旨を速やかに通知（様式PCT／IB／301）する。記録原本を優先日から14箇月が満了しても受領していないときは、国際事務局は出願人にその旨を通知する。〔PCT規則22．1（c）〕

名称及びあて名	権限のある職員
日本国特許庁（RO／JP） 郵便番号　100-8915 TEL03－3592－1308 日本国東京都千代田区霞が関三丁目４番３号	特許庁長官

様式PCT／RO／105（1998年7月）

特許協力条約

RECEIVED
02.2.25
K&Y

発信人　日本国特許庁（国際調査機関）

出願人代理人

小林　雅人

殿

あて名

〒162－0825

東京都新宿区神楽坂４丁目３番地　煉瓦塔ビル５階　小林・吉村特許事務所

PCT／JP02／01015　　SA202

PCT

調査用写しの受理通知書

（法施行規則第３９条）
〔PCT規則２５．１〕

	発送日（日．月．年） 19．02．02	
出願人又は代理人 の書類記号　02－PCT－01	重　要　な　通　知	
国際出願番号 PCT／JP02／01015	国際出願日（日．月．年） 07．02．02	優先日（日．月．年） 08．02．01
出願人（氏名又は名称） クミアイ化学工業株式会社		

１．国際調査機関と受理官庁が同一の機関でない場合、

国際出願の調査用写しを国際調査機関が下記の日に受理したので通知する。

国際調査機関と受理官庁が同一の機関である場合、

国際出願の調査用写しを下記の日に受理したので通知する。

19 日 02 月 02 年（受理の日）

２．☐　調査用写しには、コンピューター読取りが可能な形式によるヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が添付されている。

３．国際調査報告の作成期間
国際調査報告の作成期間は、上記受理の日から３箇月の期間又は優先日から９箇月の期間のいずれか遅く満了する期間である。

４．この通知書の写しは、国際事務局及び上記１の第１文が適用される場合には受理官庁に送付した。

名称及びあて名 日　本　国　特　許　庁　（ISA／JP） 郵便番号　100-8915 TEL０３－３５９２－１３０８ 日本国東京都千代田区霞が関三丁目４番３号	権限のある職員 特　許　庁　長　官

様式PCT／ISA／202（1998年7月）

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2002 年8 月15 日 (15.08.2002)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 02/062770 A1

(51) 国際特許分類[7]: C07D 261/10, 261/12, 413/12, 498/04, 513/04, 413/14, 417/12, 261/20, 487/04, A01N 43/80

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/01015

(22) 国際出願日: 2002 年2 月7 日 (07.02.2002)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2001-031784 2001 年2 月8 日 (08.02.2001) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): クミアイ化学工業株式会社 (KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.) [JP/JP]; 〒110-0008 東京都 台東区 池之端１丁目４番２６号 Tokyo (JP). イハラケミカル工業株式会社 (IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.) [JP/JP]; 〒110-0008 東京都 台東区 池之端１丁目４番２６号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 中谷 昌央 (NAKATANI,Masao) [JP/JP]; 〒437-1213 静岡県 磐田郡 福田町塩新田４０８番地の１ 株式会社ケイ・アイ研究所内 Shizuoka (JP). 久語 良太郎 (KUGO,Ryotaro) [JP/JP]; 〒590-0531 大阪府 泉南市 岡田５丁目２７番２３号 Osaka (JP). 宮崎 雅弘 (MMIYAZAKI,Masahiro) [JP/JP]; 〒437-1213 静岡県 磐田郡 福田町塩新田４０８番地の１ 株式会社ケイ・アイ研究所内 Shizuoka (JP). 角 康一郎 (KAKU,Koichiro) [JP/JP]; 〒437-1207 静岡県 磐田郡 福田町蛭池２７６番地の１ Shizuoka (JP). 藤波 周 (FUJINAMI,Makoto) [JP/JP]; 〒439-0031 静岡県 小笠郡 菊川町加茂１８０９番地 Shizuoka (JP). 上野 良平 (UENO,Ryohei) [JP/JP]; 〒439-0031 静岡県 小笠郡 菊川町加茂１８０９番地 Shizuoka (JP). 高橋 智 (TAKAHASHI,Satoru) [JP/JP]; 〒420-0046 静岡県 静岡市 吉野町５番地の１８ Shizuoka (JP).

(74) 代理人: 小林 雅人 (KOBAYASHI,Masato); 〒162-0825 東京都 新宿区 神楽坂４丁目３番地 煉瓦塔ビル５階 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

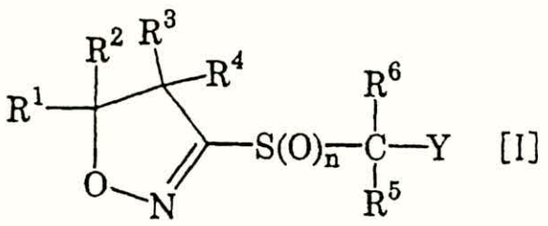
(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

２文字コード及び他の略語については、定期発行される各*PCT*ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: ISOXAZOLINE DERIVATIVE AND HERBICIDE COMPRISING THE SAME AS ACTIVE INGREDIENT

(54) 発明の名称: イソオキサゾリン誘導体及びこれを有効成分とする除草剤



[I]

(57) Abstract: An isoxazoline derivative which is represented by the general formula: [I] wherein R^1 and R^2 represent an alkyl group and may be the same or different, R^3, R^4, R^5 and R^6 represent a hydrogen atom, Y represents an aromatic heterocyclic group or aromatic condensed heterocyclic group which has a heteroatom selected from among a nitrogen atom, an oxygen atom and a sulfur atom, has five or six members, and may be substituted, and n represents an integer of 0 to 2. The isoxazoline derivative exhibits excellent herbicidal effect and selectivity between a crop and a weed.

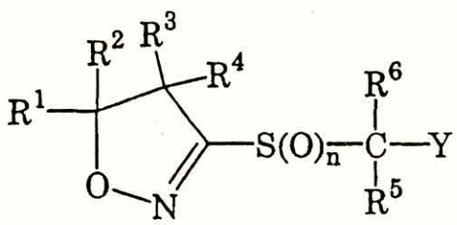
[続葉有]

WO 02/062770 A1

(57) 要約:

本発明は、優れた除草効果と作物・雑草間の選択性を有するイソオキサゾリン誘導体を提供することを課題とする。

本発明のイソオキサゾリン誘導体は、一般式



[I]

[式中、

R^1及びR^2は、同一又は異なって、アルキル基を示し、

R^3, R^4, R^5, R^6は、水素原子を示し、

Yは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子より選択される任意のヘテロ原子を有する5～6員の置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基又は芳香族ヘテロ縮合環基を示し、

nは0～2の整数を示す。]

で表される。

16

特　許　協　力　条　約

発信人　日本国特許庁（国際調査機関）

出願人代理人

小林　雅人

殿

あて名

〒１６２－０８２５

東京都新宿区神楽坂４丁目３番地
煉瓦塔ビル５階　小林・吉村特許事務所

PCT

国際調査報告又は国際調査報告を作成しない旨の決定の送付の通知書

（法施行規則第４１条）
〔ＰＣＴ規則44.1〕

発送日 （日.月.年）	03.04.02
出願人又は代理人 の書類記号　　０２－ＰＣＴ－０１	今後の手続きについては、下記１及び４を参照。
国際出願番号 ＰＣＴ／ＪＰ０２／０１０１５	国際出願日 （日.月.年）　　０７．０２．０２
出願人（氏名又は名称） クミアイ化学工業株式会社	

1．[X] 国際調査報告が作成されたこと、及びこの送付書とともに送付することを、出願人に通知する。
ＰＣＴ１９条の規定に基づく補正書及び説明書の提出
出願人は、国際出願の請求の範囲を補正することができる（ＰＣＴ規則４６参照）。
いつ　補正書の提出期間は、通常国際調査報告の送付の日から２月である。
詳細については添付用紙の備考を参照すること。
どこへ　直接次の場所へ
The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland
Facsimile No.: (41-22)740.14.35
詳細な手続については、添付用紙の備考を参照すること。

2．[ ] 国際調査報告が作成されないこと、及び法第８条第２項（ＰＣＴ１７条(2)(a)）の規定による国際調査報告を作成しない旨の決定をこの送付書とともに送付することを、出願人に通知する。

3．[ ] 法施行規則第４４条（ＰＣＴ規則40.2）に規定する追加手数料の納付に対する異議の申立てに関して、出願人に下記の点を通知する。
[ ] 異議の申立てと当該異議についての決定を、その異議の申し立てと当該異議についての決定の両方を指定官庁へ送付することを求める出願人の請求とともに、国際事務局へ送付した。
[ ] 当該異議についての決定は、まだ行われていない。決定されしだい出願人に通知する。

4．今後の手続：　出願人は次の点に注意すること。
優先日から１８月経過後、国際出願は国際事務局によりすみやかに国際公開される。出願人が公開の延期を望むときは、国際出願又は優先権の主張の取下げの通知がＰＣＴ規則90の2.1及び90の2.3にそれぞれ規定されているように、国際公開の事務的な準備が完了する前に国際事務局に到達しなければならない。
出願人が優先日から３０月まで（官庁によってはもっと遅く）国内段階の開始を延期することを望むときは、優先日から１９月以内に、国際予備審査の請求書が提出されなければならない。
国際予備審査の請求書若しくは、後にする選択により優先日から１９箇月以内に選択しなかった又は第Ⅱ章に拘束されないため選択できなかったすべての指定官庁に対しては優先日から２０月以内に、国内段階の開始のための所定手続を取らなければならない。

名称及びあて名 日本国特許庁（ＩＳＡ／ＪＰ） 郵便番号１００－８９１５ 東京都千代田区霞が関三丁目４番３号	権限のある職員　４Ｃ　３１２７ 特　許　庁　長　官 電話番号　０３－３５８１－１１０１　内線　３４５０

様式ＰＣＴ／ＩＳＡ／２２０（１９９８年７月）　　（添付用紙を参照）

17

注　　意

1．国際調査報告の発送日から起算する条約第１９条（１）及び規則４６．１に従う国際事務局への補正期間に注意してください。

2．条約２２条（２）に規定する期間に注意してください。

3．文献の写しの請求について

国際調査報告に記載した文献の複写

特許庁にこれらの引用文献の写しを請求することもできますが、独立行政法人工業所有権総合情報館（特許庁庁舎２階）で公報類の閲覧・複写および公報以外の文献複写等の取り扱いをしています。

〔担当及び照会先〕

〒１００－００１３　東京都千代田区霞が関３丁目４番３号（特許庁庁舎２階）
独立行政法人工業所有権総合情報館
【公 報 類】　閲覧部　ＴＥＬ　03－3581－1101　内線3811～2
【公報以外】　資料部　ＴＥＬ　03―3581―1101　内線3831～3

また、（財）日本特許情報機構でも取り扱いをしています。
これらの引用文献の複写を請求する場合は下記の点に注意してください。

〔申込方法〕

（１）特許（実用新案・意匠）公報については、下記の点を明記してください。
○特許・実用新案及び意匠の種類
○出願公告又は出願公開の年次及び番号（又は特許番号、登録番号）
○必要部数

（２）公報以外の文献の場合は、下記の点に注意してください。
○国際調査報告の写しを添付してください（返却します）。

〔申込み及び照会先〕

〒１３５－００１６　東京都江東区東陽４－１－７　佐藤ビル
財団法人　日本特許情報機構　情報処理部業務課
ＴＥＬ　０３－３５０８－２３１３

注意　特許庁に対して文献の写しの請求をすることができる期間は、国際出願日から７年です。

様式ＰＣＴ／ＩＳＡ／２２０の備考

この備考は、ＰＣＴ１９条の規定に基づく補正書の提出に関する基本的な指示を与えるためのものである。この備考は特許協力条約並びにこの条約に基づく規則及び実施細則の規定に基づいている。この備考とそれらの規定とが相違する場合には、後者が適用される。詳細な情報については、ＷＩＰＯの出版物であるＰＣＴ出願人の手引も参照すること。

ＰＣＴ１９条の規定に基づく補正書の提出に関する指示

出願人は、国際調査報告を受領した後、国際出願の請求の範囲を補正する機会が一回ある。しかし、国際出願のすべての部分（請求の範囲、明細書及び図面）が、国際予備審査の手続においても補正できるもので、例えば出願人が仮保護のために補正書を公開することを希望する場合又は国際公開前に請求の範囲を補正する別の理由がある場合を除き、通常ＰＣＴ１９条の規定に基づく補正書を提出する必要はないことを強調しておく。さらに、仮保護は一部の国のみで与えられるだけであることも強調しておく。

補正の対象となるもの

ＰＣＴ１９条の規定により請求の範囲のみ補正することができる。
国際段階においてＰＣＴ３４条の規定に基づく国際予備審査の手続きにおいて請求の範囲を（更に）補正することができる。
明細書及び図面は、ＰＣＴ３４条の規定に基づく国際予備審査の手続においてのみ補正することができる。
国内段階に移行する際、ＰＣＴ２８条（又はＰＣＴ４１条）の規定により、国際出願のすべての部分を補正することができる。

いつ

国際調査報告の送付の日から２月又は優先日から１６月の内どちらか遅く満了するほうの期間内。しかし、その期間の満了後であっても国際公開の技術的な準備の完了前に国際事務局が補正を受領した場合には、その補正書は、期間内に受理されたものとみなすことを強調しておく（ＰＣＴ規則46.1）。

補正書を提出すべきところ

補正書は、国際事務局のみに提出でき、受理官庁又は国際調査機関には提出してはいけない（ＰＣＴ規則46.2）。
国際予備審査の請求書を提出した／する場合については、以下を参照すること。

どのように

１以上の請求の範囲の削除、１以上の新たな請求の範囲の追加、又は１以上の請求の範囲の記載の補正による。
差替え用紙は、補正の結果、出願当初の用紙と相違する請求の範囲の各用紙毎に提出する。
差替え用紙に記載されているすべての請求の範囲には、アラビア数字を付さなければならない。請求の範囲を削除する場合、その他の請求の範囲の番号を付け直す必要はない。請求の範囲の番号を付け直す場合には、連続番号で付け直さなければならない（ＰＣＴ実施細則第205号(b)）。
補正は国際公開の言語で行う。

補正書にどのような書類を添付しなければならないか

書簡（ＰＣＴ実施細則第205号(b)）

補正書には書簡を添付しなければならない。
書簡は国際出願及び補正された請求の範囲とともに公開されることはない。これを「ＰＣＴ１９条(1)に規定する説明書」と混同してはならない（「ＰＣＴ１９条(1)に規定する説明書」については、以下を参照）。
書簡は、英語又は仏語を選択しなければならない。ただし、国際出願の言語が英語の場合、書簡は英語で、仏語の場合、書簡は仏語で記載しなければならない。
書簡には、出願時の請求の範囲と補正された請求の範囲との相違について表示しなければならない。特に、国際出願に記載した各請求の範囲との関連で次の表示（２以上の請求の範囲についての同一の表示する場合は、まとめることができる。）をしなければならない。
(i) この請求の範囲は変更しない。
(ii) この請求の範囲は削除する。
(iii) この請求の範囲は追加である。
(iv) この請求の範囲は出願時の１以上の請求の範囲と差し替える。
(v) この請求の範囲は出願時の請求の範囲の分割の結果である。

様式ＰＣＴ／ＩＳＡ／２２０の備考（続き）

次に、添付する書簡中での、補正についての説明の例を示す。

１．［請求の範囲の一部の補正によって請求の範囲の項数が４８から５１になった場合］：
“請求の範囲１－２９、３１、３２、３４、３５、３７－４８項は、同じ番号のもとに補正された請求の範囲と置き換えられた。請求の範囲３０、３３及び３６項は変更なし。新たに請求の範囲４９－５１項が追加された。”
２．［請求の範囲の全部の補正によって請求の範囲の項数が１５から１１になった場合］：
“請求の範囲１－１５項は、補正された請求の範囲１－１１項に置き換えられた。”
３．［原請求の範囲の項数が１４で、補正が一部の請求の範囲の削除と新たな請求の範囲の追加を含む場合］：
“請求の範囲１－６及び１４項は変更なし。請求の範囲７－１３は削除。新たに請求の範囲１５、１６及び１７項を追加。”又は
“請求の範囲７－１３は削除。新たに請求の範囲１５、１６及び１７項を追加。その他の全ての請求の範囲は変更なし。”
４．［各種の補正がある場合］：
“請求の範囲１－１０項は変更なし。請求の範囲１１－１３、１８及び１９項は削除。請求の範囲１４、１５及び１６項は補正された請求の範囲１４項に置き換えられた。請求の範囲１７項は補正された請求の範囲１５、１６及び１７項に分割された。新たに請求の範囲２０及び２１項が追加された。”

“ＰＣＴ１９条(1)の規定に基づく説明書”（ＰＣＴ規則46.4）

補正書には、補正並びにその補正が明細書及び図面に与える影響についての説明書を提出することができる（明細書及び図面はＰＣＴ１９条(1)の規定に基づいては補正できない）。

説明書は、国際出願及び補正された請求の範囲とともに公開される。

説明書は、国際公開の言語で作成しなければならない。

説明書は、簡潔でなければならず、英語の場合又は英語に翻訳した場合に５００語を越えてはならない。

説明書は、出願時の請求の範囲と補正された請求の範囲との相違を示す書簡と混同してはならない。説明書を、その書簡に代えることはできない。説明書は別紙で提出しなければならず、見出しを付すものとし、その見出しは“ＰＣＴ１９条(1)の規定に基づく説明書”の語句を用いることが望ましい。

説明書には、国際調査報告又は国際調査報告に列記された文献との関連性に関して、これらを誹謗する意見を記載してはならない。国際調査報告に列記された特定の請求の範囲に関連する文献についての言及は、当該請求の範囲の補正に関してのみ行うことができる。

国際予備審査の請求書が提出されている場合

ＰＣＴ１９条の規定に基づく補正書及び添付する説明書の提出の時に国際予備審査の請求書が既に提出されている場合には、出願人は、補正書（及び説明書）を国際事務局に提出すると同時にその写し及び必要な場合、その翻訳文を国際予備審査機関にも提出することが望ましい（ＰＣＴ規則55.3(a)、62.2の第１文を参照）。詳細は国際予備審査請求書（ＰＣＴ／ＩＰＥＡ／４０１）の注意書参照。

国内段階に移行するための国際出願の翻訳に関して

国内段階に移行する際、ＰＣＴ１９条の規定に基づいて補正された請求の範囲の翻訳を出願時の請求の範囲の翻訳の代わりに又は追加して、指定官庁／選択官庁に提出しなければならないこともあるので、出願人は注意されたい。

指定官庁／選択官庁の詳細な要求については、ＰＣＴ出願人の手引きの第Ⅱ巻を参照。

特　許　協　力　条　約

PCT

国際調査報告

（法８条、法施行規則第40、41条）
〔ＰＣＴ１８条、ＰＣＴ規則43、44〕

出願人又は代理人 の書類記号　０２－ＰＣＴ－０１	今後の手続きについては、国際調査報告の送付通知様式（ＰＣＴ／ＩＳＡ／２２０）及び下記５を参照すること。	
国際出願番号 ＰＣＴ／ＪＰ０２／０１０１５	国際出願日 （日.月.年）　０７．０２．０２	優先日 （日.月.年）　０８．０２．０１
出願人（氏名又は名称） クミアイ化学工業株式会社		

国際調査機関が作成したこの国際調査報告を法施行規則第41条（ＰＣＴ１８条）の規定に従い出願人に送付する。
この写しは国際事務局にも送付される。

この国際調査報告は、全部で　3　ページである。

☐ この調査報告に引用された先行技術文献の写しも添付されている。

１．国際調査報告の基礎

ａ．言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願がされたものに基づき国際調査を行った。
☐ この国際調査機関に提出された国際出願の翻訳文に基づき国際調査を行った。

ｂ．この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際調査を行った。
☐ この国際出願に含まれる書面による配列表
☐ この国際出願と共に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に、この国際調査機関に提出された書面による配列表
☐ 出願後に、この国際調査機関に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった。
☐ 書面による配列表に記載した配列と磁気ディスクによる配列表に記録した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

２．☐ 請求の範囲の一部の調査ができない（第Ⅰ欄参照）。

３．☐ 発明の単一性が欠如している（第Ⅱ欄参照）。

４．発明の名称は
☒ 出願人が提出したものを承認する。
☐ 次に示すように国際調査機関が作成した。

５．要約は
☒ 出願人が提出したものを承認する。
☐ 第Ⅲ欄に示されているように、法施行規則第47条（ＰＣＴ規則38.2(b)）の規定により国際調査機関が作成した。出願人は、この国際調査報告の発送の日から１カ月以内にこの国際調査機関に意見を提出することができる。

６．要約書とともに公表される図は、
第 _____ 図とする。☐ 出願人が示したとおりである。　☒ なし
☐ 出願人は図を示さなかった。
☐ 本図は発明の特徴を一層よく表している。

国際調査報告

国際出願番号　PCT／JP02／01015

A.　発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC））
Int. Cl⁷ C07D261／10, 261／12, 413／12, 498／04, 513／04, 413／14, 417／12, 261／20, 487／04, A01N43／80

B.　調査を行った分野

調査を行った最小限資料（国際特許分類（IPC））
Int. Cl⁷ C07D261／10, 261／12, 413／12, 498／04, 513／04, 413／14, 417／12, 261／20, 487／04, A01N43／80

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの
日本国実用新案公報　1992－1996年
日本国公開実用新案公報　1971－2002年
日本国実用新案登録公報　1996－2002年
日本国登録実用新案公報　1994－2002年

国際調査で使用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語）
CAS（STN），REGISTRY（STN）

C.　関連すると認められる文献

引用文献のカテゴリー＊	引用文献名　及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する請求の範囲の番号
Y	JP　9－328483　A（三共株式会社） 1997．12．22，【特許請求の範囲】（ファミリーなし）	1－8 11，13 15－18
A		9，10 12，14

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。　☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

＊　引用文献のカテゴリー
「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）
「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献
「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日	国際調査報告の発送日
09．04．02	23.04.02

国際調査機関の名称及びあて先	特許庁審査官（権限のある職員）		
日本国特許庁（ISA／JP） 郵便番号100－8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	荒木　英則	4C	3127
	電話番号　03－3581－1101　内線　3450		

様式PCT／ISA／210（第2ページ）（1998年7月）

国際調査報告	国際出願番号　PCT／JP02／01015

C（続き）．　関連すると認められる文献

引用文献のカテゴリー＊	引用文献名　及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する請求の範囲の番号
Y	WO 00／50410 A1 (NIPPON SODA CO) 2000. 08. 31, 全文, & AU 200026912 A & JP 2000－297080 A	1－3 5－8 11, 13 15－18
Y	WO 99／23094 A1 (NIPPON SODA CO) 1999. 05. 14, 全文, & EP 1031573 A1 & BR 9814832 A & AU 9896505 A & US 6147031 A & CN 1278259 A & JP 11－240872 A	1－8 11, 13 15－18

23

PATENT COOPERATION TREATY

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

NOTIFICATION OF RECEIPT OF RECORD COPY

(PCT Rule 24.2(a))

To:

KOBAYASHI, Masato
5th Floor, Renga-toh Building
3, Kagurazaka 4-chome
Shinjuku-ku, Tokyo 162-0825
JAPON

Date of mailing (day/month/year)	IMPORTANT NOTIFICATION
26 March 2002 (26.03.02)	
Applicant's or agent's file reference	**International application No.**
02-PCT-01	PCT/JP02/01015

The applicant is hereby notified that the International Bureau has received the record copy of the international application as detailed below.

Name(s) of the applicant(s) and State(s) for which they are applicants:

KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD. et al (for all designated States except US)
NAKATANI, Masao et al (for US)

International filing date	:	07 February 2002 (07.02.02)
Priority date(s) claimed	:	08 February 2001 (08.02.01)
Date of receipt of the record copy by the International Bureau	:	25 February 2002 (25.02.02)
List of designated Offices	:	

AP :GH,GM,KE,LS,MW,MZ,SD,SL,SZ,TZ,UG,ZM,ZW
EA :AM,AZ,BY,KG,KZ,MD,RU,TJ,TM
EP :AT,BE,CH,CY,DE,DK,ES,FI,FR,GB,GR,IE,IT,LU,MC,NL,PT,SE,TR
OA :BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,ML,MR,NE,SN,TD,TG
National :AE,AG,AL,AM,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BR,BY,BZ,CA,CH,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DK,DM,DZ,
EC,EE,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,HR,HU,ID,IL,IN,IS,KE,KG,KP,KR,KZ,LC,LK,LR,LS,LT,LU,LV,
MA,MD,MG,MK,MN,MW,MX,MZ,NO,NZ,OM,PH,PL,PT,RO,RU,SD,SE,SG,SI,SK,SL,TJ,TM,TN,TR,TT,
TZ,UA,UG,US,UZ,VN,YU,ZA,ZM,ZW

ATTENTION

The applicant should carefully check the data appearing in this Notification. In case of any discrepancy between these data and the indications in the international application, the applicant should immediately inform the International Bureau.

In addition, the applicant's attention is drawn to the information contained in the Annex, relating to:

- [X] time limits for entry into the national phase
- [X] confirmation of precautionary designations
- [X] requirements regarding priority documents

A copy of this Notification is being sent to the receiving Office and to the International Searching Authority.

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Facsimile No. (41-22) 740.14.35

Authorized officer:

Junko TAKEUCHI

Telephone No. (41-22) 338.83.38

ANNEX TO FORM PCT/IB/301

International application No.
PCT/JP02/01015 24

INFORMATION ON TIME LIMITS FOR ENTERING THE NATIONAL PHASE

The applicant is reminded that the "national phase" must be entered before each of the designated Offices indicated in the Notification of Receipt of Record Copy (Form PCT/IB/301) by paying national fees and furnishing translations, as prescribed by the applicable national laws.

The time limit for performing these procedural acts is **20 MONTHS** from the priority date or, for those designated States which the applicant elects in a demand for international preliminary examination or in a later election, **30 MONTHS** from the priority date, provided that the election is made before the expiration of 19 months from the priority date. Some designated (or elected) Offices have fixed time limits which expire even later than 20 or 30 months from the priority date. In other Offices an extension of time or grace period, in some cases upon payment of an additional fee, is available.

In addition to these procedural acts, the applicant may also have to comply with other special requirements applicable in certain Offices. **It is the applicant's responsibility** to ensure that the necessary steps to enter the national phase are taken in a timely fashion. Most designated Offices do not issue reminders to applicants in connection with the entry into the national phase.

For detailed information about the procedural acts to be performed to enter the national phase before each designated Office, the applicable time limits and possible extensions of time or grace periods, and any other requirements, see the relevant Chapters of Volume II of the PCT Applicant's Guide. Information about the requirements for filing a demand for international preliminary examination is set out in Chapter IX of Volume I of the PCT Applicant's Guide.

GR and ES became bound by PCT Chapter II on 7 September 1996 and 6 September 1997, respectively, and may, therefore, be elected in a demand or a later election filed on or after 7 September 1996 and 6 September 1997, respectively, regardless of the filing date of the international application. (See second paragraph above.)

Note that only an applicant who is a national or resident of a PCT Contracting State which is bound by Chapter II has the right to file a demand for international preliminary examination.

CONFIRMATION OF PRECAUTIONARY DESIGNATIONS

This notification lists only specific designations made under Rule 4.9(a) in the request. It is important to check that these designations are correct. Errors in designations can be corrected where precautionary designations have been made under Rule 4.9(b). The applicant is hereby reminded that any precautionary designations may be confirmed according to Rule 4.9(c) before the expiration of 15 months from the priority date. If it is not confirmed, it will automatically be regarded as withdrawn by the applicant. There will be no reminder and no invitation. Confirmation of a designation consists of the filing of a notice specifying the designated State concerned (with an indication of the kind of protection or treatment desired) and the payment of the designation and confirmation fees. Confirmation must reach the receiving Office within the 15-month time limit.

REQUIREMENTS REGARDING PRIORITY DOCUMENTS

For applicants who have not yet complied with the requirements regarding priority documents, the following is recalled.

Where the priority of an earlier national, regional or international application is claimed, the applicant must submit a copy of the said earlier application, certified by the authority with which it was filed ("the priority document") to the receiving Office (which will transmit it to the International Bureau) or directly to the International Bureau, before the expiration of 16 months from the priority date, provided that any such priority document may still be submitted to the International Bureau before that date of international publication of the international application, in which case that document will be considered to have been received by the International Bureau on the last day of the 16-month time limit (Rule 17.1(a)).

Where the priority document is issued by the receiving Office, the applicant may, instead of submitting the priority document, request the receiving Office to prepare and transmit the priority document to the International Bureau. Such request must be made before the expiration of the 16-month time limit and may be subjected by the receiving Office to the payment of a fee (Rule 17.1(b)).

If the priority document concerned is not submitted to the International Bureau or if the request to the receiving Office to prepare and transmit the priority document has not been made (and the corresponding fee, if any, paid) within the applicable time limit indicated under the preceding paragraphs, any designated State may disregard the priority claim, provided that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.

Where several priorities are claimed, the priority date to be considered for the purposes of computing the 16-month time limit is the filing date of the earliest application whose priority is claimed.

PATENT COOPERATION TREATY

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

To:

KOBAYASHI, Masato
5th Floor, Renga-toh Building
3, Kagurazaka 4-chome
Shinjuku-ku, Tokyo 162-0825
JAPON

NOTIFICATION CONCERNING SUBMISSION OR TRANSMITTAL OF PRIORITY DOCUMENT

(PCT Administrative Instructions, Section 411)

Date of mailing (day/month/year) 22 April 2002 (22.04.02)	
Applicant's or agent's file reference 02-PCT-01	IMPORTANT NOTIFICATION
International application No. PCT/JP02/01015	International filing date (day/month/year) 07 February 2002 (07.02.02)
International publication date (day/month/year) Not yet published	Priority date (day/month/year) 08 February 2001 (08.02.01)
Applicant KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD. et al	

1. The applicant is hereby notified of the date of receipt (except where the letters "NR" appear in the right-hand column) by the International Bureau of the priority document(s) relating to the earlier application(s) indicated below. Unless otherwise indicated by an asterisk appearing next to a date of receipt, or by the letters "NR", in the right-hand column, the priority document concerned was submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b).

2. This updates and replaces any previously issued notification concerning submission or transmittal of priority documents.

3. An **asterisk**(*) appearing next to a date of receipt, in the right-hand column, denotes a priority document submitted or transmitted to the International Bureau but not in compliance with Rule 17.1(a) or (b). In such a case, **the attention of the applicant is directed** to Rule 17.1(c) which provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.

4. The **letters "NR"** appearing in the right-hand column denote a priority document which was not received by the International Bureau or which the applicant did not request the receiving Office to prepare and transmit to the International Bureau, as provided by Rule 17.1(a) or (b), respectively. In such a case, **the attention of the applicant is directed** to Rule 17.1(c) which provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.

Priority date	Priority application No.	Country or regional Office or PCT receiving Office	Date of receipt of priority document
08 Febr 2001 (08.02.01)	2001-031784	JP	12 Apri 2002 (12.04.02)

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Facsimile No. (41-22) 740.14.35

Authorized officer

Magda BOUACHA

Telephone No. (41-22) 338.83.38

26

~~26~~

予備審査請求は管轄国際予備審査機関へ直接行わなければならない。2以上の管轄機関がある場合には、出願人の選択による。

IPEA／＿＿＿＿＿＿＿＿

特許協力条約に基づく国際出願
国際予備審査請求書

第 II 章

出願人は、次の国際出願が特許協力条約に従って国際予備審査の対象とされることを請求し、選択資格のある全ての国を選択する。ただし、特段の表示がある場合を除く。

PCT
23.5.02
受領印

国際予備審査機関記入欄

国際予備審査機関の確認	請求書の受理の日

第 I 欄　国際出願の表示		出願人又は代理人の書類記号 02-PCT-01
国際出願番号 PCT/JP02/01015	国際出願日（日．月．年） 07.02.02	優先日（最先のもの）（日．月．年） 08.02.01

発明の名称
イソオキサゾリン誘導体及びこれを有効成分とする除草剤

第 II 欄　出願人

氏名（名称）及びあて名：（姓、名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）

クミアイ化学工業株式会社
KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.
〒110-0008　日本国東京都台東区池之端１丁目４番２６号
4-26, Ikenohata 1-chome, Taito-ku, Tokyo 110-0008 Japan

電話番号：03-3822-5177
ファクシミリ番号：
加入電信番号：
出願人登録番号：

国籍（国名）：日本国　JAPAN　　住所（国名）：日本国　JAPAN

氏名（名称）及びあて名：（姓、名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）

イハラケミカル工業株式会社
IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.
〒110-0008　日本国東京都台東区池之端１丁目４番２６号
4-26, Ikenohata 1-chome, Taito-ku, Tokyo 110-0008 Japan

国籍（国名）：日本国　JAPAN　　住所（国名）：日本国　JAPAN

氏名（名称）及びあて名：（姓、名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）

中　谷　　昌　央　　NAKATANI Masao
〒４３７－１２１３　日本国静岡県磐田郡福田町塩新田４０８番地の１
株式会社ケイ・アイ研究所内
c/o K・I CHEMICAL RESEARCH INSTITUTE CO., LTD.
408-1, Shioshinden, Fukude-cho, Iwata-gun,Shizuoka 437-1213 Japan

国籍（国名）：日本国　JAPAN　　住所（国名）：日本国　JAPAN

☑ その他の出願人が続葉に記載されている。

様式ＰＣＴ／ＩＰＥＡ／４０１（第１用紙）（２００１年３月版）

国際出願番号
PCT/JP02/01015

第II欄の続き　出願人

この第II欄の続きを使用しないときは、この用紙を国際予備審査請求書に含めないこと。

氏名（名称）及びあて名：（姓、名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）

久　語　　良太郎　　KUGO Ryotaro
〒５９０－０５３１　日本国大阪府泉南市岡田５丁目２７番２３号
5-27-23, Okada, Sen-nan-shi, Osaka 590-0531 Japan

国籍（国名）：日本国　JAPAN	住所（国名）：日本国　JAPAN

氏名（名称）及びあて名：（姓、名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）

宮　崎　　雅　弘　　MIYAZAKI Masahiro
〒４３７－１２１３　日本国静岡県磐田郡福田町塩新田４０８番地の１
株式会社ケイ・アイ研究所内
c/o K・I CHEMICAL RESEARCH INSTITUTE CO., LTD.
408-1, Shioshinden, Fukude-cho, Iwata-gun, Shizuoka 437-1213 Japan

国籍（国名）：日本国　JAPAN	住所（国名）：日本国　JAPAN

氏名（名称）及びあて名：（姓、名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）

角　　康一郎　　KAKU Koichiro
〒４３７－１２０７　日本国静岡県磐田郡福田町蛭池２７６番地の１
276-1, Hiruike, Fukude-cho, Iwata-gun, Shizuoka 437-1207 Japan

国籍（国名）：日本国　JAPAN	住所（国名）：日本国　JAPAN

氏名（名称）及びあて名：（姓、名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）

藤　波　　周　　FUJINAMI Makoto
〒４３９－００３１　日本国静岡県小笠郡菊川町加茂１８０９番地
1809, Kamo, Kikugawa-cho, Ogasa-gun, Shizuoka 439-0031 Japan

国籍（国名）：日本国　JAPAN	住所（国名）：日本国　JAPAN

☑ その他の出願人が他の続葉に記載されている。

国際出願番号
PCT/JP02/01015

第II欄の続き　出願人

この第II欄の続きを使用しないときは、この用紙を国際予備審査請求書に含めないこと。

氏名（名称）及びあて名：（姓、名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）

上　野　　良　平　　UENO Ryohei
〒４３９－００３１　日本国静岡県小笠郡菊川町加茂１８０９番地
1809, Kamo, Kikugawa-cho, Ogasa-gun, Shizuoka 439-0031 Japan

国籍（国名）：日本国　JAPAN	住所（国名）：日本国　JAPAN

氏名（名称）及びあて名：（姓、名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）

高　橋　　智　　TAKAHASHI Satoru
〒４２０－００４６　日本国静岡県静岡市吉野町５番地の１８
5-18, Yoshino-cho, Shizuoka-shi, Shizuoka 420-0046 Japan
日本国　JAPAN　　日本国　JAPAN

国籍（国名）：日本国　JAPAN	住所（国名）：日本国　JAPAN

氏名（名称）及びあて名：（姓、名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）

国籍（国名）：	住所（国名）：

氏名（名称）及びあて名：（姓、名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）

国籍（国名）：	住所（国名）：

☐ その他の出願人が他の続葉に記載されている。

国際出願番号
PCT/JP02/01015

第III欄　代理人又は非通の代表者、通知のあて名

下記に記載された者は、☑ 代理人　又は　☐ 非通の代表者　として

☑ 既に選任された者であって、国際予備審査についても出願人を代理する者である。
☐ 今回新たに選任された者である。先に選任されていた代理人又は非通の代表者は解任された。
☐ 既に選任された代理人又は非通の代表者に加えて、特に国際予備審査機関に対する手続きのために、今回新たに選任された者である。

氏名（名称）及びあて名：（姓、名の順に記載；法人は公式の完全な名称を記載；あて名は郵便番号及び国名も記載）

9124　弁理士　小　林　　雅　人　KOBAYASHI Masato
〒162－0825　日本国東京都新宿区神楽坂４丁目３番地
煉瓦塔ビル５階
5th Floor, Renga-toh Building, 3, Kagurazaka 4-chome,
Shinjuku-ku, Tokyo 162-0825 Japan

電話番号：
03-3266-0655

ファクシミリ番号：
03-3266-0675

加入電信番号：

出願人登録番号：

☐ 通知のためのあて名：
代理人又は非通の代表者が選任されておらず、上記枠内に特に通知が送付されるあて名を記載している場合は、レ印を付す。

第IV欄　国際予備審査に対する基本事項

補正に関する記述：*

1. 出願人は、次のものを基礎として国際予備審査を開始することを希望する。
   ☑ 出願時の国際出願を基礎とすること。
   ☐ 明細書に関して
      ☐ 出願時のものを基礎とすること。
      ☐ 特許協力条約第３４条の規定に基づいてなされた補正を基礎とすること。
   ☐ 請求の範囲に関して
      ☐ 出願時のものを基礎とすること。
      ☐ 特許協力条約第１９条の規定に基づいてなされた補正（添付した説明書も含む）を基礎とすること。
      ☐ 特許協力条約第３４条の規定に基づいてなされた補正を基礎とすること。
   ☐ 図面に関して
      ☐ 出願時のものを基礎とすること。
      ☐ 特許協力条約第３４条の規定に基づいてなされた補正を基礎とすること。
2. ☐ 出願人は、特許協力条約第１９条の規定に基づく請求の範囲について行った補正を無視し、かつ、取り消されたものとみなして開始することを希望する。
3. ☐ 出願人は、国際予備審査の開始を優先日から２０月の期間が満了するまで延期することを希望する（ただし、国際予備審査機関が、特許協力条約第１９条の規定に基づき行われた補正書の写しの受領、又は当該補正を希望しない旨の出願人からの通知を受領した場合を除く（規則69.1(d)）。）
   （この口は、特許協力条約第１９条の規定に基づく期間が満了していない場合にのみ、レ印を付すことができる。）。

＊記入がない場合は、1)補正がないか又は国際予備審査機関が補正（原本又は写し）を受領していないときは、出願時の国際出願を基礎に予備審査が開始され、2)国際予備審査機関が、見解書又は予備審査報告書の作成開始前に補正（原本又は写し）を受領したときは、これらの補正を考慮して予備審査が開始又は続行される。

国際予備審査を行うための言語は 日本語 であり、

☑ 国際出願の提出時の言語である。
☐ 国際調査のために提出した翻訳文の言語である。
☐ 国際出願の公開の言語である。
☐ 国際予備審査の目的のために提出した翻訳文の言語である。

第V欄　国の選択

出願人は、選択資格のある全ての指定国（即ち、既に出願人によって指定されており、かつ特許協力条約第II章に拘束されている国）を選択する。
ただし、出願人は次の国の選択を希望しない。：

国際出願番号
PCT/JP02/01015

第VI欄　照合欄

この国際予備審査請求書には、国際予備審査のために、第IV欄に記載する言語による下記の書類が添付されている。

		国際予備審査機関記入欄 受領	未受領
1. 国際出願の翻訳文	枚	☐	☐
2. 特許協力条約第３４条の規定に基づく補正書	枚	☐	☐
3. 特許協力条約第１９条の規定に基づく補正書（又は、要求された場合は翻訳文）の写し	枚	☐	☐
4. 特許協力条約第１９条の規定に基づく説明書（又は、要求された場合は翻訳文）の写し	枚	☐	☐
5. 書簡	枚	☐	☐
6. その他（*書類名を具体的に記載*）	枚	☐	☐

この国際予備審査請求書には、さらに下記の書類が添付されている。

1. ☑ 手数料計算用紙
   ☑ 納付する手数料に相当する特許印紙を貼付した書面
   ☑ 国際事務局の口座への振込を証明する書面
2. ☐ 個別の委任状の原本
3. ☐ 包括委任状の原本
4. ☐ 包括委任状の写し（あれば包括委任状番号）：
5. ☐ 記名押印（署名）の欠落についての説明書
6. ☐ コンピュータ読み取り可能な形式による配列表
7. ☐ その他（*書類名を具体的に記載*）：

第VII欄　出願人、代理人又は共通の代表者の記名押印

各人の氏名（名称）を記載し、その次に押印する。

小林　雅人

国際予備審査機関記入欄

1. 国際予備審査請求書の実際の受理の日

2. 規則 60.1(b)の規定による国際予備審査請求書の受理の日の訂正後の日付

3. ☐ 優先日から１９月を経過後の国際予備審査請求書の受理。
   ただし、以下の4,5の項目にはあてはまらない。
   ☐ 出願人に通知した。

4. ☐ 規則80.5により延長が認められている優先日から１９月の期間内の国際予備審査請求書の受理

5. ☐ 優先日から１９月を経過後の国際予備審査請求書の受理であるが規則82により認められる。

国際事務局記入欄

国際予備審査請求書の国際予備審査機関からの受領の日：

31
~~31~~

第 II 章

特許協力条約に基づく国際出願

手数料計算用紙

国際予備審査請求書の附属書

国際出願番号	国際予備審査機関記入欄
PCT/JP02/01015	
出願人又は代理人の書類記号	国際予備審査機関の日付印
02-PCT-01	

出願人
クミアイ化学工業株式会社
イハラケミカル工業株式会社

所定の手数料の計算

1．特許協力条約に基づく国際出願等に関する法律（国内法）第１８条第１項第４号の規定による手数料（予備審査請求料）（注１）	28000 円	P
2．取扱手数料（注２）	17100 円	H
3．所定の手数料の合計 P及びHに記入した金額を加算し、合計額を合計に記入	45100 円 合　計	

（注１）　法第１８条第１項第４号の規定による手数料については、特許印紙をもって納付しなければならない。

（注２）取扱手数料については、国際予備審査機関である日本国特許庁の長官が告示する国際事務局の口座への振り込みを証明する書面を提出することにより納付しなければならない。

様式ＰＣＴ／ＩＰＥＡ／４０１　（附属書）　（２００１年３月版）



予備審査手数料　２８，０００円

33
~~33~~

ご利用明細

本日はご来店いただきありがとうございます。

印紙税申告納付につき麹町

年月日	時刻	取扱店番	銀行番号	支店番号		口座番号
14052311.49		052				[redacted]

お取引内容	お取引金額	お取扱いできない場合	残高	
お振込	¥17,100-		おつり ¥3,000-	**********

ご案内 **********

お受取人 東京三菱銀行 虎ノ門支店
普通 2074896
WIPO-PCT GENEVA様
ご依頼人 コバヤシ マサト様
0332660655
税込手数料 １０５円を いただきました

MAIN BANK 「メインバンク」総合サービスでは、お取引状況に応じた「うれしい特典」がいっぱい。
くわしくは裏面へ!
インターネットホームページアドレスhttp://www.btm.co.jp/

●残高欄の金額は決済未確認の証券類を含んでいます。
●残高の頭部に「−」がある場合は、お借入れ残高を表わします。

東京三菱銀行

取扱手数料　　１７，１００円

34
~~34~~

特許協力条約

発信人　日本国特許庁（国際予備審査機関）

出願人代理人

小林　雅人

殿

あて名

〒１６２－０８２５

東京都新宿区神楽坂４丁目３番地　煉瓦塔ビル５階　小林・吉村特許事務所

PCT／JP02／01015　　PE402

RECEIVED
K&Y

ＰＣＴ

国際予備審査請求書の受理通知書

（法施行規則第５４条第１項）
〔ＰＣＴ規則５９．３（ｅ）及び６１．１（ｂ）第１文、実施細則６０１（ａ）〕

	発送日（日．月．年） １１．０６．０２	
出願人又は代理人の書類記号　０２－ＰＣＴ－０１	重　要　な　通　知	
国際出願番号 ＰＣＴ／ＪＰ０２／０１０１５	国際出願日（日．月．年） ０７．０２．０２	優先日（日．月．年） ０８．０２．０１
出願人（氏名又は名称） クミアイ化学工業株式会社		

１．国際予備審査機関は、国際出願の国際予備審査請求書を次の日に受理したことを通知する。

２３日０５月０２年

２．この受理の日は次に示す日である。

[*] 管轄する国際予備審査機関が国際予備審査請求書を受理した日
（ＰＣＴ規則６１．１（ｂ））

[ ] 管轄する国際予備審査機関に代わって国際予備審査請求書を受理した日
（ＰＣＴ規則５９．３（ｅ））

[ ] 国際予備審査請求書の手続き補完書を管轄する国際予備審査機関が受理した日

３．[ ]　（注意）受理の日は、優先日から１９月が経過している。

したがって、官庁によっては国際予備審査請求が国内段階移行時期を優先日から３０月（これより遅い期限を規定する官庁もある）までに延長する効果はなく（ＰＣＴ第３９条（１））、国内段階移行の手続きは、優先日から２０月（これより遅い期限を規定する官庁もある）以内に行われなければならない。
しかし、官庁によっては、国際予備審査請求の有無に関わらず３０月（これより遅い期限を規定する官庁もある）の期限が適用される場合がある。
様式ＰＣＴ／ＩＢ／３０１の付属書類を参照すること。
適用される期限の詳細については、ＰＣＴ出願人の手引、第II巻、国内段階およびＷＩＰＯインターネットサイトを参照すること。

[ ] （該当する場合）この通知は、電話、ＦＡＸ又は口頭により次の日に行った連絡を確認するためのものである。

４．上記の３に該当する場合に限り、この通知書の写しを国際事務局に送付した。

名称及びあて名	権限のある職員
日　本　国　特　許　庁　（ＩＰＥＡ／ＪＰ） 郵便番号　100-8915 TEL０３－３５９２－１３０８ 日本国東京都千代田区霞が関三丁目４番３号	特　許　庁　長　官

様式ＰＣＴ／ＩＰＥＡ／４０２（２００２年４月）

35
35

特許協力条約

発信人　日本国特許庁（国際予備審査機関）

出願人代理人

小林　雅人　　殿

あて名

〒　１６２－０８２５

東京都新宿区神楽坂４丁目３番地
煉瓦塔ビル５階　小林・吉村特許事務所

ＰＣＴ見解書

（法第１３条）
〔ＰＣＴ規則66〕

発送日（日.月.年）	20.08.02
出願人又は代理人の書類記号	０２－ＰＣＴ－０１
応答期間	上記発送日から　２　月~~/日~~以内

国際出願番号	国際出願日（日.月.年）	優先日（日.月.年）
ＰＣＴ／ＪＰ０２／０１０１５	０７．０２．０２	０８．０２．０１

国際特許分類（ＩＰＣ）Ｉｎｔ．Ｃｌ⁷　Ｃ０７Ｄ２６１／１０，２６１／１２，４１３／１２，４９８／０４，５１３／０４，４１３／１４，４１７／１２，２６１／２０，４８７／０４，Ａ０１Ｎ４３／８０

出願人（氏名又は名称）
クミアイ化学工業株式会社

１．　これは、この国際予備審査機関が作成した　１　回目の見解書である。

２．　この見解書は、次の内容を含む。

- Ⅰ [X] 見解の基礎
- Ⅱ [ ] 優先権
- Ⅲ [ ] 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成
- Ⅳ [ ] 発明の単一性の欠如
- Ⅴ [X] 法第１３条（ＰＣＴ規則66.2(a)(ii)）に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- Ⅵ [ ] ある種の引用文献
- Ⅶ [ ] 国際出願の不備
- Ⅷ [ ] 国際出願に対する意見

３．　出願人は、この見解書に応答することが求められる。

いつ？　上記応答期間を参照すること。この応答期間に間に合わないときは、出願人は、法第１３条（ＰＣＴ規則66.2(d)）に規定するとおり、その期間の経過前に国際予備審査機関に期間延長を請求することができる。ただし、期間延長が認められるのは合理的な理由があり、かつスケジュールに余裕がある場合に限られることに注意されたい。

どのように？　法第１３条（ＰＣＴ規則66.3）の規定に従い、答弁書及び必要な場合には、補正書を提出する。補正書の様式及び言語については、法施行規則第６２条（ＰＣＴ規則66.8及び66.9）を参照すること。

なお　補正書を提出する追加の機会については、法施行規則第６１条の２（ＰＣＴ規則66.4）を参照すること。補正書及び／又は答弁書の審査官による考慮については、ＰＣＴ規則66.4の2を参照すること。審査官との非公式の連絡については、ＰＣＴ規則66.6を参照すること。

応答がないときは、国際予備審査報告は、この見解書に基づき作成される。

４．　国際予備審査報告作成の最終期限は、ＰＣＴ規則69.2の規定により　０８．０６．０３　である。

名称及びあて先	特許庁審査官（権限のある職員）	４Ｃ	３１２７
日本国特許庁（ＩＰＥＡ／ＪＰ） 郵便番号１００－８９１５ 東京都千代田区霞が関三丁目４番３号	伊藤　幸司 電話番号　０３－３５８１－１１０１　内線　３４５１		

様式ＰＣＴ／ＩＰＥＡ／４０８（表紙）（１９９８年７月）　　（添付用紙の注意書きを参照）

見解書

国際出願番号　PCT／JP02／01015

Ⅰ．　見解の基礎

1．　この見解書は下記の出願書類に基づいて作成された。（法第６条（ＰＣＴ１４条）の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この見解書において「出願時」とする。）

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書　第＿＿＿＿＿＿＿＿ページ、　出願時に提出されたもの
明細書　第＿＿＿＿＿＿＿＿ページ、　国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
明細書　第＿＿＿＿＿＿＿＿ページ、　＿＿＿＿＿＿＿＿付の書簡と共に提出されたもの

☐ 請求の範囲　第＿＿＿＿＿＿＿＿項、　出願時に提出されたもの
請求の範囲　第＿＿＿＿＿＿＿＿項、　ＰＣＴ１９条の規定に基づき補正されたもの
請求の範囲　第＿＿＿＿＿＿＿＿項、　国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
請求の範囲　第＿＿＿＿＿＿＿＿項、　＿＿＿＿＿＿＿＿付の書簡と共に提出されたもの

☐ 図面　第＿＿＿＿＿＿＿＿ページ／図、　出願時に提出されたもの
図面　第＿＿＿＿＿＿＿＿ページ／図、　国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
図面　第＿＿＿＿＿＿＿＿ページ／図、　＿＿＿＿＿＿＿＿付の書簡と共に提出されたもの

☐ 明細書の配列表の部分　第＿＿＿＿＿＿ページ、　出願時に提出されたもの
明細書の配列表の部分　第＿＿＿＿＿＿ページ、　国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
明細書の配列表の部分　第＿＿＿＿＿＿ページ、　＿＿＿＿＿＿＿＿付の書簡と共に提出されたもの

2．　上記の出願書類の言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願の言語である。

上記の書類は、下記の言語である＿＿＿＿＿＿語である。

☐ 国際調査のために提出されたＰＣＴ規則23.1(b)にいう翻訳文の言語
☐ ＰＣＴ規則48.3(b)にいう国際公開の言語
☐ 国際予備審査のために提出されたＰＣＴ規則55.2または55.3にいう翻訳文の言語

3．　この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき見解書を作成した。

☐ この国際出願に含まれる書面による配列表
☐ この国際出願と共に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査（または調査）機関に提出された書面による配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査（または調査）機関に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった
☐ 書面による配列表に記載した配列と磁気ディスクによる配列表に記録した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

4．　補正により、下記の書類が削除された。
☐ 明細書　第＿＿＿＿＿＿＿＿ページ
☐ 請求の範囲　第＿＿＿＿＿＿＿＿項
☐ 図面　図面の第＿＿＿＿＿＿＿＿ページ／図

5．☐ この見解書は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。（ＰＣＴ規則70.2(c)）

見解書

国際出願番号　ＰＣＴ／ＪＰ０２／０１０１５

Ⅴ．　新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第１３条（ＰＣＴ規則66.2(a)(ii)に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

１．　見解

新規性（Ｎ）	請求の範囲	１－１８	有
	請求の範囲		無
進歩性（ＩＳ）	請求の範囲		有
	請求の範囲	１－１８	無
産業上の利用可能性（ＩＡ）	請求の範囲	１－１８	有
	請求の範囲		無

２．　文献及び説明

文献１：ＪＰ　９－３２８４８３　Ａ（三共株式会社）１９９７．１２．２２

文献１には、本願請求の範囲における一般式［Ｉ］の化合物と極めて類似の化学構造を有する、除草活性な２－イソオキサゾリン誘導体が記載されているところ、同等な除草活性な化合物を提供するために、かかるイソオキサゾリン誘導体の置換基の一部を類似の範囲内で置き換えてみることは、当業者が容易になし得ることである。

そして、本願請求の範囲における一般式［Ｉ］の化合物が、一部置換基の相違により文献１に記載の化合物に比して優れた除草効果を奏することが本願明細書には何等示されていないところ、本願請求の範囲に係る発明の効果が従来技術から予測困難な格別顕著なものであるとは認められない。

してみれば、本願請求の範囲に係る発明は、文献１により進歩性を有さない。

注　　意

提出書類の様式及び作成要領について

答弁書及び手続補正書は、特許協力条約に基づく国際出願等に関する法律施行規則第６２条（様式第２３）及び同規則第３１条（様式１５）に従って作成して下さい。

〔備考〕
1　用紙は、日本工業規格Ａ列４番（横２１cm、縦２９．７cm）の大きさとし、可撓性のある、丈夫な、白色の、滑らかな、光沢のない、耐久性のあるものを縦長にして、折らずに片面のみを用い、用紙には、不要な文字、記号、枠線、けい線等を記載してはならない。
2　用紙には、しわ及び裂け目があってはならない。
3　余白は、少なくとも用紙の上端、右端及び下端におのおの２cm並びに左端に２．５cmをとるものとし、原則としてその上端及び左端についてはおのおの４cm並びにその右端及び下端についてはおのおの３cmを越えないものとする。この場合において、余白は、完全な空白としておくこととする。ただし、上端の余白の左隅であって上端から１．５cm以内に番頭記号（願番に記載されている場合に限る。）を付すことができる。
4　答弁書は、タイプ印書又は印刷によるものとし、写真、静電的方法、写真オフセット及びマイクロフィルムによって直接に任意の部数の複製をすることができるように作成する。
5　答弁書のすべての用紙には、アラビア数字により１から始まる連続番号を用紙（余白部分を除く。）の上端又は下端の中央に付する。
6　タイプ印書による場合において、行の間隔は、少なくとも５mm以上をとる。ただし、備考１１、１４においてローマ字を用いるときは１．５文字の幅をとる。
7　記載事項は、４号活字の大きさの文字（備考１１、１４においてローマ字を用いるときは、大文字の大きさが縦０．２１cm以上の文字）により、かつ、暗色の退色性のない色であって備考４に定める要件を満たすもので記載する。
8　「国際出願の表示」の欄には、既に特許庁から国際出願番号の通知を受けている場合には、その番号を「ＰＣＴ／ＪＰＯＯ／ＯＯＯＯＯ」のように記載し、国際出願番号の通知を受ける前の場合には、その国際出願の提出日を日月年の順に「ＯＯ．ＯＯ．ＯＯ提出の国際出願」（年については西暦紀元の下２桁）のように記載するとともに、番頭番号（願番に記載されている場合に限る。）を合わせて記載する。
9　「氏名（名称）」は、自然人にあっては姓及び名を姓、名の順に記載し、また、法人にあってはその名称を記載する。
10　「あて名」は、「日本国、何県、何郡、何村、大字何、字何、何番地、何号」のように詳しく記載するとともに、郵便番号を記載する。
11　氏名若しくは名称又はあて名には、これらの音訳又は英語への翻訳をローマ字を用いて併記する。
12　「国籍」は、出願人又は代表者がその国民である国の国名を記載する。
13　「住所」は、出願人又は代表者がその居住者である国の国名を記載する。
14　国名を記載する場合においては、特許庁長官が指定する国の名称を日本語及び英語により表示する。
15　「代理人」の欄には、その氏名の記載に合わせて、その氏名の前に「弁護士」、「弁理士」又は「法定代理人」のうち該当するものを記載する。
16　代理人によるときは本人の印は不要とし、代理人によらないときは「代理人」の欄を設けるには及ばない。
17　各用紙においては、原則として抹消、訂正、重ね書き及び行間挿入を行ってはならない。
18　答弁書の用紙は、容易に分離し、又はとじ直すことができるように例えばクリップ等を用いてとじる。
19　「あて名」は出願人、代表者、代理人又は復代理人各人ごとに１つのあて名のみを記載する。
20　「復代理人」の欄には、その氏名の記載に合わせて、その氏名の前に「弁護士」又は「弁理士」のうち該当するものを記載する。
21　復代理人によるときは代理人の印は不要とし、復代理人によらないときは「復代理人」の欄を設けるには及ばない。
22　日付は、西暦紀元及びグレゴリー暦により、日についての数字、月についての数字及び年についての最後から２つの数字をこの順序に従ってそれぞれについて２桁のアラビア数字で表示し、かつ、日及び月の数字の後にピリオドを付す（例えば１９７８年３月３０日は「３０．０３．７８」）。他の紀元又は暦を用いる場合には、西暦紀元及びグレゴリー暦による日付を併記する。

様式第２３（第６２条関係）

答　弁　書

特許庁審査官　　殿

1　国際出願の表示
2　出願人（代表者）
　　氏名（名称）
　　あて名
　　国籍
　　住所
3　代理人
　　氏名
　　あて名
4　通知の日付
5　答弁の内容
6　添付書類の目録

〔備考〕
1　法第６条の規定による命令に基づき補正をするときは表題を「手続補正書（法第６条の規定による命令に基づく補正）」とし、法第１１条の規定により補正をするときは「手続補正書（法第１１条の規定による補正）」とし、令第１条第２項の規定による命令に基づき補正をするときは「手続補正書（令第１条第２項の規定による命令に基づく補正）」とし、第２７条の３第１項の規定により補正をするときは「手続補正書（第２７条の３第１項の規定による補正）」とし、第２８条第１項の規定による命令に基づき補正をするときは「手続補正書（第２８条第１項の規定による命令に基づく補正）」とし、第５０条の３第３項の規定によりフレキシブルディスクを提出するときは、「第５０条の３第３項の規定によるフレキシブルディスクの提出書」とし、第５０条の３第５項の規定による命令に基づきフレキシブルディスクを提出するときは、「第５０条の３第５項の規定による命令に基づくフレキシブルディスクの提出書」とし、第５０条の３第５項の規定による命令に基づき配列表を記載した書面を提出するときは、「第５０条の３第５項の規定による命令に基づく配列表を記載した書面の提出書」とし、第５０条の３第８項の規定による命令に基づき補正をするときは、「手続補正書（第５０条の３第８項の規定による命令に基づく補正）」とする。
2　提出先は、特許庁審査官が答弁書の提出又は補正の機会を付与した場合にあっては当該特許庁審査官、その他の場合にあっては特許庁長官とする。
3　「補正の対象」の欄には、「願書のⅡ．出願人の欄」のように補正をする書類名と補正をする箇所を記載する。
4　「補正の内容」の欄には、「別紙のとおり」と記載するとともに補正事項を摘示し、補正のための差替え用紙を別紙として添付する。ただし、補正の結果、用紙の全体が削除されることとなる場合、法第６条、令第１条第２項、第２８条第１項若しくは第５０条の３第８項の規定による命令に基づく手続の補正の場合又は第２７条の３第１項の規定による手続の補正の場合であって、その補正に係る事項についての記載原本への書き換えが容易にできるときは差替え用紙によることを要しない。なお、法第１１条の規定による補正のための差替え用紙を添付する場合において、その補正に係る事項が、一部の箇所の削除又は軽微な訂正若しくは追加である場合には、用紙の明りょうさ及び直接複製に影響を及ぼさないことを条件として、先に提出した補正書の写しに補正をすることにより、差替え用紙とすることができる。
5　請求の範囲について補正をするときは、当該補正に係る請求の範囲を次のように記載した差替え用紙を添付する。
イ　新たに請求の範囲を追加するときは、その追加する請求の範囲に補正前の請求の範囲の最後のものに付した番号を「Ｏ（追加）」のように記載する。
ロ　いずれかの請求の範囲を削除するときには、その削除する請求の範囲に付されている番号を「Ｏ（削除）」のように記載する。
ハ　請求の範囲の数を増減せずに補正するときは、その補正された請求の範囲に補正前の請求の範囲の番号と同一の番号を「Ｏ（補正後）」のように記載する。
6　第５０条の３第３項の規定によりフレキシブルディスクを提出するとき又は第５０条の３第５項の規定による命令に基づきフレキシブルディスクを提出するときは、次の要領で記載する。
イ　「７　添付書類の目録」の欄に次のように記載する。
　５　添付書類の目録　１　配列表に関するコードデータを記録したフレキシブルディスク　１枚
　　２　陳述書　１通
　　３　フレキシブルディスクの記録形式等の情報を記載した書面　１通
ロ　「陳述書」は、原則として次の文例により作成する。「国際出願の表示」の項目は、備考１５に従って記載する。
（文例）

陳述書

特許庁長官　殿

本書に添付したフレキシブルディスクに記録した塩基配列又はアミノ酸配列は、明細書に記載した塩基配列又はアミノ酸配列を忠実にコード化したものであって、内容を変更したものでないことを陳述します。

平成　年　月　日

国際出願の表示
発明の名称
特許出願人・代理人　　(印)

ハ　「フレキシブルディスクの記録形式等の情報を記載した書面」は、原則として、「出願人氏名（名称）」、「代理人氏名（名称）」、「国際出願の表示」、「発明の名称」、「使用した文字コード」、「配列を記録したファイル名」及び「連絡先（電話番号及び担当者の氏名）」の項目を設けて記載することにより作成する。
ニ　「５　補正の対象」及び「６　補正の内容」の欄は設けない。
7　第５０条の３第５項の規定による命令に基づき配列表を記載した書面を提出するときは、「７　添付書類の目録」の欄に次のように記載し、「５　補正の対象」及び「６　補正の内容」の欄は設けない。
　５　添付書類の目録　１　配列表を記載した書面　１通
8　用紙は、日本工業規格Ａ列４番（横２１cm、２９．７cm）の大きさとし、可撓性のある、丈夫な、白色の、滑らかな、光沢のない、耐久性のあるものを縦長にして、折らずに片面のみを用い、用紙には、不要な文字、記号、枠線、けい線等を記載してはならない。
9　用紙には、しわ及び裂け目があってはならない。
10　余白は、少なくとも用紙の上端、右端及び下端におのおの２cm並びに左端に２．５cmをとるものとし、原則としてその上端及び左端についてはおのおの４cm並びにその右端及び下端についてはおのおの３cmを越えないものとする。この場合において、余白は、完全な空白としておくこととする。ただし、上端の余白の左隅であって上端から１．５cm以内に番頭記号（願番に記載されている場合に限る。）を付すことができる。
11　手続補正書は、タイプ印書又は印刷によるものとし、写真、静電的方法、写真オフセット及びマイクロフィルムによって直接に任意の部数の複製をすることができるように作成する。
12　手続補正書のすべての用紙には、アラビア数字により１から始まる連続番号を用紙（余白部分を除く。）の上端又は下端の中央に付する。
13　タイプ印書による場合において、行の間隔は、少なくとも５mm以上をとる。ただし、備考１６、１９においてローマ字を用いるときは１．５文字の幅をとる。
14　記載事項は、４号活字の大きさの文字（備考１６、１９においてローマ字を用いるときは、大文字の大きさが縦０．２１cm以上の文字）により、かつ、暗色の退色性のない色であって備考９に定める要件を満たすもので記載する。
15　「国際出願の表示」の欄には、既に特許庁から国際出願番号の通知を受けている場合には、その番号を「ＰＣＴ／ＪＰ／ＯＯ／ＯＯＯＯＯ」のように記載し、国際出願番号の通知を受ける前の場合には、その国際出願の提出日を日月年の順に「ＯＯ．ＯＯ．ＯＯ提出の国際出願」（年については西暦紀元の下２桁）のように記載するとともに、番頭番号（願番に記載されている場合に限る。）を合わせて記載する。
16　「氏名（名称）」は、自然人にあっては姓及び名を姓、名の順に記載し、また、法人にあってはその名称を記載する。
17　「あて名」は、「日本国、何県、何郡、何村、大字何、字何、何番地、何号」のように詳しく記載するとともに、郵便番号を記載する。
18　氏名若しくは名称又はあて名には、これらの音訳又は英語への翻訳をローマ字を用いて併記する。
19　「国籍」は、出願人又は代表者がその国民である国の国名を記載する。
20　「住所」は、出願人又は代表者がその居住者である国の国名を記載する。
21　国名を記載する場合においては、特許庁長官が指定する国の名称を日本語及び英語により表示する。
22　「代理人」の欄には、その氏名の記載に合わせて、その氏名の前に「弁護士」、「弁理士」又は「法定代理人」のうち該当するものを記載する。
23　代理人によるときは本人の印は不要とし、代理人によらないときは「代理人」の欄を設けるには及ばない。
24　各用紙においては、原則として抹消、訂正、重ね書き及び行間挿入を行ってはならない。
25　手続補正書の用紙は、容易に分離し、又はとじ直すことができるように例えばクリップ等を用いてとじる。
26　「あて名」は出願人、代表者、代理人又は復代理人各人ごとに１つのあて名のみを記載する。
27　「復代理人」の欄には、その氏名の記載に合わせて、その氏名の前に「弁護士」又は「弁理士」のうち該当するものを記載する。
28　復代理人によるときは代理人の印は不要とし、復代理人によらないときは「復代理人」の欄を設けるには及ばない。
29　日付は、西暦紀元及びグレゴリー暦により、日についての数字、月についての数字及び年についての最後から２つの数字をこの順序に従ってそれぞれについて２桁のアラビア数字で表示し、かつ、日及び月の数字の後にピリオドを付す（例えば１９７８年３月３０日は「３０．０３．７８」）。他の紀元又は暦を用いる場合には、西暦紀元及びグレゴリー暦による日付を併記する。

様式第１５（第３１条関係）

手　続　補　正　書

特許庁長官　　殿
（特許庁審査官　　殿）

1　国際出願の表示
2　出願人（代表者）
　　氏名（名称）
　　あて名
　　国籍
　　住所
3　代理人
　　氏名
　　あて名
4　補正命令の日付
5　補正の対象
6　補正の内容
7　添付書類の目録

39 39

PATENT COOPERATION TREATY

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

NOTICE INFORMING THE APPLICANT OF THE COMMUNICATION OF THE INTERNATIONAL APPLICATION TO THE DESIGNATED OFFICES

(PCT Rule 47.1(c), first sentence)

To:
KOBAYASHI, Masato
5th Floor, Renga-toh Building
3, Kagurazaka 4-chome
Shinjuku-ku, Tokyo 162-0825
JAPON

Date of mailing (day/month/year)	
15 August 2002 (15.08.02)	
Applicant's or agent's file reference: 02-PCT-01	IMPORTANT NOTICE

International application No.	International filing date (day/month/year)	Priority date (day/month/year)
PCT/JP02/01015	07 February 2002 (07.02.02)	08 February 2001 (08.02.01)

Applicant: KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD. et al

1. Notice is hereby given that the International Bureau has **communicated**, as provided in Article 20, the international application to the following designated Offices on the date indicated above as the date of mailing of this notice:
   KP,KR,US
   In accordance with Rule 47.1(c), third sentence, those Offices will accept the present notice as conclusive evidence that the communication of the international application has duly taken place on the date of mailing indicated above and no copy of the international application is required to be furnished by the applicant to the designated Office(s).

2. The following designated Offices have waived the requirement for such a communication at this time:
   AE,AG,AL,AM,AP,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BR,BY,BZ,CA,CH,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DK,DM,DZ,EA,EC, EE,EP,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,HR,HU,ID,IL,IN,IS,KE,KG,KZ,LC,LK,LR,LS,LT,LU,LV,MA,MD, MG,MK,MN,MW,MX,MZ,NO,NZ,OA,OM,PH,PL,PT,RO,RU,SD,SE,SG,SI,SK,SL,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ, UA,UG,UZ,VN,YU,ZA,ZM,ZW
   The communication will be made to those Offices only upon their request. Furthermore, those Offices do not require the applicant to furnish a copy of the international application (Rule 49.1(a-bis)).

3. Enclosed with this notice is a copy of the international application as published by the International Bureau on
   15 August 2002 (15.08.02) under No. WO 02/062770

4. **TIME LIMITS for filing a demand for international preliminary examination and for entry into national phase**
   The applicable time limit for entering the national phase will, **subject to what is said in the following paragraph** be **30 MONTHS** from the priority date, not only in respect of any elected Office if a demand for international preliminary examination is filed before the expiration of **19 months** from the priority date, but also in respect of any designated Office, in the absence of filing of such demand, where Article22(1) as modified with effect from 1 April 2002 applies in respect of the designated Office. For further details, see PCT Gazette No.44/2001 of 1 November 2001, pages 19926, 19932 and19934, as well as the PCT Newsletter, October and November 2001 and February 2002 issues.
   In practice, **time limits other than the 30-month time limit** will continue to apply, for various periods of time, in respect of certain designated or elected Offices. For **regular updates on the applicable time limits** (20,21,30 or 31 months , or other time limit), Office by Office, refer to the PCT Gazette, the PCT Newsletter and the PCT Applicant's Guide, Volume II, National Chapters, all available from WIPO's Internet site, at http://www.wipo.int/pct/en/index.html.
   For filing a **demand for international preliminary examination**, see the PCT Applicant's Guide, Volume I/A, Chapter IX. Only an an applicant who is a national or resident of a PCT Contracting State which is bound by Chapter II has the right to file a demand for international preliminary examination (at present, all PCT Contracting States are bound by Chapter II.)
   It is the applicant's **sole responsibility** to monitor all these limits.

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland	Authorized officer J. Zahra
Facsimile No. (41-22) 740.14.35	Telephone No. (41-22) 338.91.11

PATENT COOPERATION TREATY

XO
40

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

INFORMATION CONCERNING ELECTED OFFICES NOTIFIED OF THEIR ELECTION

(PCT Rule 61.3)

To:
KOBAYASHI, Masato
5th Floor, Renga-toh Building
3, Kagurazaka 4-chome
Shinjuku-ku, Tokyo 162-0825
JAPON

Date of mailing (day/month/year)	
15 August 2002 (15.08.02)	
Applicant's or agent's file reference 02-PCT-01	**IMPORTANT INFORMATION**

International application No.	International filing date (day/month/year)	Priority date (day/month/year)
PCT/JP02/01015	07 February 2002 (07.02.02)	08 February 2001 (08.02.01)

Applicant
KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD. et al

1. The applicant is hereby informed that the International Bureau has, according to Article 31(7), notified each of the following Offices of its election:

   EP :AT,BE,CH,CY,DE,DK,ES,FI,FR,GB,GR,IE,IT,LU,MC,NL,PT,SE,TR
   National :AU,BG,CA,CN,DE,GB,IL,KP,KR,MN,NO,NZ,PL,RO,RU,SE,SK,US

2. The following Offices have waived the requirement for the notification of their election; the notification will be sent to them by the International Bureau only upon their request:

   AP :GH,GM,KE,LS,MW,MZ,SD,SL,SZ,TZ,UG,ZM,ZW
   EA :AM,AZ,BY,KG,KZ,MD,RU,TJ,TM
   OA :BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,ML,MR,NE,SN,TD,TG
   National :AE,AG,AL,AM,AT,AZ,BA,BB,BR,BY,BZ,CH,CO,CR,CU,CZ,DK,DM,DZ,EC,EE, ES,FI,GD,GE,GH,GM,HR,HU,ID,IN,IS,KE,KG,KZ,LC,LK,LR,LS,LT,LU,LV,MA,MD,MG, MK,MW,MX,MZ,OM,PH,PT,SD,SG,SI,SL,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,UZ,VN,YU,ZA,ZM, ZW

3. The applicant is reminded that he must enter the "national phase" **before the expiration of 30 months from the priority date** before each of the Offices listed above. This must be done by paying the national fee(s) and furnishing , if prescribed, a translation of the international application (Article 39(1)(a)), as well as, where applicable, by furnishing a translation of any annexes of the international preliminary examination report (Article 36(3)(b) and Rule 74.1).

   Some offices have fixed time limits expiring later than the above-mentioned time limit. For detailed information about the applicable time limits and the acts to be performed upon entry into the national phase before a particular Office, see Volume II of the PCT Applicant's Guide.

   The entry into the European regional phase is postponed **until 31 months from the priority date** for all States designated for the purposes of obtaining a European patent.

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Facsimile No. (41-22) 740.14.35

Authorized officer:
J. Zahra

Telephone No. (41-22) 338.83.38

41

特　許　協　力　条　約

発信人　日本国特許庁（国際予備審査機関）

出願人代理人

小林　雅人　　殿

あて名
〒　１６２－０８２５

東京都新宿区神楽坂４丁目３番地
煉瓦塔ビル５階　小林・吉村特許事務所

PCT

国際予備審査報告の送付の通知書

（法施行規則第５７条）
〔ＰＣＴ規則71.1〕

発送日（日.月.年）	19.11.02
出願人又は代理人の書類記号	０２－ＰＣＴ－０１
重要な通知	

国際出願番号	国際出願日（日.月.年）	優先日（日.月.年）
ＰＣＴ／ＪＰ０２／０１０１５	０７．０２．０２	０８．０２．０１

出願人（氏名又は名称）
クミアイ化学工業株式会社

１．国際予備審査機関は、この国際出願に関して国際予備審査報告及び付属書類が作成されている場合には、それらをこの送付書とともに送付することを、出願人に通知する。

２．国際予備審査報告及び付属書類が作成されている場合には、すべての選択官庁に通知するために、それらの写しを国際事務局に送付する。

３．選択官庁から要求があったときは、国際事務局は国際予備審査報告（付属書類を除く）の英語の翻訳文を作成し、それをその選択官庁に送付する。

４．注　意

出願人は、各選択官庁に対し優先日から３０月以内に（官庁によってはもっと遅く）所定の手続（翻訳文の提出及び国内手数料の支払い）をしなければならない（ＰＣＴ３９条（１））（様式ＰＣＴ／ＩＢ／３０１とともに国際事務局から送付された注を参照）。

国際出願の翻訳文が選択官庁に提出された場合には、その翻訳文は、国際予備審査報告の付属書類の翻訳文を含まなければならない。
この翻訳文を作成し、関係する選択官庁に直接送付するのは出願人の責任である。

選択官庁が適用する期間及び要件の詳細については、ＰＣＴ出願人の手引き第Ⅱ巻を参照すること。

名称及びあて名	権限のある職員	４Ｃ	３１２７
日本国特許庁（ＩＰＥＡ／ＪＰ） 郵便番号１００－８９１５ 東京都千代田区霞が関三丁目４番３号	特　許　庁　長　官 電話番号　０３－３５８１－１１０１　内線　３４５１		

様式ＰＣＴ／ＩＰＥＡ／４１６（１９９２年７月）　　（添付用紙の注意書きを参照）

注　　意

1．文献の写しの請求について
国際予備審査報告に記載された文献であって国際調査報告に記載されていない文献の複写

特許庁にこれらの引用文献の写しを請求することもできますが、独立行政法人工業所有権総合情報館（特許庁庁舎２階）で公報類の閲覧・複写および公報以外の文献複写等の取り扱いをしています。

〔担当及び照会先〕
〒１００－００１３　東京都千代田区霞が関３丁目４番３号（特許庁庁舎２階）
独立行政法人工業所有権総合情報館
【公 報 類】　閲覧部　ＴＥＬ　03－3581－1101　内線3811～2
【公報以外】　資料部　ＴＥＬ　03―3581―1101　内線3831～3

また、（財）日本特許情報機構でも取り扱いをしています。
これらの引用文献の複写を請求する場合は下記の点に注意してください。

〔申込方法〕
（１）特許（実用新案・意匠）公報については、下記の点を明記してください。
○特許・実用新案及び意匠の種類
○出願公告又は出願公開の年次及び番号（又は特許番号、登録番号）
○必要部数
（２）公報以外の文献の場合は、下記の点に注意してください。
○国際予備審査報告の写しを添付してください（返却します）。
〔申込み及び照会先〕
〒１３５－００１６　東京都江東区東陽４－１－７　佐藤ビル
財団法人　日本特許情報機構　情報処理部業務課
ＴＥＬ　０３－３５０８－２３１３
注）　特許庁に対して文献の写しの請求をすることができる期間は、国際出願日から７年です。

2．各選択官庁に対し、国際出願の写し（既に国際事務局から送達されている場合は除く）及びその所定の翻訳文を提出し、国内手数料を支払うことが必要となります。その期限については各国ごとに異なりますので注意してください。（条約第２２条、第３９条及び第６４条(2)(a)(i)参照）

43
~~43~~

特　許　協　力　条　約

PCT

国際予備審査報告

（法第１２条、法施行規則第56条）
〔ＰＣＴ３６条及びＰＣＴ規則70〕

出願人又は代理人 の書類記号　０２－ＰＣＴ－０１	今後の手続きについては、国際予備審査報告の送付通知（様式ＰＣＴ／ＩＰＥＡ／４１６）を参照すること。	
国際出願番号 ＰＣＴ／ＪＰ０２／０１０１５	国際出願日 （日.月.年）　０７．０２．０２	優先日 （日.月.年）　０８．０２．０１
国際特許分類（ＩＰＣ）Ｉｎｔ．Ｃｌ⁷　Ｃ０７Ｄ２６１／１０，２６１／１２，４１３／１２，４９８／０４，５１３／０４，４１３／１４，４１７／１２，２６１／２０，４８７／０４，Ａ０１Ｎ４３／８０		
出願人（氏名又は名称） クミアイ化学工業株式会社		

１．　国際予備審査機関が作成したこの国際予備審査報告を法施行規則第57条（ＰＣＴ３６条）の規定に従い送付する。

２．　この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で　3　ページからなる。

☐ この国際予備審査報告には、附属書類、つまり補正されて、この報告の基礎とされた及び／又はこの国際予備審査機関に対してした訂正を含む明細書、請求の範囲及び／又は図面も添付されている。
（ＰＣＴ規則70.16及びＰＣＴ実施細則第６０７号参照）
この附属書類は、全部で＿＿＿＿＿＿ページである。

３．　この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

Ⅰ　☒　国際予備審査報告の基礎

Ⅱ　☐　優先権

Ⅲ　☐　新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成

Ⅳ　☐　発明の単一性の欠如

Ⅴ　☒　ＰＣＴ３５条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明

Ⅵ　☐　ある種の引用文献

Ⅶ　☐　国際出願の不備

Ⅷ　☐　国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 ２３．０５．０２	国際予備審査報告を作成した日 ０８．１１．０２
名称及びあて先 日本国特許庁（ＩＰＥＡ／ＪＰ） 郵便番号１００－８９１５ 東京都千代田区霞が関三丁目４番３号	特許庁審査官（権限のある職員）　４Ｃ　３１２７ 伊藤　幸司　印 電話番号　０３－３５８１－１１０１　内線　３４５１

様式ＰＣＴ／ＩＰＥＡ／４０９（表紙）（１９９８年７月）

国際予備審査報告

国際出願番号　ＰＣＴ／ＪＰ０２／０１０１５

Ⅰ．　国際予備審査報告の基礎

1．　この国際予備審査報告は下記の出願書類に基づいて作成された。（法第６条（ＰＣＴ１４条）の規定に基づく命令に応答するために提出された差し替え用紙は、この報告書において「出願時」とし、本報告書には添付しない。ＰＣＴ規則70.16, 70.17）

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書　第 ＿＿＿＿＿＿ ページ、　出願時に提出されたもの
明細書　第 ＿＿＿＿＿＿ ページ、　国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
明細書　第 ＿＿＿＿＿＿ ページ、　＿＿＿＿＿＿ 付の書簡と共に提出されたもの

☐ 請求の範囲　第 ＿＿＿＿＿＿ 項、　出願時に提出されたもの
請求の範囲　第 ＿＿＿＿＿＿ 項、　ＰＣＴ１９条の規定に基づき補正されたもの
請求の範囲　第 ＿＿＿＿＿＿ 項、　国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
請求の範囲　第 ＿＿＿＿＿＿ 項、　＿＿＿＿＿＿ 付の書簡と共に提出されたもの

☐ 図面　第 ＿＿＿＿＿＿ ページ／図、　出願時に提出されたもの
図面　第 ＿＿＿＿＿＿ ページ／図、　国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
図面　第 ＿＿＿＿＿＿ ページ／図、　＿＿＿＿＿＿ 付の書簡と共に提出されたもの

☐ 明細書の配列表の部分　第 ＿＿＿＿＿＿ ページ、　出願時に提出されたもの
明細書の配列表の部分　第 ＿＿＿＿＿＿ ページ、　国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
明細書の配列表の部分　第 ＿＿＿＿＿＿ ページ、　＿＿＿＿＿＿ 付の書簡と共に提出されたもの

2．　上記の出願書類の言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願の言語である。

上記の書類は、下記の言語である ＿＿＿＿＿＿ 語である。

☐ 国際調査のために提出されたＰＣＴ規則23.1(b)にいう翻訳文の言語
☐ ＰＣＴ規則48.3(b)にいう国際公開の言語
☐ 国際予備審査のために提出されたＰＣＴ規則55.2または55.3にいう翻訳文の言語

3．　この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際予備審査報告を行った。

☐ この国際出願に含まれる書面による配列表
☐ この国際出願と共に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査（または調査）機関に提出された書面による配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査（または調査）機関に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった
☐ 書面による配列表に記載した配列と磁気ディスクによる配列表に記録した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

4．　補正により、下記の書類が削除された。
☐ 明細書　第 ＿＿＿＿＿＿ ページ
☐ 請求の範囲　第 ＿＿＿＿＿＿ 項
☐ 図面　図面の第 ＿＿＿＿＿＿ ページ／図

5．☐ この国際予備審査報告は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。（ＰＣＴ規則70.2(c)　この補正を含む差し替え用紙は上記１．における判断の際に考慮しなければならず、本報告に添付する。）

国際予備審査報告	国際出願番号　PCT／JP02／01015

V.　新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第１２条（ＰＣＴ３５条(2)）に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1.　見解

新規性（N）	請求の範囲	1－18	有
	請求の範囲		無
進歩性（ＩＳ）	請求の範囲		有
	請求の範囲	1－18	無
産業上の利用可能性（ＩＡ）	請求の範囲	1－18	有
	請求の範囲		無

2.　文献及び説明（ＰＣＴ規則70.7）

文献１：ＪＰ　９－３２８４８３　Ａ（三共株式会社）１９９７．１２．２２

文献１には、本願請求の範囲における一般式［Ｉ］の化合物と極めて類似の化学構造を有する、除草活性な２－イソオキサゾリン誘導体が記載されているところ、同等な除草活性な化合物を提供するために、かかるイソオキサゾリン誘導体の置換基の一部を類似の範囲内で置き換えてみることは、当業者が容易になし得ることである。

そして、本願請求の範囲における一般式［Ｉ］の化合物が、一部置換基の相違により文献１に記載の化合物に比して優れた除草効果を奏することが本願明細書には何等示されていないところ、本願請求の範囲に係る発明の効果が従来技術から予測困難な格別顕著なものであるとは認められない。

してみれば、本願請求の範囲に係る発明は、文献１により進歩性を有さない。

46

PATENT COOPERATION TREATY

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

NOTIFICATION OF TRANSMITTAL
OF COPIES OF TRANSLATION
OF THE INTERNATIONAL PRELIMINARY
EXAMINATION REPORT

(PCT Rule 72.2)

To:

KOBAYASHI, Masato
5th Floor, Renga-toh Building
3, Kagurazaka 4-chome
Shinjuku-ku, Tokyo 162-0825
Japan



Date of mailing (day/month/year)	
05 May 2003 (05.05.03)	
Applicant's or agent's file reference	IMPORTANT NOTIFICATION
02-PCT-01	
International application No.	International filing date (day/month/year)
PCT/JP02/01015	07 February 2002 (07.02.02)
Applicant	
KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD. et al	

1. Transmittal of the translation to the applicant.

The International Bureau transmits herewith a copy of the English translation made by the International Bureau of the international preliminary examination report established by the International Preliminary Examining Authority.

2. Transmittal of the copy of the translation to the elected Offices.

The International Bureau notifies the applicant that copies of that translation have been transmitted to the following elected Offices requiring such translation:

EP,CA,CN,KP,RO,US

The following elected Offices, having waived the requirement for such a transmittal at this time, will receive copies of that translation from the International Bureau only upon their request:

AP,EA,AE,AG,AL,AM,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BR,BY,BZ,CH,CO,CR,CU,CZ,DE,DK,DM,DZ,EC,EE,ES,
FI,GB,GD,GE,GH,GM,HR,HU,ID,IL,IN,IS,KE,KG,KR,KZ,LC,LK,LR,LS,LT,LU,LV,MA,MD,MG,MK,
MN,MW,MX,MZ,NO,NZ,OM,PH,PL,PT,RU,SD,SE,SG,SI,SK,SL,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,UZ,VN,
YU,ZA,ZM,ZW,OA

3. Reminder regarding translation into (one of) the official language(s) of the elected Office(s).

The applicant is reminded that, where a translation of the international application must be furnished to an elected Office, that translation must contain a translation of any annexes to the international preliminary examination report.

It is the applicant's responsibility to prepare and furnish such translation directly to each elected Office concerned (Rule 74.1). See Volume II of the PCT Applicant's Guide for further details.

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland	Authorized officer Eliott PERETTI (Fax 338 9090)
Facsimile No. (41-22) 338.90.90	Telephone No. (41-22) 338 9906

Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

47

Applicant's or agent's file reference 02-PCT-01	FOR FURTHER ACTION	See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)
International application No. PCT/JP02/01015	International filing date (*day/month/year*) 07 February 2002 (07.02.02)	Priority date (*day/month/year*) 08 February 2001 (08.02.01)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D 261/10, 261/12, 413/12, 498/04, 513/04, 413/14, 417/12, 261/20, 487/04, A01N 43/80		
Applicant KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.		

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.

2. This REPORT consists of a total of 3 sheets, including this cover sheet.

☐ This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).

These annexes consist of a total of _____ sheets.

3. This report contains indications relating to the following items:

- I ☒ Basis of the report
- II ☐ Priority
- III ☐ Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- IV ☐ Lack of unity of invention
- V ☒ Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- VI ☐ Certain documents cited
- VII ☐ Certain defects in the international application
- VIII ☐ Certain observations on the international application

Date of submission of the demand	Date of completion of this report
23 May 2002 (23.05.02)	08 November 2002 (08.11.2002)
Name and mailing address of the IPEA/JP Facsimile No.	Authorized officer Telephone No.

Form PCT/IPEA/409 (cover sheet) (July 1998)

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.
PCT/JP02/01015

48

I. Basis of the report

1. With regard to the **elements** of the international application:*

☒ the international application as originally filed

☐ the description:

pages _____, as originally filed
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____

☐ the claims:

pages _____, as originally filed
pages _____, as amended (together with any statement under Article 19
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____

☐ the drawings:

pages _____, as originally filed
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____

☐ the sequence listing part of the description:

pages _____, as originally filed
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____

2. With regard to the **language**, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item.
These elements were available or furnished to this Authority in the following language _____ which is:

☐ the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)).
☐ the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).
☐ the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).

3. With regard to any **nucleotide and/or amino acid sequence** disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:

☐ contained in the international application in written form.
☐ filed together with the international application in computer readable form.
☐ furnished subsequently to this Authority in written form.
☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form.
☐ The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.
☐ The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.

4. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

☐ the description, pages _____
☐ the claims, Nos. _____
☐ the drawings, sheets/fig _____

5. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).**

* *Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16 and 70.17).*

** *Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.*

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.
PCT/JP02/01015

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Statement

Novelty (N)	Claims	1-18	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	Claims		YES
	Claims	1-18	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-18	YES
	Claims		NO

2. Citations and explanations

Document 1; JP, 9-328483, A (Sankyo Co., Ltd.), 22 December, 1997 (22.12.97)

Document 1 describes herbicidally active 2-isoxazoline derivatives with a chemical structure very similar to that of the compounds of the general formula [I] in the claims of the present application. A person skilled in the art could have easily replaced some of the substituent groups of the isoxazoline derivatives within the scope of similarity for presenting equivalent herbicidally active compounds.

Furthermore, the specification of the present application does not describe at all that the compounds of the general formula [I] in the claims of the present application exhibit an excellent herbicidal effect compared with the compounds described in document 1, due to the difference in some substituent groups. So, it cannot be considered that the effect achieved by the subject matters of the claims of the present application is so remarkable as to be difficult to predict from the prior art.

Therefore, the subject matters of the claims of the present application do not appear to involve an inventive step in view of document 1.

50

~~70~~

TRATADO DE COOPERACIÓN EN MATERIA DE PATENTES

Expide: LA OFICINA INTERNACIONAL

PCT

NOTIFICACIÓN DE TRANSMISIÓN DE COPIAS DE LA TRADUCCIÓN DEL INFORME DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL
(regla 72.2 DEL PCT)

Destinatario:

KOBAYASHI, Masato
Piso 5to., Edificio Renga-toh
3, Kagurazaka 4-chome
Shinjuku-ku, Tokio 162-0825
Japón

Fecha de expedición: 05 de mayo de 2003 (05.05.03)	
Referencia del expediente del solicitante o del mandatario: 02-PCT-01	**NOTIFICACIÓN IMPORTANTE**
Solicitud internacional nº PCT/JP02/01015	Fecha de la presentación internacional 7 de Febrero de 2002
Solicitante KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD. et al	

1. Transmisión de la traducción al solicitante.

   La Oficina Internacional transmite adjunto una copia de la traducción al inglés hecha por la Oficina Internacional, del informe de examen preliminar internacional establecido por la Autoridad encargada del examen preliminar internacional.

2. Transmisión de la copia de la traducción a las Oficinas elegidas.

   La Oficina Internacional notifica al solicitante que se han transmitido copias de dicha traducción a las siguientes Oficinas elegidas que la requieren:

   EP, CA, CN, KP, RO, US

   Las siguientes Oficinas elegidas, las cuales han renunciado al requerimiento de dicha transmisión en este momento, recibirán copias de dicha traducción de la Oficina Internacional únicamente por solicitud de las mismas:

   AP, EA, AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CH, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW, OA

51

3.	Recordatorio respecto a la traducción a (uno de) el(los) lenguaje(s) oficial(es) de la(s) Oficina(s) Se le recuerda al solicitante que cuando se debe suministrar la traducción de la solicitud internacional a una oficina elegida, dicha traducción debe incluir la traducción de todos los anexos del informe de examen preliminar internacional. Es responsabilidad del solicitante preparar y enviar dicha traducción directamente a cada oficina elegida interesada (Regla 74.1). Ver el Volumen II de la Guía del solicitante del PCT para mayores detalles.

Oficina Internacional de la OMPI 34, Chemin des Colombettes 1211 Ginebra 20, Suiza Fax: (41-22) 338.90.90	Funcionario autorizado Eliott PERETTI (Fax 338 9090)

TRADUCCION

TRATADO DE COOPERACIÓN EN MATERIA DE PATENTES

PCT

INFORME DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL

(artículo 36 y regla 70 del PCT)

Referencia del expediente del solicitante 02-PCT-01	**PARA DAR CURSO** Ver la notificación de transmisión del informe de examen preliminar internacional (formulario PCT/IPEA/416)	
Solicitud internacional nº PCT/JP02/01015	Fecha de solicitud internacional 7 de Febrero de 2002 (07.02.02)	Fecha de prioridad 8 de Febrero de 2001 (08.02.01)
Clasificación internacional de las patentes (IPC) o clasificación nacional e IPC C07D 261/10, 261/12, 413/12, 498/04, 513/04, 413/14, 417/12, 261/20, 487/04, A01N 43/80		
Solicitante KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.		

1. De conformidad con el artículo 36, se transmite al solicitante el presente informe de examen preliminar internacional preparado por la administración encargada del examen preliminar internacional.

2. Este INFORME comprende ____3____ hojas, incluyendo la presente hoja de cubierta

_____ Con ANEXOS, es decir, hojas de la descripción, de las reivindicaciones y/o de los dibujos las cuales fueron modificadas y que sirven de base al presente informe y/o de hojas que contienen rectificaciones hechas ante esta administración (ver la regla 70.16 y la instrucción 607 de las Instrucciones administrativas del PCT)

Estos anexos comprenden un total de _____ hojas.

3. El presente informe comprende indicaciones relativas a los siguientes puntos:

I	X	Base del informe
II		Prioridad
III		Ausencia de formación de opinión en cuanto a la novedad, el nivel inventivo y la aplicación industrial
IV		Ausencia de unidad de invención
V	X	Declaración motivada en cuanto a la novedad, el nivel inventivo y la aplicación industrial, citas y explicaciones que apoyan esta declaración
VI		Algunos documentos citados
VII		Irregularidades en las solicitud internacional
VII		Observaciones relativas a la solicitud internacional

Fecha de presentación de la solicitud de examen preliminar internacional 23 de mayo de 2002 (23.05.02)	Fecha de terminación del presente informe 8 de Noviembre de 2002 (08.11.02)
Nombre y dirección postal de la administración encargada del examen preliminar internacional/JP Fax:	Funcionario autorizado Tel:

I. **Base del informe**

Respecto a los **elementos** de la solicitud internacional:*

☒ La solicitud internacional como se presentó originalmente
☐ la descripción:

páginas _____, como se presentaron originalmente
páginas _____, presentadas con la solicitud de examen
páginas _____, presentadas junto con la carta del _____.

☐ las reivindicaciones:

páginas _____, como se presentaron originalmente
páginas _____, como se modificaron (junto con cualquier declaración bajo el artículo 19)
páginas _____, presentadas con la solicitud de examen
páginas _____, presentadas junto con la carta del _____.

☐ los dibujos:

páginas _____, como se presentaron originalmente
páginas _____, presentadas con la solicitud de examen
páginas _____, presentadas junto con la carta del _____.

☐ la parte de listado de secuencias de la descripción:

páginas _____, como se presentaron originalmente
páginas _____, presentadas con la solicitud de examen
páginas _____, presentadas junto con la carta del _____.

2. Respecto al **lenguaje**, todos los elementos marcados anteriormente estuvieron disponibles o fueron enviados a la Administración en el lenguaje en que se presentó la solicitud internacional, a menos que se indique otra cosa en este punto.
Estos elementos estuvieron disponibles o fueron enviados a esta Administración en el siguiente lenguaje _____ el cual es:

☐ el lenguaje de la traducción enviada para propósitos de la búsqueda internacional (bajo Regla 23.1 (b)).
☐ el lenguaje de la publicación de la solicitud internacional (bajo Regla 48.3(b)).
☐ el lenguaje de la traducción entregada con propósitos del examen preliminar internacional (bajo Regla 55.2 y/o 55.3).

3. Respecto a cualquier **secuencia de nucleótido y/o amino ácidos** divulgada en la solicitud internacional, el examen preliminar internacional se llevó a cabo con base en el listado de secuencias:

☐ contenido en la solicitud internacional en forma escrita
☐ presentado junto con la solicitud internacional en forma legible por computador
☐ entregado posteriormente a esta Administración en forma legible por computador
☐ La declaración de que el listado de secuencias posteriormente entregado no va más allá de lo divulgado en la solicitud internacional originalmente presentada, ha sido entregada.
☐ La declaración de que la información grabada en la forma legible por computador es idéntica al listado de secuencias escrito que se ha entregado.

4. ☐ Las modificaciones han dado como resultado la cancelación de:

☐ la descripción, páginas _____,
☐ las reivindicaciones, Nos. _____,
☐ los dibujos, pág/fig _____.

5. ☐ Este reporte ha sido establecido como si (parte de) las modificaciones no se hubieran realizado, ya que éstas han sido consideradas como una ampliación de lo inicialmente divulgado como se indica en la Casilla Suplementaria (Regla 70.2(c)).**

** Las hojas de reemplazo que han sido entregadas a la Oficina receptora en respuesta a la invitación bajo el Artículo 14 se refieren en este informe como "originalmente presentadas" y no se anexan a este informe ya que ellas no contienen modificaciones (Regla 70.16 y 70.17).*
*** Cualquier hoja de reemplazo que contenga dichas modificaciones deberá ser referida bajo el punto 1 y anexada a este informe.*

V. Declaración motivada según el Artículo 35(2) en cuanto a la novedad, el nivel inventivo y la aplicación industrial.

1. Declaración

Novedad (N)	Reivindicaciones 1-18	SI
	Reivindicaciones _____	NO
Nivel inventivo (NI)	Reivindicaciones _____	SI
	Reivindicaciones 1-18	NO
Aplicación industrial (AI)	Reivindicaciones 1-18	SI
	Reivindicaciones _____	NO

2. Citas y explicaciones

Documento 1; JP, 9-328483, A (Sankyo Co., Ltd), 22 de Diciembre 1997 (22.12.97)

El documento 1 describe derivados de 2-isoxazolina herbicidamente activos con una estructura química muy similar a aquella de los compuestos de la fórmula general [I] de las reivindicaciones de la presente solicitud. Una persona versada en la materia podría fácilmente reemplazar algunos de los grupos sustituyentes de los derivados de isoxazolina dentro del alcance de similitud para presentar compuestos equivalentes herbicidamente activos.

Además, la especificación de la presente solicitud no describe de forma alguna cómo los compuestos de fórmula general [I] en las reivindicaciones de la presente solicitud exhiben un efecto herbicida excelente comparado con el de los compuestos descritos en el documento 1, debido a la diferencia en algunos de los grupos sustituyentes. Así, no puede considerarse que el efecto logrado por la materia objeto de las reivindicaciones de la presente solicitud sea tan sobresaliente que sea difícil predecirlo del arte previo.

Por lo tanto, la materia objeto de las reivindicaciones de la presente solicitud no parece involucrar una actividad inventiva respecto al documento 1.

57
57

108154

Derivado de isoxazolina y herbicida que lo contiene como ingrediente activo

Antecedentes de la invención

1. Campo de la invención

La presente invención se refiere a un nuevo derivado de isoxazolina y a un herbicida que contiene el derivado de isoxazolina como ingrediente activo.

2. Descripción del arte previo

Se informa acerca de la actividad herbicida de los derivados de isoxazolina en, por ejemplo, la JP-A-8-22558, la JP-A-9-328477 y la JP-A-9-328483. Sin embargo, el compuesto de la presente invención detallado más adelante no se describe en esta bibliografía.

Se desea que los herbicidas aplicados en cereales útiles (a) sean aplicables en la tierra o el follaje, (b) muestren un efecto herbicida

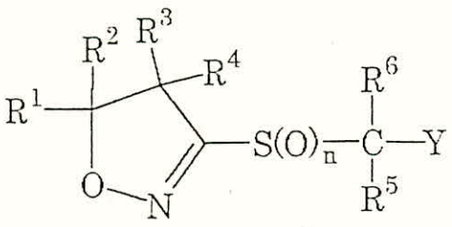
suficiente con una baja cantidad de ingrediente, y (c) muestren una alta selectividad entre los cultivos y las malezas. Al respecto, los compuestos descriptos en las bibliografías anteriores no son completamente satisfactorios.

Resumen de la invención

Respecto de la situación anterior, los presentes inventores realizaron un estudio del efecto herbicida y la selectividad entre el cultivo y la maleza de varios compuestos. Como resultado, los presentes inventores descubrieron que un nuevo derivado de la isoxazolina tiene un excelente efecto herbicida y una excelente selectividad entre los cultivos y las malezas. El hallazgo antes mencionado condujo a completar la presente invención.

La presente invención provee lo siguiente.

(1) Un derivado de isoxazolina representado por la siguiente fórmula general [I] o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo:



[I]

donde R^1 y R^2 pueden ser iguales o diferentes y cada uno es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1 a C10, un grupo cicloalquilo C3 a C8 o un grupo cicloalquil C3 a C8 alquilo C1 a C3 , o R^1 y R^2 pueden estar unidos entre sí para formar un anillo espiro C3 a C7 junto con los átomos de carbono a los que están unidos;

R^3 y R^4 pueden ser iguales o diferentes y cada uno es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1 a C10 o un grupo cicloalquilo C3 a C8; o R^3 y R^4 pueden estar unidos entre sí para formar un anillo espiro C3 a C7 junto con los átomos de carbono a los que están unidos; o R^1, R^2, R^3 y R^4 pueden formar un anillo de 5 a 8 miembros junto con los átomos de carbono a los que están unidos;

R^5 y R^6 pueden ser iguales o diferentes y cada uno es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1 a C10;

Y es un grupo heterocíclico aromático de 5 a 6 miembros o un grupo heterocíclico aromático condensado que tiene uno o más

heteroátomos seleccionados de un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre; el grupo heterocíclico puede estar sustituido con 0 a 6 grupos iguales o diferentes seleccionados del siguiente grupo sustituyente α; cuando el grupo heterocíclico está sustituido en las dos posiciones adyacentes con dos grupos alquilo, dos grupos alcoxi, un grupo alquilo y un grupo alcoxi, un grupo alquilo y un grupo alquiltio, un grupo alquilo y un grupo alquilsulfonilo, un grupo alquilo y un grupo monoalquilamino, o un grupo alquilo y un grupo dialquilamino, todos seleccionados del grupo sustituyente α, los dos grupos pueden formar, junto con los átomos a los que están unidos, un anillo de 5 a 8 miembros que puede estar sustituido con 1 a 4 átomos de halógeno; el heteroátomo del grupo heterocíclico, cuando es un átomo de nitrógeno, puede oxidarse para ser un N-óxido;

n es un número entero de 0 a 2.

[Grupo sustituyente α]

Grupo hidroxilo; grupo tiol; átomos de halógeno; grupos alquilo C1 a C10; grupos alquilo C1 a C10, cada uno monosustituido con un grupo seleccionado del siguiente grupo sustituyente β, grupos haloalquilo C1 a C4; grupos cicloalquilo C3 a C8; grupos alcoxi C1 a C10; grupos alcoxi C1

a C10, cada uno monosustituido con un grupo seleccionado del siguiente grupo sustituyente γ; grupos haloalcoxi C1 a C4; grupos cicloalquiloxi C3 a C8; grupos cicloalquil C3 a C8 alquiloxi C1 a C3; grupos alquiltio C1 a C10; grupos alquiltio C1 a C10, cada uno monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente γ; grupos haloalquiltio C1 a C4; grupos alquenilo C2 a C6; grupos alqueniloxi C2 a C6; grupos alquinilo C2 a C6; grupos alquiniloxi C2 a C6; grupos alquilsulfinilo C1 a C10; grupos alquilsulfinilo C1 a C10, cada uno monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente γ; grupos alquilsulfonilo C1 a C10; grupos alquilsulfonilo C1 a C10 cada uno monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente γ; grupos haloalquilsulfinilo C1 a C4; grupos alquilsulfoniloxi C1 a C10, cada uno monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente γ; grupos haloalquilsulfonilo C1 a C4; grupos alquilsulfoniloxi C1 a C10; grupos haloalquilsulfoniloxi C1 a C4; grupo fenilo opcionalmente sustituido; grupo fenoxi opcionalmente sustituido; grupo feniltio opcionalmente sustituido; grupos heterocíclicos aromáticos opcionalmente sustituidos; grupos oxi heterocíclicos aromáticos opcionalmente sustituidos; grupos tio heterocíclicos aromáticos opcionalmente sustituidos; grupos fenilsulfinilo opcionalmente sustituidos; grupos fenilsulfonilo opcionalmente sustituidos; grupos sulfonilo heterocíclicos aromáticos opcionalmente sustituidos; grupos fenilsulfoniloxi opcionalmente sustituidos; grupos acilo; grupos

haloalquilcarbonilo C1 a C4; grupo bencilcarbonilo opcionalmente sustituido; grupo benzoilo opcionalmente sustituido; grupo carboxilo; grupos alcoxicarbonilo C1 a C10; grupos benciloxicarbonilo opcionalmente sustituidos; grupo fenoxicarbonilo opcionalmente sustituido; grupo ciano; grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos iguales o diferentes seleccionados de grupos alquilo C1 a C10 y grupo fenilo opcionalmente sustituido); grupos aciloxi C1 a C6; grupos haloalquilcarboniloxi C1 a C4; grupo bencilcarboniloxi opcionalmente sustituido; grupo benzoiloxi opcionalmente sustituido; grupo nitro; y grupo amino (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos iguales o diferentes seleccionados de grupos alquilo C1 a C10, grupo fenilo opcionalmente sustituido, grupo acilo C1 a C6, grupos haloalquilcarbonilo C1 a C4, grupo bencilcarbonilo opcionalmente sustituido, grupo benzoilo opcionalmente sustituido, grupo alquilsulfonilo C1 a C10, grupos haloalquilsulfonilo C1 a C4, grupo bencilsulfonilo opcionalmente sustituido, y grupo fenilsulfonilo opcionalmente sustituido).

[Grupo sustituyente β]

Grupo hidroxilo; grupos cicloalquilo C3 a C8 que pueden estar sustituidos con un átomo de halógeno o un grupo alquilo; grupos alcoxi C1 a C10; grupos alquiltio C1 a C10; grupos alquilsulfonilo C1 a C10; grupos

alcoxicarbonilo C1 a C10; grupos haloalquenilo C2 a C6; grupo amino (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos iguales o diferentes seleccionados de grupos alquilo C1 a C10, grupo acilo C1 a C6; grupos haloalquilcarbonilo C1 a C4, grupos alquilsulfonilo C1 a C10 y grupos haloalquilsulfonilo C1 a C4); grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos alquilo C1 a C10 iguales o diferentes); grupo acilo C1 a C6; grupos haloalquilcarbonilo C1 a C4; grupos alcoxiimino C1 a C10; grupo ciano; grupo fenilo opcionalmente sustituido; y grupo fenoxi opcionalmente sustituido.

[Grupo sustituyente γ]

Grupos alcoxicarbonilo C1 a C10; grupo fenilo opcionalmente sustituido; grupos heterocíclicos aromáticos opcionalmente sustituidos; grupo ciano; y grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos alquilo C1 a C10 iguales o diferentes).

(2) Un derivado de isoxazolina de acuerdo con el punto (1), donde el grupo sustituyente α en el heterociclo que puede estar sustituido con 0 a 6 grupos iguales o diferentes, incluye grupo hidroxilo; átomos de halógeno; grupos alquilo C1 a C10; grupos alquilo C1 a C10, cada uno monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente β, grupos

haloalquilo C1 a C4; grupos cicloalquilo C3 a C8; grupos alcoxi C1 a C10; grupos alcoxi C1 a C10, cada uno monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente γ; grupos haloalcoxi C1 a C4; grupos cicloalquiloxi C3 a C8; grupos cicloalquil C3 a C8 alquiloxi C1 a C3; grupos alquiltio C1 a C10; grupos alquiltio C1 a C10, cada uno monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente γ; grupos haloalquiltio C1 a C4; grupos alquenilo C2 a C6; grupos alqueniloxi C2 a C6; grupos alquinilo C2 a C6; grupos alquiniloxi C2 a C6; grupos alquilsulfonilo C1 a C10; grupos haloalquilsulfonilo C1 a C4; grupo fenilo opcionalmente sustituido; grupo fenoxi opcionalmente sustituido; grupo feniltio opcionalmente sustituido; grupos heterocíclicos aromáticos opcionalmente sustituidos; grupos oxi heterocíclicos aromáticos opcionalmente sustituidos; grupos tio heterocíclicos aromáticos opcionalmente sustituidos; grupos fenilsulfonilo opcionalmente sustituidos; grupos sulfonilo heterocíclicos aromáticos opcionalmente sustituidos; grupo acilo C1 a C6; grupos haloalquilcarbonilo C1 a C4; grupo bencilcarbonilo opcionalmente sustituido; grupo benzoilo opcionalmente sustituido; grupo carboxilo; grupos alcoxicarbonilo C1 a C10; grupo ciano; grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos iguales o diferentes seleccionados de grupos alquilo C1 a C10 y grupo fenilo opcionalmente sustituido); grupo nitro; y grupo amino (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos iguales o diferentes

seleccionados de grupos alquilo C1 a C10, grupo fenilo opcionalmente sustituido, grupo acilo C1 a C6, grupos haloalquilcarbonilo C1 a C4, grupo bencilcarbonilo opcionalmente sustituido, grupo benzoilo opcionalmente sustituido, grupos alquilsulfonilo C1 a C10, grupos haloalquilsulfonilo C1 a C4, grupo bencilsulfonilo opcionalmente sustituido, y grupo fenilsulfonilo opcionalmente sustituido); cuando el grupo heterocíclico está sustituido en las dos posiciones adyacentes con dos grupos alquilo, dos grupos alcoxi, un grupo alquilo y un grupo alcoxi, un grupo alquilo y un grupo alquiltio, un grupo alquilo y un grupo alquilsulfonilo, un grupo alquilo y un grupo monoalquilamino, o un grupo alquilo y un grupo dialquilamino, todos seleccionados del grupo sustituyente α, los dos grupos pueden formar, junto con los átomos a los que están unidos, un anillo de 5 a 8 miembros que puede estar sustituido con 1 a 4 átomos de halógeno.

(3) Un derivado de isoxazolina de acuerdo con el punto (2), donde el grupo sustituyente α en el heterociclo que puede estar sustituido con 0 a 6 grupos iguales o diferentes, incluye átomos de halógeno; grupos alquilo C1 a C10; grupos haloalquilo C1 a C4; grupos alcoxi C1 a C10 alquilo C1 a C3; grupos cicloalquilo C3 a C8 que pueden estar sustituidos con un átomo de halógeno o un grupo alquilo; grupos alcoxi C1 a C10; grupos haloalcoxi C1 a C4; grupos cicloalquil C3 a C8 alquiloxi C1 a C3; grupo fenoxi opcionalmente sustituido; grupos alquiltio C1 a C10; grupos

alquilsulfonilo C1 a C10; grupos acilo; grupos haloalquilcarbonilo C1 a C4; grupos alcoxicarbonilo C1 a C10; grupo ciano y grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos alquilo C1 a C10 iguales o diferentes).

(4) Un derivado de isoxazolina de acuerdo con cualquiera de los puntos (1), (2) o (3), donde R^1 y R^2 pueden ser iguales o diferentes y cada uno es un grupo metilo o un grupo etilo; y R^3, R^4, R^5 y R^6 son, cada uno, un átomo de hidrógeno.

(5) Un derivado de isoxazolina de acuerdo con cualquiera de los puntos (1), (2), (3) o (4), donde Y es un grupo heterocíclico aromático de 5 ó 6 miembros que tiene un heteroátomo seleccionado de un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre.

(6) Un derivado de isoxazolina de acuerdo con el punto (5), donde Y es un grupo tienilo, un grupo pirazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo piridilo o un grupo pirimidinilo.

(7) Un derivado de isoxazolina de acuerdo con el punto (6), donde Y es un grupo tiofen-3-ilo, un grupo pirazol-4-ilo, un grupo pirazol-5-ilo, un grupo isoxazol-4-ilo, un grupo isotiazol-4-ilo, un grupo piridin-3-ilo o

un grupo pirimidin-5-ilo.

(8) Un derivado de isoxazolina de acuerdo con el punto (7), donde Y es un grupo tiofen-3-ilo y el anillo tiofeno está sustituido con el grupo sustituyente α en las posiciones 2 y 4.

(9) Un derivado de isoxazolina de acuerdo con el punto (7), donde Y es un grupo pirazol-4-ilo y el anillo pirazol está sustituido en las posiciones 3 y 5 con el grupo sustituyente α y en la posición 1 con un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1 a C10, un grupo alquilo C1 a C10 monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente β, un grupo haloalquilo C1 a C4, un grupo cicloalquilo C3 a C8, un grupo alquenilo C2 a C6, un grupo alquinilo C2 a C6, un grupo alquilsulfinilo C1 a C10, un grupo alquilsulfonilo C1 a C10, un grupo alquilsulfonilo C1 a C10 monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente γ, un grupo haloalquilsulfonilo C1 a C4, un grupo fenilo opcionalmente sustituido, un grupo heterocíclico aromático opcionalmente sustituido, un grupo fenilsulfonilo opcionalmente sustituido, un grupo sulfonilo heterocíclico aromático opcionalmente sustituido, un grupo acilo, un grupo haloalquilcarbonilo C1 a C4, un grupo bencilcarbonilo opcionalmente sustituido, un grupo benzoilo opcionalmente sustituido, un grupo alcoxicarbonilo C1 a C10, un grupo benciloxicarbonilo opcionalmente

sustituido, un grupo fenoxicarbonilo opcionalmente sustituido, un grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos iguales o diferentes seleccionados de grupos alquilo C1 a C10 y grupo fenilo opcionalmente sustituido), o un grupo amino (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos iguales o diferentes seleccionados de grupos alquilo C1 a C10, grupo fenilo opcionalmente sustituido, grupos acilo, grupos haloalquilcarbonilo C1 a C4, grupo bencilcarbonilo opcionalmente sustituido, grupo benzoilo opcionalmente sustituido, grupos alquilsulfonilo C1 a C10, grupos haloalquilsulfonilo C1 a C4, grupo bencilsulfonilo opcionalmente sustituido y grupo fenilsulfonilo opcionalmente sustituido).

(10) Un derivado de isoxazolina de acuerdo con el punto (7), donde Y es un grupo pirazol-5-ilo y el anillo pirazol está sustituido en la posición 4 con el grupo sustituyente α y en la posición 1 con un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1 a C10, un grupo alquilo C1 a C10 monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente β, un grupo haloalquilo C1 a C4, un grupo cicloalquilo C3 a C8, un grupo alquenilo C2 a C6, un grupo alquinilo C2 a C6, un grupo alquilsulfinilo C1 a C10, un grupo alquilsulfonilo C1 a C10, un grupo alquilsulfonilo C1 a C10 monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente γ, un grupo haloalquilsulfonilo C1 a C4, un grupo fenilo opcionalmente

sustituido, un grupo heterocíclico aromático opcionalmente sustituido, un grupo fenilsulfonilo opcionalmente sustituido, un grupo sulfonilo heterocíclico aromático opcionalmente sustituido, un grupo acilo, un grupo haloalquilcarbonilo C1 a C4, un grupo bencilcarbonilo opcionalmente sustituido, un grupo benzoilo opcionalmente sustituido, un grupo alcoxicarbonilo C1 a C10, un grupo benciloxicarbonilo opcionalmente sustituido, un grupo fenoxicarbonilo opcionalmente sustituido, un grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos iguales o diferentes seleccionados de grupos alquilo C1 a C10 y grupo fenilo opcionalmente sustituido), o un grupo amino (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos iguales o diferentes seleccionados de grupos alquilo C1 a C10, grupo fenilo opcionalmente sustituido, grupos acilo, grupos haloalquilcarbonilo C1 a C4, grupo bencilcarbonilo opcionalmente sustituido, grupo benzoilo opcionalmente sustituido, grupos alquilsulfonilo C1 a C10, grupos haloalquilsulfonilo C1 a C4, grupo bencilsulfonilo opcionalmente sustituido y grupo fenilsulfonilo opcionalmente sustituido).

(11) Un derivado de isoxazolina de acuerdo con el punto (7), donde Y es un grupo isoxazol-4-ilo y el anillo isoxazol está sustituido con el grupo sustituyente α en las posiciones 3 y 5.

(12) Un derivado de isoxazolina de acuerdo con el punto (7), donde Y es un grupo isotiazol-4-ilo y el anillo isotiazol está sustituido con el grupo sustituyente α en las posiciones 3 y 5.

(13) Un derivado de isoxazolina de acuerdo con el punto (7), donde Y es un grupo piridin-3-ilo y el anillo piridina está sustituido con el grupo sustituyente α en las posiciones 2 y 4.

(14) Un derivado de isoxazolina de acuerdo con el punto (7), donde Y es un grupo pirimidin-5-ilo y el anillo pirimidina está sustituido con el grupo sustituyente α en las posiciones 4 y 6.

(15) Un derivado de isoxazolina de acuerdo con cualquiera de los puntos (1) a (14), donde n es un número entero de 2.

(16) Un derivado de isoxazolina de acuerdo con cualquiera de los puntos (1) a (14), donde n es un número entero de 1.

(17) Un derivado de isoxazolina de acuerdo con cualquiera de los puntos (1) a (14), donde n es un número entero de 0.

(18) Un herbicida que contiene, como ingrediente activo, un

derivado de isoxazolina expuesto en cualquiera de los puntos (1) a (17) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

Descripción detallada de la invención

Las definiciones de los términos usados en la presente memoria se indican a continuación.

La expresión "C1 a C10", etc. indica que el sustituyente que aparece después de la expresión tiene 1 a 10 átomos de carbono en el caso de "C1 a C10".

Átomo de halógeno se refiere a un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un átomo de yodo.

Grupo alquilo C1 a C10 se refiere a un grupo alquilo de 1 a 10 átomos de carbono de cadena lineal o ramificada salvo que se indique lo contrario; y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo metilo, grupo etilo, grupo n-propilo, grupo isopropilo, grupo n-butilo, grupo isobutilo, grupo sec-butilo, grupo ter-butilo, grupo n-pentilo, grupo isopentilo, grupo neopentilo, grupo n-hexilo, grupo isohexilo, grupo 3,3-dimetilbutilo, grupo heptilo y grupo octilo.

Grupo cicloalquilo C3 a C8 se refiere a un grupo cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono; y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo ciclopropilo, grupo ciclobutilo, grupo ciclopentilo y grupo ciclohexilo.

Grupo cicloalquil C3 a C8 alquilo C1 a C3 (que pueden estar sustituidos con un átomo de halógeno o un grupo alquilo) se refiere, salvo que se especifique lo contrario, a un grupo alquilo C1 a C3 sustituido con un grupo cicloalquilo C3 a C8, que puede estar sustituido con 1 a 4 átomos de halógeno iguales o diferentes o un grupo alquilo C1 a C3; y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo ciclopropilmetilo, grupo 1-ciclopropiletilo, grupo 2-ciclopropiletilo, grupo 1-ciclopropilpropilo, grupo 2-ciclopropilpropilo, grupo 3-ciclopropilpropilo, grupo ciclobutilmetilo, grupo ciclopentilmetilo, grupo ciclohexilmetilo, grupo 2-clorociclopropilmetilo, grupo 2,2-diclorociclopropilmetilo, grupo 2-fluorociclopropilmetilo, grupo 2,2-difluorociclopropilmetilo, grupo 2-metilciclopropilmetilo, grupo 2,2-dimetilciclopropilmetilo y grupo 2-metilciclopropiletilo.

Grupo cicloalquil C3 a C8 alquilo C1 a C3 se refiere a un grupo alquilo de 1 a 3 átomos de carbono, sustituido con un grupo cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono; y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo

ciclopropilmetilo, grupo 1-ciclopropiletilo, grupo 2-ciclopropiletilo, grupo 1-ciclopropilpropilo, grupo 2-ciclopropilpropilo, grupo 3-ciclopropilpropilo, grupo ciclobutilmetilo, grupo ciclopentilmetilo y grupo ciclohexilmetilo.

Grupo haloalquilo C1 a C4 se refiere, salvo que se especifique lo contrario, a un grupo alquilo de 1 a 4 átomos de carbono de cadena lineal o ramificada, sustituido con 1 a 9 átomos de halógeno iguales o diferentes; y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo fluorometilo, grupo clorometilo, grupo bromometilo, grupo difluorometilo, grupo trifluorometilo, grupo 2,2-difluoroetilo, grupo 2,2,2-trifluoroetilo y grupo pentafluoroetilo.

Grupo alquenilo C2 a C6 se refiere a un grupo alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono de cadena lineal o ramificada; y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo etenilo, grupo 1-propenilo, grupo 2-propenilo, grupo isopropenilo, grupo 1-butenilo, grupo 2-butenilo, grupo 3-butenilo y grupo 2-pentenilo.

Grupo alquinilo C2 a C6 se refiere a un grupo alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono de cadena lineal o ramificada; y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo etinilo, grupo 2-propinilo, grupo 1-metil-2-propinilo, grupo 2-butinilo, grupo 3-butinilo y grupo 2-metil-3-butinilo.

Grupo haloalquenilo C2 a C6 se refiere, salvo que se especifique lo contrario, a un grupo alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono de cadena lineal o ramificada, sustituido con 1 a 4 átomos de halógeno iguales o diferentes; y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo 3-cloro-2-propenilo y grupo 2-cloro-2-propenilo.

Grupo alcoxi C1 a C10 se refiere a un grupo (alquil)-O- donde la parte alquilo tiene la definición que se mencionó más adelante; y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo metoxi, grupo etoxi, grupo n-propoxi, grupo isopropoxi, grupo ter-butoxi, grupo n-butoxi, grupo sec-butoxi y grupo isobutoxi.

Grupo haloalcoxi C1 a C4 se refiere a un grupo (haloalquil)-O- donde la parte haloalquilo tiene la definición que se mencionó más adelante; y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo difluorometoxi, grupo trifluorometoxi, grupo 2,2-difluoroetoxi y grupo 2,2,2-trifluoroetoxi.

Grupo cicloalquiloxi C3 a C8 se refiere a un grupo (cicloalquil)-O- donde la parte cicloalquilo tiene la definición que se mencionó más adelante; y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo ciclopropiloxi, grupo ciclobutiloxi, grupo ciclopentiloxi y grupo ciclohexiloxi.

Grupo cicloalquil C3 a C8 alquiloxi C1 a C3 se refiere a un grupo (cicloalquilalquil)-O- donde la parte cicloalquilalquilo tiene la definición que se mencionó más adelante; y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo ciclopropilmetoxi, grupo 1-ciclopropiletoxi, grupo 2-ciclopropiletoxi, grupo 1-ciclopropilpropoxi, grupo 2-ciclopropilpropoxi, grupo 3-ciclopropilpropoxi, grupo ciclobutilmetoxi, grupo ciclopentilmetoxi y grupo ciclohexilmetoxi.

Grupos alqueniloxi C2 a C6 y alquiniloxi C2 a C6 se refieren, respectivamente, a un grupo (alquenil)-O- y un grupo (alquinil)-O-, en cada uno de los cuales la parte alquenilo o alquinilo tiene la definición que se mencionó más adelante; y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo 2-propeniloxi y grupo 2-propiniloxi.

Grupo alcoxiimino C1 a C10 se refiere a un grupo (alcoxi)-N= donde la parte alcoxi tiene la definición que se mencionó más adelante; y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo metoxiimino y grupo etoxiimino.

Grupo alquiltio C1 a C10, grupo alquilsulfinilo C1 a C10 y grupo alquilsulfonilo C1 a C10 se refieren, respectivamente, a un grupo (alquil)-

S-, un grupo (alquil)-SO- y un grupo (alquil)-SO_2-, en cada uno de los cuales la parte alquilo tiene la definición que se mencionó más adelante; y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo metiltio, grupo etiltio, grupo n-propiltio, grupo isopropiltio, grupo metilsulfinilo, grupo metilsulfonilo, grupo etilsulfonilo, grupo n-propilsulfonilo y grupo isopropilsulfonilo.

Grupo alquilsulfoniloxi C1 a C10 se refiere a un grupo (alquilsulfonil)-O-, donde la parte alquilsulfonilo tiene la definición que se mencionó más adelante, y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo metilsulfoniloxi y grupo etilsulfoniloxi.

Grupo alcoxicarbonilo C1 a C10 se refiere a un grupo (alcoxi)-CO-, donde la parte alcoxi tiene la definición que se mencionó más adelante, y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo metoxicarbonilo, grupo etoxicarbonilo, grupo n-propoxicarbonilo y grupo isopropoxicarbonilo.

Grupo acrilo C1 a C6 se refiere a un grupo acilo alifático de 1 a 6 átomos de carbono de cadena lineal o ramificada, y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo formilo, grupo acetilo, grupo propionilo, grupo isopropionilo, grupo butirilo y grupo pivaloilo.

Grupo aciloxi C1 a C10 se refiere a un grupo (acil)-O-, donde la

parte acilo tiene la definición que se mencionó más adelante; y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo acetoxi, grupo propioniloxi, grupo isopropioniloxi y grupo pivalolioxi.

Grupo haloalquilcarbonilo C1 a C4, grupo haloalquiltio C1 a C4 y grupo haloalquilsulfonilo C1 a C4 se refieren, respectivamente, a un grupo (haloalquil)-CO-, un grupo (haloalquil)-S- y un grupo (haloalquil)-SO_2-, en cada uno de los cuales la parte haloalquilo tiene la definición que se mencionó más adelante; y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo cloroacetilo, grupo trifluoroacetilo, grupo pentafluoropropilo, grupo difluorometiltio, grupo trifluorometiltio, grupo clorometilsulfonilo, grupo difluorometilsulfonilo y grupo trifluorometilsulfonilo.

Grupo haloalquilcarboniloxi C1 a C4 y grupo haloalquilsulfoniloxi C1 a C4 se refieren, respectivamente, a un grupo (haloalquilcarbonil)-O- y a un grupo (haloalquilsulfonil)-O-, en cada uno de los cuales la parte haloalquilcarbonilo o la parte haloalquilsulfonilo tiene la definición que se mencionó más adelante; y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo cloroacetiloxi, grupo trifluoroacetiloxi, grupo clorometilsulfoniloxi y grupo trifluorometilsulfoniloxi.

"Opcionalmente sustituido" en grupo fenilo (opcionalmente

sustituido), grupo heterocíclico aromático (opcionalmente sustituido), grupo fenoxi (opcionalmente sustituido), grupo oxi heterocíclico (opcionalmente sustituido), grupo feniltio (opcionalmente sustituido), grupo tio heterocíclico aromático (opcionalmente sustituido), grupo fenilsulfonilo (opcionalmente sustituido), grupo fenilsulfoniloxi (opcionalmente sustituido), grupo sulfonilo heterocíclico aromático (opcionalmente sustituido), grupo bencilcarbonilo (opcionalmente sustituido), grupo bencilcarboniloxi (opcionalmente sustituido), grupo bencilsulfonilo (opcionalmente sustituido), grupo benzoilo (opcionalmente sustituido), grupo benzoiloxi (opcionalmente sustituido), grupo benciloxicarbonilo (opcionalmente sustituido) y grupo fenoxicarbonilo (opcionalmente sustituido), se refiere a estar opcionalmente sustituido con, por ejemplo, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1 a C10, un grupo haloalquilo C1 a C4, un grupo alcoxialquilo C1 a C10, un grupo alcoxi C1 a C10, un grupo alquiltio C1 a C10, un grupo alquilsulfonilo C1 a C10, un grupo acilo, un grupo alcoxicarbonilo C1 a C10, un grupo ciano, un grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos alquilo C1 a C10 iguales o diferentes), un grupo nitro o grupo amino (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos iguales o diferentes seleccionados de grupos alquilo C1 a C10, un grupo acilo C1 a C6, grupos haloalquilcarbonilo C1 a C4, grupos alquilsulfonilo C1 a C10 y grupos haloalquilsulfonilo C1 a C4).

Un grupo heterocíclico aromático de 5 a 6 miembros que tiene un heteroátomo seleccionado de un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre incluye, por ejemplo, grupo furilo, grupo tienilo, grupo pirrolilo, grupo pirazolilo, grupo isoxazolilo, grupo isotiazolilo, grupo oxazolilo, grupo tiazolilo, grupo imidazolilo, grupo piridilo, grupo piridazinilo, grupo pirimidinilo, grupo pirazinilo, grupo triazinilo, grupo triazolilo, grupo oxadiazolilo y grupo tiadiazolilo, cada uno de los cuales lleva 1 a 3 heteroátomos.

Grupo heterocíclico aromático fusionado se refiere a un grupo que tiene 1 a 3 heteroátomos seleccionados aleatoriamente de un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre; y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo benzofurilo, grupo benzotienilo, grupo indolilo, grupo benzoxazolilo, grupo benzotiazolilo, grupo benzimidazolilo, grupo benzisoxazolilo, grupo benzisotiazolilo, grupo indazolilo, grupo quinolilo, grupo isoquinolilo, grupo ftalazinilo, grupo quinoxalinilo, grupo quinazolinilo, grupo cinnolinilo y grupo benzotriazolilo.

Heterociclo aromático en un grupo heterocíclico aromático (opcionalmente sustituido), un grupo oxi heterocíclico aromático (opcionalmente sustituido), un grupo tio heterocíclico aromático

(opcionalmente sustituido) y un grupo sulfonilo heterocíclico aromático (opcionalmente sustituido), se refiere a un grupo de 5 a 6 miembros que tiene 1 a 3 heteroátomos seleccionados aleatoriamente de un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre; y aquí pueden mencionarse, por ejemplo, grupo furilo, grupo tienilo, grupo pirrolilo, grupo pirazolilo, grupo isoxazolilo, grupo isotiazolilo, grupo oxazolilo, grupo tiazolilo, grupo imidazolilo, grupo piridilo, grupo piridazinilo, grupo pirimidinilo, grupo pirazinilo, grupo triazinilo, grupo triazolilo, grupo oxadiazolilo y grupo tiadiazolilo.

Sal farmacéuticamente aceptable es una sal de un compuesto de la fórmula general [I] que tiene, en la estructura, un grupo hidroxilo, un grupo carboxilo, un grupo amino o similares, con una base metálica u orgánica o con un ácido mineral o un ácido orgánico. Como metal pueden mencionarse metales alcalinos como sodio, potasio y similares; y metales alcalinotérreos como magnesio, calcio y similares. Como base orgánica pueden mencionarse trietilamina, diisopropilamina, etc. Como ácidos minerales, pueden mencionarse ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, etc. Como ácido orgánico pueden mencionarse ácido acético, ácido metansulfónico, ácido p-toluensulfónico, etc.

En la fórmula general [I] antes mencionada, se prefiere que

R^1 y R^2 puedan ser iguales o diferentes y cada uno sea un grupo metilo o un grupo etilo;

R^3, R^4, R^5 y R^6 sean, cada uno, un átomo de hidrógeno;

n sea un número entero de 2; e

Y sea un grupo tiofen-3-ilo [las posiciones 2 y 4 del grupo están sustituidas con grupos iguales o diferentes seleccionados de átomos de halógeno, grupos alquilo, grupos haloalquilo, grupos alcoxialquilo, grupos cicloalquilo, grupos alcoxi, grupos haloalcoxi, grupos acilo, grupos haloalquilcarbonilo, grupos alcoxicarbonilo, grupo ciano y grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos alquilo iguales o diferentes)], o

un grupo pirazol-4-ilo [las posiciones 3 y 5 del grupo están sustituidas con grupos iguales o diferentes seleccionados de átomos de halógeno, grupos alquilo, grupos haloalquilo, grupos alcoxialquilo, grupos cicloalquilo, grupos alcoxi, grupos haloalcoxi, grupos cicloalquilalquiloxi, grupo fenoxi opcionalmente sustituido, grupos alquiltio, grupos alquilsulfonilo, grupos acilo, grupos haloalquilcarbonilo, grupos

alcoxicarbonilo, grupo ciano y grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos alquilo iguales o diferentes); la posición 1 está sustituida con átomo de hidrógeno, grupo alquilo, grupo alquilo monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente β, grupo haloalquilo, grupo cicloalquilo, grupo alquenilo, grupo alquinilo, grupo alquilsulfonilo, grupo alquilsulfonilo monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente γ, grupo haloalquilsulfonilo, grupo fenilo opcionalmente sustituido, grupo heterocíclico aromático opcionalmente sustituido, grupo fenilsulfonilo opcionalmente sustituido, grupo sulfonilo heterocíclico aromático opcionalmente sustituido, grupo acilo, grupo haloalquilcarbonilo, grupo bencilcarbonilo opcionalmente sustituido, grupo benzoilo opcionalmente sustituido, grupo alcoxicarbonilo, grupos benciloxicarbonilo opcionalmente sustituidos, grupo fenoxicarbonilo opcionalmente sustituido o grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos iguales o diferentes seleccionados de grupos alquilo y grupo fenilo opcionalmente sustituido)],

o

un grupo pirazol-5-ilo [la posición 4 del grupo está sustituida con átomo de halógeno, grupo alquilo, grupo haloalquilo, grupo alcoxialquilo, grupo haloalcoxi, grupo acilo, grupo haloalquilcarbonilo, grupo alcoxicarbonilo, grupo ciano o grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno

puede estar sustituido con grupos alquilo iguales o diferentes); la posición 1 está sustituido con átomo de hidrógeno, grupo alquilo, grupo alquilo monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente β, grupo haloalquilo, grupo cicloalquilo o grupo fenilo opcionalmente sustituido, o

un grupo isoxazol-4-ilo [las posiciones 3 y 5 del grupo está sustituida con grupos iguales o diferentes seleccionados de átomos de halógeno, grupos alquilo, grupos haloalquilo, grupos alcoxialquilo, grupos cicloalquilo, grupos alcoxi, grupos haloalcoxi, grupos alquiltio, grupos alquilsulfonilo, grupos acilo, grupos haloalquilcarbonilo, grupos alcoxicarbonilo, grupo ciano y grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos alquilo iguales o diferentes), o

un grupo isotiazol-4-ilo [las posiciones 3 y 5 del grupo están sustituidas con grupos iguales o diferentes seleccionados de átomos de halógeno, grupos alquilo, grupos haloalquilo, grupos alcoxialquilo, grupos cicloalquilo, grupos alcoxi, grupos haloalcoxi, grupo fenoxi opcionalmente sustituido, grupos alquiltio, grupos alquilsulfonilo, grupos acilo, grupos haloalquilcarbonilo, grupos alcoxicarbonilo, grupo ciano y grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos alquilo iguales o diferentes), o

un grupo piridin-3-ilo [las posiciones 2 y 4 del grupo están sustituidas con grupos iguales o diferentes seleccionados de átomos de halógeno, grupos alquilo, grupos haloalquilo, grupos alcoxialquilo, grupos cicloalquilo, grupos alcoxi, grupos haloalcoxi, grupos alquiltio, grupos alquilsulfonilo, grupos acilo, grupos haloalquilcarbonilo, grupos alcoxicarbonilo, grupo ciano y grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos alquilo iguales o diferentes), o

un grupo pirimidin-5-ilo [las posiciones 4 y 6 del grupo están sustituidas con grupos iguales o diferentes seleccionados de átomos de halógeno, grupos alquilo, grupos haloalquilo, grupos alcoxialquilo, grupos cicloalquilo, grupos alcoxi, grupos haloalcoxi, grupos alquiltio, grupos alquilsulfonilo, grupos acilo, grupos haloalquilcarbonilo, grupos alcoxicarbonilo, grupo ciano y grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos alquilo iguales o diferentes).

A continuación, en las tablas 1 a 10 se indican ejemplos representativos del presente compuesto representados por la fórmula general [I]. Sin embargo, el presente compuesto no está limitado a estos ejemplos.

Las siguientes expresiones abreviadas usadas en las tablas se

refieren a los siguientes grupos.

Me: grupo metilo Et: grupo etilo

Pr: grupo n-propilo Pr-i: grupo isopropilo

Pr-c: grupo ciclopropilo Bu: grupo n-butilo

Bu-i: grupo isobutilo Bu-s: grupo sec-butilo

Bu-t: grupo ter-butilo Bu-c: grupo ciclobutilo

Pen: grupo n-pentilo Pen-c: grupo ciclopentilo

Hex: grupo n-hexilo Hex-c: grupo ciclohexilo

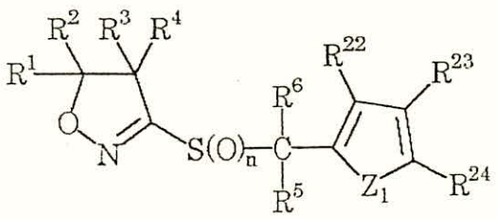
Ph: grupo fenilo

Por ejemplo, (4-Cl)Ph indica un grupo 4-clorofenilo, y 3-Hex indica un grupo 3-hexilo.

Cuando el presente compuesto contiene un grupo hidroxilo como

un sustituyente, pueden existir tautómeros de ceto-enol. Cualquiera de estos tautómeros y cualquier mezcla de estos tautómeros están incluidos en el presente compuesto.

Tabla 1



R^1	R^2	R^3	R^4	n	R^5	R^6	Z^1	R^{22}	R^{23}	R^{24}
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	H	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	H	H	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	H	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	H	H	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	OMe	H	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	OEt	H	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	OCH_2Ph	H	H
Me	Me	H	H	2	H	H	O	H	H	H
Me	Me	H	H	2	H	H	O	H	H	C(=O)Ome
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Me	H	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Me	C(=O)OMe	$CH_2C(=O)OMe$
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Me	C(=O)OEt	$CH_2C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Me	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	OMe	H	H

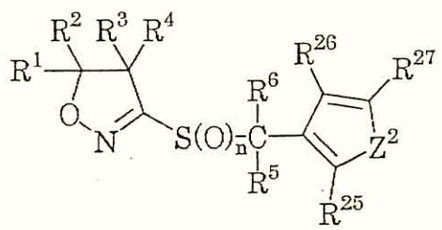
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	OEt	H	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	$OCHF_2$	H	H
H	H	H	H	2	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	H	H	H	2	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	H	Me	H	2	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Me	H	H	2	Me	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Me	H	H	2	Et	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Me	H	H	2	Me	Me	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Et	H	H	2	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Et	Et	H	H	2	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Pr	H	H	2	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	CH_2Pr-c	H	H	2	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
$-(CH_2)_2-$		H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
$-(CH_2)_3-$		H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
$-(CH_2)_4-$		H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
$-(CH_2)_5-$		H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	$-(CH_2)_3-$		H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	$-(CH_2)_4-$		H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	$-(CH_2)_5-$		H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	$-(CH_2)_6-$		H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	H	H	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	H	H	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	OMe	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	OEt	H	H

Me	Me	H	H	1	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	OCH_2Ph	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	O	H	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	O	H	H	C(=O)Ome
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	Me	H	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	Me	C(=O)OMe	$CH_2C(=O)OMe$
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	Me	C(=O)OEt	$CH_2C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	Me	Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	OMe	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	OEt	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	$OCHF_2$	H	H
H	H	H	H	1	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	H	H	H	1	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	H	Me	H	1	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Me	H	H	1	Me	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Me	H	H	1	Et	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Me	H	H	1	Me	Me	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Et	H	H	1	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Et	Et	H	H	1	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Pr	H	H	1	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	CH_2Pr-c	H	H	1	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
$-(CH_2)_2-$		H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
$-(CH_2)_3-$		H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
$-(CH_2)_4-$		H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
$-(CH_2)_5-$		H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	$-(CH_2)_3-$		H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	$-(CH_2)_4-$		H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	$-(CH_2)_5-$		H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl

H	-$(CH_2)_6$-		H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	H	H	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	OMe	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	OEt	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	OCH_2Ph	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	O	H	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	O	H	H	C(=O)Ome
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	Me	H	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	Me	C(=O)OMe	$CH_2C(=O)OMe$
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	Me	C(=O)OEt	$CH_2C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	Me	Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	OMe	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	OEt	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	$OCHF_2$	H	H
H	H	H	H	0	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	H	H	H	0	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	H	Me	H	0	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Me	H	H	0	Me	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Me	H	H	0	Et	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Me	H	H	0	Me	Me	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Et	H	H	0	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Et	Et	H	H	0	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	Pr	H	H	0	H	H	S	$OCHF_2$	H	H

Me	Pr-c	H	H	0	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
Me	CH_2Pr-c	H	H	0	H	H	S	$OCHF_2$	H	H
$-(CH_2)_2-$		H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
$-(CH_2)_3-$		H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
$-(CH_2)_4-$		H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
$-(CH_2)_5-$		H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	$-(CH_2)_3-$		H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	$-(CH_2)_4-$		H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	$-(CH_2)_5-$		H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	$-(CH_2)_6-$		H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Et	H	H	2	H	H	S	H	H	H
Me	Et	H	H	2	H	H	O	H	H	H
Me	Et	H	H	2	H	H	NH	H	H	H

Tabla 2



R^1	R^2	R^3	R^4	n	R^5	R^6	Z^2	R^{25}	R^{26}	R^{27}
Me	Me	H	H	2	H	H	S	H	H	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	H	OMe	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	NHMe	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	$N(Me)_2$	Me	H

Me	Me	H	H	2	H	H	S	NHC(=O)Me	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	NHC(=O)Ph	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	$NHSO_2Me$	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	$NHSO_2Ph$	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)OMe	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)OEt	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)OPh	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	CN	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)NHMe	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)Et	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)Pr-i	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)Pr	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	$C(=O)CF_3$	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=NOMe)Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Ph	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Ph	C(=NOMe)Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	OMe	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	OEt	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	OPr-i	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	OPr-i	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	C(=O)OMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	CN	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	C(=O)NHMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	$C(=O)N(Me)_2$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	C(=O)Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	C(=O)Et	Cl

Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	C(=O)Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	C(=O)Pr	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	$C(=O)CF_3$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	C(=NOMe)Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	O	H	H	H
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	H	Cl
H	H	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	H	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	H	Me	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	2	Me	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	2	Et	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	2	Me	Me	S	Cl	Cl	Cl
Me	Et	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Et	Et	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Pr	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	CH_2Pr-c	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
$-(CH_2)_2-$		H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
$-(CH_2)_3-$		H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
$-(CH_2)_4-$		H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
$-(CH_2)_5-$		H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	$-(CH_2)_3-$		H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	$-(CH_2)_4-$		H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	$-(CH_2)_5-$		H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	$-(CH_2)_6-$		H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	H	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	H	OMe	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl

Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	NHMe	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	$N(Me)_2$	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	NHC(=O)Me	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	NHC(=O)Ph	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	$NHSO_2Me$	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	$NHSO_2Ph$	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	C(=O)OMe	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	C(=O)OEt	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	C(=O)OPh	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	CN	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	C(=O)NHMe	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	C(=O)Et	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	C(=O)Pr-i	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	C(=O)Pr	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	$C(=O)CF_3$	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	C(=NOMe)Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Ph	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Ph	C(=NOMe)Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	OMe	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	OEt	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	OPr-i	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	OPr-i	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	C(=O)OMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	CN	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	C(=O)NHMe	Cl

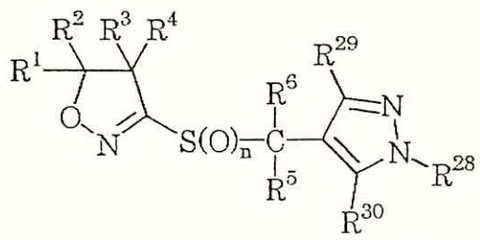
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	C(=O)N(Me)$_2$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	C(=O)Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	C(=O)Et	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	C(=O)Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	C(=O)Pr	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	C(=O)CF$_3$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	C(=NOMe)Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	O	H	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	O	Me	H	Cl
H	H	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	H	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	H	Me	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	1	Me	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	1	Et	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	1	Me	Me	S	Cl	Cl	Cl
Me	Et	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Et	Et	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Pr	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	CH_2Pr-c	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
-(CH_2)$_2$-		H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
-(CH_2)$_3$-		H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
-(CH_2)$_4$-		H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
-(CH_2)$_5$-		H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH_2)$_3$-		H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH_2)$_4$-		H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH_2)$_5$-		H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH_2)$_6$-		H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	H	H	H

Me	Me	H	H	0	H	H	S	H	OMe	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	NHMe	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	$N(Me)_2$	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	NHC(=O)Me	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	NHC(=O)Ph	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	$NHSO_2Me$	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	$NHSO_2Ph$	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=O)OMe	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=O)OEt	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=O)OPh	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	CN	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=O)NHMe	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=O)Et	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=O)Pr-i	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=O)Pr	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	$C(=O)CF_3$	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=NOMe)Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Ph	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Ph	C(=NOMe)Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	OMe	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	OEt	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	OPr-i	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	OPr-i	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	Me	Me

Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	C(=O)OMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	CN	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	C(=O)NHMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	$C(=O)N(Me)_2$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	C(=O)Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	C(=O)Et	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	C(=O)Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	C(=O)Pr	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	$C(=O)CF_3$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	C(=NOMe)Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	O	H	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	H	Cl
H	H	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	H	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	H	Me	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	0	Me	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	0	Et	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	0	Me	Me	S	Cl	Cl	Cl
Me	Et	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Et	Et	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Pr	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	CH_2Pr-c	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
$-(CH_2)_2-$		H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
$-(CH_2)_3-$		H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
$-(CH_2)_4-$		H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
$-(CH_2)_5-$		H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	$-(CH_2)_3-$		H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	$-(CH_2)_4-$		H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl

H	$-(CH_2)_5-$	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	$-(CH_2)_6-$	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl

Tabla 3



R^1	R^2	R^3	R^4	n	R^5	R^6	R^{29}	R^{28}	R^{30}
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	H	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	H	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	H	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	H	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CHF_2	H	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CHF_2	H	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	H	F
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	H	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	H	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	H	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	H	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	H	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	H	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	OMe

Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Et	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Me	Et
Me	Me	H	H	2	H	H	Et	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	H	2	H	H	Et	Me	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	Et
Me	Me	H	H	2	H	H	Et	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Me	Et
Me	Me	H	H	2	H	H	Et	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Me	Et
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Me	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Me	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Me	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Me	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Bu-t	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Me	Bu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	Bu-t	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	Bu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	Bu-t	Me	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	Bu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	Bu-t	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Me	Bu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	Bu-t	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Me	Bu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	CH_2OMe	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Me	CH_2OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CH_2OMe	Me	Cl

Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	CH_2OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CH_2OMe	Me	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	CH_2OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CH_2OMe	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Me	CH_2OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CH_2OMe	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Me	CH_2OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CHF_2	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Me	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	Br
Me	Me	H	H	2	H	H	Br	Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	I
Me	Me	H	H	2	H	H	I	Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OH
Me	Me	H	H	2	H	H	OH	Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OPr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OPr
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OBu-t

Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OBu-s
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OBu-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OBu
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(2-Pen)
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(3-Pen)
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OPen-n
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(2-Hex)
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(3-Hex)
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OHex-n
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OPen-c
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OHex-c
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OCH_2Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OCH_2Bu-c
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OCH_2Pen-c
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OCH_2Hex-c
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$OCH_2CH=CH_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$OCH_2C\equiv CH$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OCH_2CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	OCH_2CHF_2	Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OCH_2CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OCH_2CF_3	Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OCH_2CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$OCH_2C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$OCH(Me)C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$OCH_2C(=O)NH_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$OCH_2C(=O)NHMe$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$OCH_2C(=O)N(Me)_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OCH_2Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(2-Cl)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(2-Br)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(2-F)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(2-Me)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(2-OMe)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$O(2\text{-}NO_2)Ph$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(2-CN)Ph

Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(2-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(3-Cl)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(3-Br)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(3-F)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(3-Me)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(3-OMe)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(3-NO_2)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(3-CN)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(3-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(4-Cl)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(4-Br)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(4-F)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(4-Me)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(4-OMe)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(4-NO_2)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(4-CN)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(4-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OC(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OC(=O)Et
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OC(=O)CH_2Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OC(=O)CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OC(=O)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OSO_2Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OSO_2Et
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OSO_2CH_2Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OSO_2CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OSO_2Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SOMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SO_2Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SEt
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SOEt
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SO_2Et
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SPr
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SOPr
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SO_2Pr
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SPr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SOPr-i

Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SO_2Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SBu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SOBu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SO_2Bu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$SCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$SOCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SO_2CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SCF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$SOCF_3$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SO_2CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SPh
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SOh
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SO_2Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SCH_2Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$SOCH_2Ph$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SO_2CH_2Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$SCH_2C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$SOCH_2C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$SO_2CH_2C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$SCH(Me)C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$SOCH(Me)C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$SO_2CH(Me)C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$SCH_2C(=O)NH_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$SOCH_2C(=O)NH_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$SO_2CH_2C(=O)NH_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$SCH_2C(=O)NHMe$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$SOCH_2C(=O)NHMe$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$SO_2CH_2C(=O)NHMe$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$SCH_2C(=O)N(Me)_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$SOCH_2C(=O)N(Me)_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$SO_2CH_2C(=O)N(Me)_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	NH_2
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	NHMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$N(Me)_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$NHC(=O)Me$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$N(Me)C(=O)Me$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$NHSO_2Me$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$N(Me)SO_2Me$

Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$NHSO_2CHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$N(Me)SO_2CHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$NHSO_2CF_3$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$N(Me)SO_2CF_3$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	NHPh
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	C(=O)OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	C(=O)OPr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$C(=O)OCH_2Ph$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	C(=O)OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$C(=O)NH_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	C(=O)NHMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$C(=O)N(Me)_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	C(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$C(=O)CF_3$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$C(=O)CH_2Ph$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	C(=O)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	Et
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	Pr
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	CH_2OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_2CF_3	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	COOMe	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Me	COOMe
Me	Me	H	H	2	H	H	COOMe	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	COOMe

Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	SO_2Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Ph	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Ph	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Ph	Me	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	Ph	Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Ph	Me	Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Et	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Et	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Et	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Et	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Et	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Et	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Et	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Et	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Et	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Et	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Et	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Et	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Et	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Et	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Et	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Et	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Et	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Et	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	Et	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Et	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Et	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Et	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Et	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Et	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Et	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Pr-i	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Pr-i	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Pr-i	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Pr-i	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Pr-i	$OCHF_2$

Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Pr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Pr-i	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Pr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Pr-i	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Pr-i	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pr-i	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pr-i	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pr-i	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pr-i	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pr-i	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pr-i	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Pr	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Pr	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Pr	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Pr	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Pr	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Pr	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Pr	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Pr	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Pr	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Pr	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Pr	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Pr	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pr	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Pr	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pr	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Pr	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pr	OMe

Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Pr	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pr	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	Pr	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pr	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Pr	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pr	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Pr	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pr	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Pr	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Bu-t	F
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Bu-t	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Bu-t	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Bu-t	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Bu-t	H
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Bu-t	F
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Bu-t	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Bu-t	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Bu-t	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Bu-t	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	Bu-t	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Bu-t	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Bu-t	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Bu-t	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Bu-t	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Bu-s	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Bu-s	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Bu-i	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Bu-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Bu	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Bu	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	1-metilbutilo	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	1-metilbutilo	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	1-etilpropilo	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	1-etilpropilo	CF_3

Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	1-pentilo	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	1-pentilo	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	1-metilpentilo	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	1-metilpentilo	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	2-etilbutilo	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	2-etilbutilo	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	3,3-dimetilbutilo	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	3,3-dimetilbutilo	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	1-hexilo	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	1-hexilo	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	1-heptilo	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	1-heptilo	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	1-octilo	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	1-octilo	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pr-c	F
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pr-c	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pr-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pr-c	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pen-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Hex-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CH_2Pr-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	CH_2Pr-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	CH_2Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2Pr-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	CH_2Pr-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	CH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OH
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	CH_2Pr-c	CF_3

Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	CH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OPr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OPr
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OBu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OCH_2Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OCH_2Bu-c
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OPen-c
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	CH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	CH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	1-ciclopropiletilo	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	1-ciclopropiletilo	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2(2-metilciclopropilo)	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2(2-metilciclopropilo)	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2(2,2-dimetilciclopropilo)	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2(2,2-dimetilciclopropilo)	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2(2-clorociclopropilo)	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2(2-clorociclopropilo)	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2(2,2-diclorociclopropilo)	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2(2,2-diclorociclopropilo)	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2(2-fluorociclopropilo)	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2(2-fluorociclopropilo)	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2(2,2-difluorociclopropilo)	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2(2,2-difluorociclopropilo)	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Bu-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Pen-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Hex-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2CH_2Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2CH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2CH=CH_2$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2CH=CH_2$	CF_3

Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2CH=CHCl$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2CH=CHCl$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	$CH_2C\equiv CH$	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	$CH_2C\equiv CH$	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2CCH	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	$CH_2C\equiv CH$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2C\equiv CH$	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	$CH_2C\equiv CH$	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CHMeC\equiv CH$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CHMeC\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CMe$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2C\equiv CMe$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CHF_2	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	CHF_2	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CHF_2	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CHF_2	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	CHF_2	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CHF_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	CHF_2	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CHF_2	CN

Me	Me	H	H	2	H	H	CN	CHF_2	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CHF_2	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Et	CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CHF_2	Et
Me	Me	H	H	2	H	H	Et	CHF_2	Et
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CHF_2	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CHF_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	CHF_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CHF_2	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CHF_2	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CHF_2	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CHF_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CHF_2	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CHF_2	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2CF_3	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2CF_3	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2OH	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2OH	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CH_2OMe	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	CH_2OMe	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2OMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	CH_2OMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2OMe	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	CH_2OMe	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2OMe	F

Me	Me	H	H	2	H	H	F	CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2OMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2OMe	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2OMe	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2OMe	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2OMe	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2OMe	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2OEt	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2OEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2CH_2OH	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2CH_2OH	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2CH_2OMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2CH_2OEt	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2CH_2OEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2NHMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2NHMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2N(Me)_2$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2N(Me)_2$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2N(Me)C(=O)Me$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2N(Me)C(=O)Me$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2N(Me)C(=O)CF_3$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH2N(Me)C(=O)CF_3$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2N(Me)SO_2Me$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2N(Me)SO_2Me$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2N(Me)SO_2CHF_2$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2N(Me)SO_2CHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2N(Me)SO_2CF_3$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2N(Me)SO_2CF_3$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2SMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2SMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2SO_2Me	Cl

Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2SO_2Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2CH_2SMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2CH_2SMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2CH_2SO_2Me$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2CH_2SO_2Me$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2CN	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2CN	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)OMe$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2C(=O)OMe$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)OEt$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2C(=O)OEt$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH(Me)C(=O)OMe$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH(Me)C(=O)OMe$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$C(Me)_2C(=O)OMe$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$C(Me)_2C(=O)OMe$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)NH_2$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2C(=O)NH_2$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)NHMe$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2C(=O)NHMe$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)N(Me)_2$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2C(=O)N(Me)_2$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)Me$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2C(=O)Me$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C(=NOMe)Me$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2C(=NOMe)Me$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)CF_3$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2C(=O)CF_3$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2CH_2C(=O)Me$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2CH_2C(=O)Me$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Ph	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Ph	F
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Ph	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Ph	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	Et	Ph	F
Me	Me	H	H	2	H	H	Et	Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Et	Ph	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	Et	Ph	CN

Me	Me	H	H	2	H	H	Pr	Ph	F
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr	Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr	Ph	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr	Ph	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Ph	F
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Ph	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Ph	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	Bu-t	Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CH_2OMe	Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Ph	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CHF_2	Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	H
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	Et
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	F
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OH
Me	Me	H	H	2	H	H	OH	Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OPr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OPr
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OBu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OCH_2Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	$OCH_2CH=CH_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	$OCH_2C\equiv CH$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Ph	CF_3

Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OCH_2CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OCH_2CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	$OCH_2C(=O)OMe$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OCH(Me)C(=O)OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	$OC(Me)_2C(=O)OMe$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OC(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OC(=O)Et
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	$OC(=O)CH_2Ph$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	$OC(=O)CF_3$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OC(=O)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OSO_2Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OSO_2Et
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OSO_2CH_2Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OSO_2CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OSO_2Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	SMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	SOMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	SO_2Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	SEt
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	SOEt
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	SO_2Et
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	SPr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	SOPr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	SO_2Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	SPr
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	SOPr
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	SO_2Pr
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	SBu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	SOBu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	SO_2Bu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	$SCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	$SOCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	SO_2CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	NH_2
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	NHMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	$N(Me)_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	N(Me)C(=O)Me

Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	$NHSO_2Me$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	$N(Me)SO_2Me$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	$NHSO_2CF_3$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	$N(Me)SO_2CF_3$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	NHPh
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	C(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	C(=O)OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	$C(=O)NH_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	C(=O)NHMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	$C(=O)N(Me)_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	Imidazol-1-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	Pirazol-1-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	1,2,4-triazol-1-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	1,2,4-triazol-4-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	Tetrazol-1-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	Tetrazol-5-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)oxi
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)sulfonilo
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_2CF_3	Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(2-Cl)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(2-F)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(2-OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(2-Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$(2-NO_2)Ph$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(2-CN)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(2-C(=O)Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(2-C(=O)OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(2-C(=O)OEt)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(2-C(=O)OPr-i)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$(2-C(=O)NH_2)Ph$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(2-C(=O)NHMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$(2-C(=O)NMe_2)Ph$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(3-Cl)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(3-F)Ph	Cl

Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(3-OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(3-Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(3-NO_2)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(3-CN)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(3-C(=O)Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(3-C(=O)OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(3-C(=O)OEt)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(3-C(=O)OPr-i)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(3-C(=O)NH_2)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(3-C(=O)NHMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(3-C(=O)NMe_2)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(4-Cl)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(4-F)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(4-OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(4-Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(4-NO_2)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(4-CN)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(4-C(=O)Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(4-C(=O)OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(4-C(=O)OEt)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(4-C(=O)OPr-i)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(4-C(=O)NH_2)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(4-C(=O)NHMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(4-C(=O)NMe_2)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pirmidin-2-il	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	4,6-dimetoxipirmidin-2-ilo	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	tiofen-2-ilo	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Furan-2-ilo	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	SO_2Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	SO_2Et	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	SO_2Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	SO_2CH_2Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	SO_2CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	SO_2CF_3	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	SO_2Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	C(=O)Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	C(=O)Et	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	C(=O)Pr-i	Cl

Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	C(=O)Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	C(=O)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$C(=O)CH_2Ph$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$C(=O)CH_2Cl$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$C(=O)CHCl_2$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$C(=O)CF_3$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	C(=O)OMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	C(=O)OPh	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$C(=O)OCH_2Ph$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	C(=O)NHMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$C(=O)N(Me)_2$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	C(=O)NHPh	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	NH_2	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$-(CH_2)_2O-$	
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$-(CH_2)_3O-$	
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$-(CH_2)_3S-$	
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$-(CH_2)_3SO_2-$	
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$-(CH_2)_2O-$	
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$-(CH_2)_3O-$	
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$-(CH_2)_3S-$	
Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$-(CH_2)_3SO_2-$	
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	$-(CH_2)_4-$	
Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	$-(CH_2)_4-$	
H	H	H	H	2	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	H	H	H	2	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	H	Me	H	2	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	Me	Me	H	2	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	Me	H	CF_3	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	Et	H	CF_3	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	CF_3	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	Me	Me	CF_3	Me	Cl
Me	Et	H	H	2	H	H	CF_3	Me	Cl
Et	Et	H	H	2	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	Pr	H	H	2	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	CH_2Pr-c	H	H	2	H	H	CF_3	Me	Cl
$-(CH_2)_2-$		H	H	2	H	H	CF_3	Me	Cl

-$(CH_2)_3$-		H	H	2	H	H	CF_3	Me	Cl
-$(CH_2)_4$-		H	H	2	H	H	CF_3	Me	Cl
-$(CH_2)_5$-		H	H	2	H	H	CF_3	Me	Cl
H	-$(CH_2)_3$-		H	2	H	H	CF_3	Me	Cl
H	-$(CH_2)_4$-		H	2	H	H	CF_3	Me	Cl
H	-$(CH_2)_5$-		H	2	H	H	CF_3	Me	Cl
H	-$(CH_2)_6$-		H	2	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	H	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	H	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CHF_2	H	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	H	F
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	H	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	H	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	H	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	H	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	H	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	H	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Et	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	H	1	H	H	Pr-i	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Me	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	Bu-t	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Me	Bu-t
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CHF_2	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Me	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Me	CF_3

Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	F
Me	Me	H	H	1	H	H	F	Me	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OH
Me	Me	H	H	1	H	H	OH	Me	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	Me	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	Me	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OPr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OPr
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OBu-t
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OBu-s
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OBu-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OBu
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(2-Pen)
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(3-Pen)
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OPen-n
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(2-Hex)
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(3-Hex)
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OHex-n
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OPen-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OHex-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OCH_2Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OCH_2Bu-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OCH_2Pen-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OCH_2Hex-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$OCH_2CH=CH_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$OCH_2C\equiv CH$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	Me	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OCH_2CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	OCH_2CHF_2	Me	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OCH_2CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OCH_2CF_3	Me	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OCH_2CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$OCH_2C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$OCH(Me)C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$OCH_2C(=O)NH_2$

Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$OCH_2C(=O)NHMe$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$OCH_2C(=O)N(Me)_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OCH_2Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(2-Cl)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(2-Br)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(2-F)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(2-Me)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(2-OMe)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$O(2\text{-}NO_2)Ph$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(2-CN)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(2-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(3-Cl)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(3-Br)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(3-F)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(3-Me)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(3-OMe)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$O(3\text{-}NO_2)Ph$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(3-CN)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(3-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(4-Cl)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(4-Br)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(4-F)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(4-Me)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(4-OMe)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$O(4\text{-}NO_2)Ph$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(4-CN)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	O(4-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OC(=O)Me
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OC(=O)Et
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$OC(=O)CH_2Ph$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$OC(=O)CF_3$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OC(=O)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OSO_2Me
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OSO_2Et
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OSO_2CH_2Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OSO_2CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	OSO_2Ph

Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	SMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	SO_2Me
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	SEt
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	SO_2Et
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	SPr
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	SO_2Pr
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	SPr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	SO_2Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	SBu-t
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	SO_2Bu-t
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$SCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	SO_2CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	SCF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	SO_2CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	SPh
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	SO_2Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	SCH_2Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	SO_2CH_2Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$SCH_2C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$SO_2CH_2C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$SCH(Me)C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$SO_2CH(Me)C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$SCH_2C(=O)NH_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$SO_2CH_2C(=O)NH_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$SCH_2C(=O)NHMe$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$SO_2CH_2C(=O)NHMe$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$SCH_2C(=O)N(Me)_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$SO_2CH_2C(=O)N(Me)_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	NH_2
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	NHMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$N(Me)_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$NHSO_2Me$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$N(Me)SO_2Me$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$NHSO_2CHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$N(Me)SO_2CHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$NHSO_2CF_3$

Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$N(Me)SO_2CF_3$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	NHPh
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CN	Me	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	C(=O)OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$C(=O)OCH_2Ph$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	C(=O)OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$C(=O)NH_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	C(=O)NHMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$C(=O)N(Me)_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	C(=O)Me
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$C(=O)CF_3$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	$C(=O)CH_2Ph$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	C(=O)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Me	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	Et
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	Pr
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	CH_2OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Me	Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_2CF_3	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Ph	Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Ph	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Ph	Me	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	Ph	Me	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Ph	Me	Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	Et	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Et	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	Et	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Et	F
Me	Me	H	H	1	H	H	F	Et	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Et	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Et	CF_3

Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Et	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	Et	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Et	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	Et	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Et	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	Et	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Et	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CN	Et	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Et	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Et	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Pr-i	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	Pr-i	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Pr-i	F
Me	Me	H	H	1	H	H	F	Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Pr-i	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Pr-i	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Pr-i	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Pr-i	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CN	Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Pr-i	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Pr	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	Pr	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Pr	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	Pr	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Pr	F
Me	Me	H	H	1	H	H	F	Pr	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Pr	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Pr	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Pr	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	Pr	CF_3

Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Pr	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	Pr	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Pr	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	Pr	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Pr	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CN	Pr	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Pr	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Pr	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	Bu-t	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Bu-t	H
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Bu-t	F
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Bu-t	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Bu-t	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	Bu-t	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Bu-t	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	Bu-t	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Bu-t	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Bu-t	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Bu-t	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Bu-t	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Bu-s	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Bu-s	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Bu-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Bu-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Bu	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Bu	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	1-metilbutilo	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	1-metilbutilo	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	1-etilpropilo	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	1-etilpropilo	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	1-pentilo	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	1-pentilo	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	1-metilpentilo	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	1-metilpentilo	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	2-etilbutilo	Cl

Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	2-etilbutilo	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	3,3-dimetilbutilo	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	3,3-dimetilbutilo	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	1-hexilo	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	1-hexilo	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	1-heptilo	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	1-heptilo	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	1-octilo	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	1-octilo	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Pen-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Hex-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	CH_2Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2Pr-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	CH_2Pr-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	F
Me	Me	H	H	1	H	H	F	CH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OH
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	CH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	CH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OPr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OPr
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OBu-t
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OCH_2Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OCH_2Bu-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OPen-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	CH_2Pr-c	CF_3

Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CN	CH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	CH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	1-ciclopropiletilo	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	1-ciclopropiletilo	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2(2-metil-ciclopropilo)	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2(2-metil-ciclopropilo)	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2(2,2-dimetil-ciclopropilo)	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2(2,2-dimetil-ciclopropilo)	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2(2-cloro-ciclopropilo)	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2(2-cloro-ciclopropilo)	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2(2,2-dicloro-ciclopropilo)	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2(2,2-dicloro-ciclopropilo)	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2(2-fluoro-ciclopropilo)	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2(2-fluoro-ciclopropilo)	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2(2,2-difluoro-ciclopropilo)	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2(2,2-difluoro-ciclopropilo)	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2Bu-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2Pen-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2Hex-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2CH_2Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2CH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2CH=CH_2$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH_2CH=CH_2$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2CH=CHCl$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH_2CH=CHCl$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH_2C\equiv CH$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	$CH_2C\equiv CH$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH_2C\equiv CH$	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	$CH_2C\equiv CH$	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	F

Me	Me	H	H	1	H	H	F	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CN	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CHMeC\equiv CH$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CHMeC\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CMe$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH_2C\equiv CMe$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CHF_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	CHF_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CHF_2	F
Me	Me	H	H	1	H	H	F	CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CHF_2	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CHF_2	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CHF_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CHF_2	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CN	CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CHF_2	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	CHF_2	Cl

Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CHF_2	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Et	CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CHF_2	Et
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2CF_3	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2CF_3	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2OH	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2OH	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2OMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	CH_2OMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2OMe	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	CH_2OMe	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2OMe	F
Me	Me	H	H	1	H	H	F	CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2OMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2OMe	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2OMe	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2OMe	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2OMe	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CN	CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2OMe	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2OEt	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2OEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2CH_2OH	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2CH_2OH	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2CH_2OMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2CH_2OEt	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2CH_2OEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2NHMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2NHMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2N(Me)_2$	Cl

Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH_2N(Me)_2$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2N(Me)C(=O)Me$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH_2N(Me)C(=O)Me$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2N(Me)C(=O)CF_3$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH2N(Me)C(=O)CF_3$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2N(Me)SO_2Me$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH_2N(Me)SO_2Me$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2N(Me)SO_2CHF_2$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH_2N(Me)SO_2CHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2N(Me)SO_2CF_3$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH_2N(Me)SO_2CF_3$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2SMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2SMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2SO_2Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2SO_2Me	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2CH_2SMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2CH_2SMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2CH_2SO_2Me$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH_2CH_2SO_2Me$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	CH_2CN	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH_2CN	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)OMe$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH_2C(=O)OMe$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)OEt$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH_2C(=O)OEt$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH(Me)C(=O)OMe$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH(Me)C(=O)OMe$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$C(Me)_2C(=O)OMe$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$C(Me)_2C(=O)OMe$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)NH_2$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH_2C(=O)NH_2$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)NHMe$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH_2C(=O)NHMe$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)N(Me)_2$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH_2C(=O)N(Me)_2$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)Me$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH_2C(=O)Me$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2C(=NOMe)Me$	Cl

Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH_2C(=NOMe)Me$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)CF_3$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH_2C(=O)CF_3$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$CH_2CH_2C(=O)Me$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$CH_2CH_2C(=O)Me$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Ph	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Et	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Pr	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Pr-i	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Bu-t	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CH_2OMe	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	Ph	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CHF_2	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	H
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	Et
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	F
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	OH
Me	Me	H	H	1	H	H	OH	Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	OPr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	OPr
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	OBu-t
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	OCH_2Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	$OCH_2CH=CH_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	$OCH_2C\equiv CH$

Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	OCH_2CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	OCH_2CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	$OCH_2C(=O)OMe$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	$OCH(Me)C(=O)OMe$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	$OC(Me)_2C(=O)OMe$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	$OC(=O)Me$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	$OC(=O)Et$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	$OC(=O)CH_2Ph$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	$OC(=O)CF_3$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	$OC(=O)Ph$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	OSO_2Me
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	OSO_2Et
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	OSO_2CH_2Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	OSO_2CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	OSO_2Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	SMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	SO_2Me
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	SEt
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	SO_2Et
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	SPr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	SO_2Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	SPr
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	SO_2Pr
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	SBu-t
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	SO_2Bu-t
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	$SCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	SO_2CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	NH_2
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	NHMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	$N(Me)_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	$NHC(=O)Me$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	$N(Me)C(=O)Me$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	$NHSO_2Me$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	$N(Me)SO_2Me$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	$NHSO_2CF_3$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	$N(Me)SO_2CF_3$

Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	NHPh
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	C(=O)Me
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	C(=O)OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	$C(=O)NH_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	C(=O)NHMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	$C(=O)N(Me)_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	Imidazol-1-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	Pirazol-1-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	1,2,4-triazol-1-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	1,2,4-triazol-4-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	Tetrazol-1-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	Tetrazol-5-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)oxi
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Ph	(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)sulfonilo
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_2CF_3	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(2-Cl)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(2-F)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(2-OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(2-Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$(2\text{-}NO_2)Ph$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(2-CN)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(2-C(=O)Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(2-C(=O)OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(2-C(=O)OEt)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(2-C(=O)OPr-i)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$(2\text{-}C(=O)NH_2)Ph$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(2-C(=O)NHMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$(2\text{-}C(=O)NMe_2)Ph$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(3-Cl)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(3-F)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(3-OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(3-Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$(3\text{-}NO_2)Ph$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(3-CN)Ph	Cl

Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(3-C(=O)Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(3-C(=O)OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(3-C(=O)OEt)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(3-C(=O)OPr-i)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(3-C(=O)NH_2)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(3-C(=O)NHMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(3-C(=O)NMe_2)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(4-Cl)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(4-F)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(4-OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(4-Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(4-NO_2)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(4-CN)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(4-C(=O)Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(4-C(=O)OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(4-C(=O)OEt)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(4-C(=O)OPr-i)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(4-C(=O)NH_2)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(4-C(=O)NHMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	(4-C(=O)NMe_2)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Pirmidin-2-ilo	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	4,6-dimetoxipirmidin-2-ilo	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Tiofen-2-ilo	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	Furan-2-ilo	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	SO_2Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	SO_2Et	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	SO_2Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	SO_2CH_2Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	SO_2CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	SO_2CF_3	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	SO_2Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	C(=O)Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	C(=O)Et	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	C(=O)Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	C(=O)Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	C(=O)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	C(=O)CH_2Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	C(=O)CH_2Cl	Cl

Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$C(=O)CHCl_2$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$C(=O)CF_3$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	C(=O)OMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	C(=O)OPh	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$C(=O)OCH_2Ph$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	C(=O)NHMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$C(=O)N(Me)_2$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	C(=O)NHPh	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	NH_2	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$-(CH_2)_2O-$	
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$-(CH_2)_3O-$	
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$-(CH_2)_3S-$	
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	$-(CH_2)_3SO_2-$	
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$-(CH_2)_2O-$	
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$-(CH_2)_3O-$	
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$-(CH_2)_3S-$	
Me	Me	H	H	1	H	H	CF_3	$-(CH_2)_3SO_2-$	
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	$-(CH_2)_4-$	
Me	Me	H	H	1	H	H	$OCHF_2$	$-(CH_2)_4-$	
H	H	H	H	1	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	H	H	H	1	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	H	Me	H	1	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	Me	Me	H	1	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	Me	H	CF_3	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	Et	H	CF_3	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	CF_3	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	Me	Me	CF_3	Me	Cl
Me	Et	H	H	1	H	H	CF_3	Me	Cl
Et	Et	H	H	1	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	Pr	H	H	1	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	CH_2Pr-c	H	H	1	H	H	CF_3	Me	Cl
$-(CH_2)_2-$		H	H	1	H	H	CF_3	Me	Cl
$-(CH_2)_3-$		H	H	1	H	H	CF_3	Me	Cl
$-(CH_2)_4-$		H	H	1	H	H	CF_3	Me	Cl
$-(CH_2)_5-$		H	H	1	H	H	CF_3	Me	Cl
H	$-(CH_2)_3-$		H	1	H	H	CF_3	Me	Cl

H	-$(CH_2)_4$-		H	1	H	H	CF_3	Me	Cl
H	-$(CH_2)_5$-		H	1	H	H	CF_3	Me	Cl
H	-$(CH_2)_6$-		H	1	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	H	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	H	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CHF_2	H	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	H	F
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	H	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	H	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	H	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	H	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	H	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	H	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Et	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	H	0	H	H	Pr-i	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Me	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	Bu-t	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Me	Bu-t
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CHF_2	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Me	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Me	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	F
Me	Me	H	H	0	H	H	F	Me	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OH
Me	Me	H	H	0	H	H	OH	Me	CF_3

Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Me	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	Me	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OPr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OPr
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OBu-t
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OBu-s
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OBu-i
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OBu
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(2-Pen)
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(3-Pen)
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OPen-n
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(2-Hex)
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(3-Hex)
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OHex-n
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OPen-c
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OHex-c
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OCH_2Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OCH_2Bu-c
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OCH_2Pen-c
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OCH_2Hex-c
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$OCH_2CH=CH_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OCH_2C^*CH
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	Me	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OCH_2CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	OCH_2CHF_2	Me	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OCH_2CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OCH_2CF_3	Me	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OCH_2CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$OCH_2C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$OCH(Me)C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$OCH_2C(=O)NH_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$OCH_2C(=O)NHMe$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$OCH_2C(=O)N(Me)_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OCH_2Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OPh

Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(2-Cl)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(2-Br)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(2-F)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(2-Me)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(2-OMe)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(2-NO_2)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(2-CN)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(2-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(3-Cl)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(3-Br)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(3-F)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(3-Me)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(3-OMe)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(3-NO_2)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(3-CN)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(3-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(4-Cl)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(4-Br)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(4-F)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(4-Me)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(4-OMe)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(4-NO_2)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(4-CN)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(4-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OC(=O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OC(=O)Et
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OC(=O)CH_2Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OC(=O)CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OC(=O)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OSO_2Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OSO_2Et
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OSO_2CH_2Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OSO_2CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OSO_2Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	SMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	SO_2Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	SEt
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	SO_2Et

Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	SPr
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	SO_2Pr
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	SPr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	SO_2Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	SBu-t
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	SO_2Bu-t
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$SCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	SO_2CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	SCF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	SO_2CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	SPh
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	SO_2Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	SCH_2Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	SO_2CH_2Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$SCH_2C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$SO_2CH_2C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$SCH(Me)C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$SO_2CH(Me)C(=O)OEt$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$SCH_2C(=O)NH_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$SO_2CH_2C(=O)NH_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$SCH_2C(=O)NHMe$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$SO_2CH_2C(=O)NHMe$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$SCH_2C(=O)N(Me)_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$SO_2CH_2C(=O)N(Me)_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	NH_2
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	NHMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$N(Me)_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$NHSO_2Me$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$N(Me)SO_2Me$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$NHSO_2CHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$N(Me)SO_2CHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$NHSO_2CF_3$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$N(Me)SO_2CF_3$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	NHPh
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	CN

Me	Me	H	H	0	H	H	CN	Me	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	C(=O)OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$C(=O)OCH_2Ph$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	C(=O)OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$C(=O)NH_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	C(=O)NHMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$C(=O)N(Me)_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	C(=O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$C(=O)CF_3$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	$C(=O)CH_2Ph$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	C(=O)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Me	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	Et
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	Pr
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	CH_2OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_2CF_3	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Ph	Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Ph	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Ph	Me	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	Ph	Me	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Ph	Me	Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	Et	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Et	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	Et	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Et	F
Me	Me	H	H	0	H	H	F	Et	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Et	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Et	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Et	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Et	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Et	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	Et	CF_3

Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Et	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	Et	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Et	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CN	Et	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Et	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Et	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Pr-i	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	Pr-i	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Pr-i	F
Me	Me	H	H	0	H	H	F	Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Pr-i	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Pr-i	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Pr-i	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Pr-i	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CN	Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Pr-i	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Pr	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	Pr	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Pr	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	Pr	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Pr	F
Me	Me	H	H	0	H	H	F	Pr	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Pr	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Pr	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Pr	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Pr	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Pr	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	Pr	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Pr	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	Pr	CF_3

Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Pr	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CN	Pr	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Pr	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Pr	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	Bu-t	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Bu-t	H
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Bu-t	F
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Bu-t	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Bu-t	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Bu-t	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Bu-t	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	Bu-t	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Bu-t	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Bu-t	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Bu-t	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Bu-t	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Bu-s	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Bu-s	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Bu-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Bu-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Bu	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Bu	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	1-metilbutilo	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	1-metilbutilo	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	1-etilpropilo	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	1-etilpropilo	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	1-pentilo	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	1-pentilo	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	1-metilpentilo	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	1-metilpentilo	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	2-etilbutilo	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	2-etilbutilo	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	3,3-dimetilbutilo	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	3,3-dimetilbutilo	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	1-hexilo	Cl

Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	1-hexilo	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	1-heptilo	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	1-heptilo	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	1-octilo	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	1-octilo	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Pen-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Hex-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	CH_2Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2Pr-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	CH_2Pr-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	F
Me	Me	H	H	0	H	H	F	CH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OH
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	CH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	CH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OPr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OPr
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OBu-t
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OCH_2Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OCH_2Bu-c
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	OPen-c
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	CH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CN	CH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	CH_2Pr-c	CF_3

Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	1-ciclopropiletilo	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	1-ciclopropiletilo	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2(2-metil-ciclopropilo)	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2(2-metil-ciclopropilo)	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2(2,2-dimetil-ciclopropilo)	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2(2,2-dimetil-ciclopropilo)	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2(2-cloro-ciclopropilo)	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2(2-cloro-ciclopropilo)	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2(2,2-dicloro-ciclopropilo)	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2(2,2-dicloro-ciclopropilo)	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2(2-fluoro-ciclopropilo)	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2(2-fluoro-ciclopropilo)	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2(2,2-difluoro-ciclopropilo)	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2(2,2-difluoro-ciclopropilo)	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2Bu-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2Pen-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2Hex-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2CH_2Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2CH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2CH=CH_2$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2CH=CH_2$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2CH=CHCl$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2CH=CHCl$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2C\equiv CH$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	$CH_2C\equiv CH$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2C\equiv CH$	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	$CH_2C\equiv CH$	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	F
Me	Me	H	H	0	H	H	F	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	OMe

Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CN	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2C\equiv CH$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CMe$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2C\equiv CMe$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CHF_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	CHF_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CHF_2	F
Me	Me	H	H	0	H	H	F	CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CHF_2	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CHF_2	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CHF_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CHF_2	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CN	CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CHF_2	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CHF_2	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Et	CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CHF_2	Et
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2CHF_2	Cl

Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2CF_3	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2CF_3	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2OH	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2OH	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2OMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	CH_2OMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2OMe	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	CH_2OMe	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2OMe	F
Me	Me	H	H	0	H	H	F	CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2OMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2OMe	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2OMe	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2OMe	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2OMe	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CN	CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2OMe	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2OEt	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2OEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2CH_2OH	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2CH_2OH	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2CH_2OMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2CH_2OMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2CH_2OEt	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2CH_2OEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2NHMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2NHMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2N(Me)_2$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2N(Me)_2$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2N(Me)C(=O)Me$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2N(Me)C(=O)Me$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2N(Me)C(=O)CF_3$	Cl

Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH2N(Me)C(=O)CF_3	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2N(Me)SO_2Me$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2N(Me)SO_2Me$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2N(Me)SO_2CHF_2$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2N(Me)SO_2CHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2N(Me)SO_2CF_3$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2N(Me)SO_2CF_3$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2SMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2SMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2SO_2Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2SO_2Me	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2CH_2SMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2CH_2SMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2CH_2SO_2Me$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2CH_2SO_2Me$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH_2CN	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH_2CN	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)OMe$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2C(=O)OMe$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)OEt$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2C(=O)OEt$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CH(Me)C(=O)OMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH(Me)C(=O)OMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$C(Me)_2C(=O)OMe$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$C(Me)_2C(=O)OMe$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)NH_2$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2C(=O)NH_2$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)NHMe$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2C(=O)NHMe$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)N(Me)_2$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2C(=O)N(Me)_2$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)Me$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2C(=O)Me$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2C(=NOMe)Me$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2C(=NOMe)Me$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)CF_3$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2C(=O)CF_3$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2CH_2C(=O)Me$	Cl

Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$CH_2CH_2C(=O)Me$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Ph	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Et	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Pr	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Pr-i	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Bu-t	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CH_2OMe	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	Ph	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CHF_2	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	H
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	Et
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	F
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	OH
Me	Me	H	H	0	H	H	OH	Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	OPr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	OPr
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	OBu-t
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	OCH_2Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	$OCH_2CH=CH_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	$OCH_2C\equiv CH$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	OCH_2CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	OCH_2CF_3

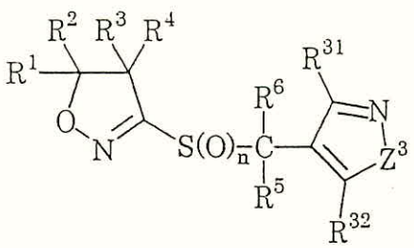
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	$OCH_2C(=O)OMe$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	$OCH(Me)C(=O)OMe$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	$OC(Me)_2C(=O)OMe$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	$OC(=O)Me$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	$OC(=O)Et$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	$OC(=O)CH_2Ph$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	$OC(=O)CF_3$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	$OC(=O)Ph$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	OSO_2Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	OSO_2Et
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	OSO_2CH_2Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	OSO_2CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	OSO_2Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	SMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	SO_2Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	SEt
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	SO_2Et
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	SPr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	SO_2Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	SPr
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	SO_2Pr
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	SBu-t
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	SO_2Bu-t
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	$SCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	SO_2CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	NH_2
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	NHMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	$N(Me)_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	$NHC(=O)Me$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	$N(Me)C(=O)Me$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	$NHSO_2Me$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	$N(Me)SO_2Me$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	$NHSO_2CF_3$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	$N(Me)SO_2CF_3$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	NHPh
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	C(=O)Me

Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	C(=O)OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	$C(=O)NH_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	C(=O)NHMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	$C(=O)N(Me)_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	Imidazol-1-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	Pirazol-1-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	1,2,4-triazol-1-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	1,2,4-triazol-4-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	Tetrazol-1-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	Tetrazol-5-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)oxi
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)sulfonilo
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_2CF_3	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(2-Cl)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(2-F)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(2-OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(2-Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$(2\text{-}NO_2)Ph$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(2-CN)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(2-C(=O)Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(2-C(=O)OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(2-C(=O)OEt)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(2-C(=O)OPr-i)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$(2\text{-}C(=O)NH_2)Ph$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(2-C(=O)NHMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$(2\text{-}C(=O)NMe_2)Ph$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(3-Cl)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(3-F)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(3-OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(3-Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$(3\text{-}NO_2)Ph$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(3-CN)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(3-C(=O)Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(3-C(=O)OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(3-C(=O)OEt)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(3-C(=O)OPr-i)Ph	Cl

Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(3-C(=O)NH_2)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(3-C(=O)NHMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(3-C(=O)NMe_2)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(4-Cl)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(4-F)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(4-OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(4-Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(4-NO_2)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(4-CN)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(4-C(=O)Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(4-C(=O)OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(4-C(=O)OEt)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(4-C(=O)OPr-i)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(4-C(=O)NH_2)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(4-C(=O)NHMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	(4-C(=O)NMe_2)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Pirmidin-2-ilo	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	4,6-dimetoxipirmidin-2-ilo	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Tiofen-2-ilo	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Furan-2-ilo	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	SO_2Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	SO_2Et	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	SO_2Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	SO_2CH_2Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	SO_2CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	SO_2CF_3	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	SO_2Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	C(=O)Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	C(=O)Et	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	C(=O)Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	C(=O)Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	C(=O)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	C(=O)CH_2Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	C(=O)CH_2Cl	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	C(=O)$CHCl_2$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	C(=O)CF_3	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	C(=O)OMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	C(=O)OPh	Cl

Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$C(=O)OCH_2Ph$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	C(=O)NHMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$C(=O)N(Me)_2$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	C(=O)NHPh	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	NH_2	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$-(CH_2)_2O-$	
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$-(CH_2)_3O-$	
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$-(CH_2)_3S-$	
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$-(CH_2)_3SO_2-$	
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$-(CH_2)_2O-$	
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$-(CH_2)_3O-$	
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$-(CH_2)_3S-$	
Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$-(CH_2)_3SO_2-$	
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	$-(CH_2)_4-$	
Me	Me	H	H	0	H	H	$OCHF_2$	$-(CH_2)_4-$	
H	H	H	H	0	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	H	H	H	0	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	H	Me	H	0	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	Me	Me	H	0	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	Me	H	CF_3	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	Et	H	CF_3	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	CF_3	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	Me	Me	CF_3	Me	Cl
Me	Et	H	H	0	H	H	CF_3	Me	Cl
Et	Et	H	H	0	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	Pr	H	H	0	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	CH_2Pr-c	H	H	0	H	H	CF_3	Me	Cl
$-(CH_2)_2-$		H	H	0	H	H	CF_3	Me	Cl
$-(CH_2)_3-$		H	H	0	H	H	CF_3	Me	Cl
$-(CH_2)_4-$		H	H	0	H	H	CF_3	Me	Cl
$-(CH_2)_5-$		H	H	0	H	H	CF_3	Me	Cl
H	$-(CH_2)_3-$		H	0	H	H	CF_3	Me	Cl
H	$-(CH_2)_4-$		H	0	H	H	CF_3	Me	Cl
H	$-(CH_2)_5-$		H	0	H	H	CF_3	Me	Cl
H	$-(CH_2)_6-$		H	0	H	H	CF_3	Me	Cl
Me	Et	H	H	2	H	H	H	H	H

Tabla 4



R^1	R^2	R^3	R^4	n	R^5	R^6	Z^3	R^{31}	R^{32}
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	OPr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	O	$OCHF_2$	F
Me	Me	H	H	2	H	H	O	$OCHF_2$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	O	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	O	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	O	$OCHF_2$	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	F
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	OP r -i
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	OPh

Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	SMe
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	SOMe
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	SO_2Me
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	SEt
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	SOEt
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	SO_2Et
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	SP r -i
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	SOP r -i
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	SO_2P r -i
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	SPh
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	SOPh
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	SO_2Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	$SCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	$SOCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	SO_2CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	SCF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	$SOCF_3$
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	SO_2CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	NH_2
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	NHC(=O)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	$NHC(=O)CH_2Ph$
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	$NHC(=O)CF_3$
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	$NHSO_2Me$
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	$NHSO_2Ph$
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	$NHSO_2CHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	$NHSO_2CF_3$
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	NHMe
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	NHPh
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	N(Me)C(=O)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	$N(Me)C(=O)CH_2Ph$
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	$N(Me)C(=O)CF_3$

Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	$N(Me)SO_2Me$
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	$N(Me)SO_2Ph$
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	$N(Me)SO_2CHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	$N(Me)SO_2CF_3$
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	$N(Me)_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Ph	Me
H	H	H	H	2	H	H	O	CF_3	Me
Me	H	H	H	2	H	H	O	CF_3	Me
Me	H	Me	H	2	H	H	O	CF_3	Me
Me	Me	Me	H	2	H	H	O	CF_3	Me
Me	Me	H	H	2	Me	H	O	CF_3	Me
Me	Me	H	H	2	Et	H	O	CF_3	Me
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	O	CF_3	Me
Me	Me	H	H	2	Me	Me	O	CF_3	Me
Me	Et	H	H	2	H	H	O	CF_3	Me
Et	Et	H	H	2	H	H	O	CF_3	Me
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	O	CF_3	Me
Me	Pr	H	H	2	H	H	O	CF_3	Me
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	O	CF_3	Me
Me	CH_2Pr-c	H	H	2	H	H	O	CF_3	Me
$-(CH_2)_2-$		H	H	2	H	H	O	CF_3	Me
$-(CH_2)_3-$		H	H	2	H	H	O	CF_3	Me
$-(CH_2)_4-$		H	H	2	H	H	O	CF_3	Me
$-(CH_2)_5-$		H	H	2	H	H	O	CF_3	Me
H	$-(CH_2)_3-$		H	2	H	H	O	CF_3	Me
H	$-(CH_2)_4-$		H	2	H	H	O	CF_3	Me
H	$-(CH_2)_5-$		H	2	H	H	O	CF_3	Me
H	$-(CH_2)_6-$		H	2	H	H	O	CF_3	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	OMe

Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	OPr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	S	$OCHF_2$	F
Me	Me	H	H	2	H	H	S	$OCHF_2$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	S	$OCHF_2$	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	F
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	SMe
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	SOMe
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	SO_2Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	SEt
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	SOEt
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	SO_2Et
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	SP r -i
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	SOP r -i
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	SO_2P r -i
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	SPh
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	SOPh
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	SO_2Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	$SCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	$SOCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	SO_2CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	SCF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	$SOCF_3$
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	SO_2CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	NH_2

Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	NHC(=O)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	$NHC(=O)CH_2Ph$
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	$NHC(=O)CF_3$
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	$NHSO_2Me$
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	$NHSO_2Ph$
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	$NHSO_2CHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	$NHSO_2CF_3$
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	NHMe
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	NHPh
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	N(Me)C(=O)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	$N(Me)C(=O)CH_2Ph$
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	$N(Me)C(=O)CF_3$
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	$N(Me)SO_2Me$
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	$N(Me)SO_2Ph$
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	$N(Me)SO_2CHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	$N(Me)SO_2CF_3$
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	$N(Me)_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF_3	CN
H	H	H	H	2	H	H	S	CF_3	Cl
Me	H	H	H	2	H	H	S	CF_3	Cl
Me	H	Me	H	2	H	H	S	CF_3	Cl
Me	Me	Me	H	2	H	H	S	CF_3	Cl
Me	Me	H	H	2	Me	H	S	CF_3	Cl
Me	Me	H	H	2	Et	H	S	CF_3	Cl
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	S	CF_3	Cl
Me	Me	H	H	2	Me	Me	S	CF_3	Cl
Me	Et	H	H	2	H	H	S	CF_3	Cl
Et	Et	H	H	2	H	H	S	CF_3	Cl
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	S	CF_3	Cl
Me	Pr	H	H	2	H	H	S	CF_3	Cl
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	S	CF_3	Cl

Me	CH_2Pr-c	H	H	2	H	H	S	CF_3	Cl
$-(CH_2)_2-$		H	H	2	H	H	S	CF_3	Cl
$-(CH_2)_3-$		H	H	2	H	H	S	CF_3	Cl
$-(CH_2)_4-$		H	H	2	H	H	S	CF_3	Cl
$-(CH_2)_5-$		H	H	2	H	H	S	CF_3	Cl
H	$-(CH_2)_3-$		H	2	H	H	S	CF_3	Cl
H	$-(CH_2)_4-$		H	2	H	H	S	CF_3	Cl
H	$-(CH_2)_5-$		H	2	H	H	S	CF_3	Cl
H	$-(CH_2)_6-$		H	2	H	H	S	CF_3	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	O	Me	F
Me	Me	H	H	1	H	H	O	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	O	Me	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	O	Me	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	O	Me	OPr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	O	Me	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	O	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	O	Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	O	Me	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	O	Me	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	O	$OCHF_2$	F
Me	Me	H	H	1	H	H	O	$OCHF_2$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	O	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	O	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	O	$OCHF_2$	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	F
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	OP r -i
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	SMe
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	SO_2Me
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	SEt

Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	SO_2Et
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	SPr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	SO_2Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	SPh
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	SO_2Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	$SCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	SO_2CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	SCF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	SO_2CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	NH_2
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	NHC(=O)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	$NHC(=O)CH_2Ph$
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	$NHC(=O)CF_3$
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	$NHSO_2Me$
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	$NHSO_2Ph$
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	$NHSO_2CHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	$NHSO_2CF_3$
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	NHMe
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	NHPh
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	N(Me)C(=O)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	$N(Me)C(=O)CH_2Ph$
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	$N(Me)C(=O)CF_3$
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	$N(Me)SO_2Me$
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	$N(Me)SO_2Ph$
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	$N(Me)SO_2CHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	$N(Me)SO_2CF_3$
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	$N(Me)_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF_3	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	O	Ph	Me
H	H	H	H	1	H	H	O	CF_3	Me

Me	H	H	H	1	H	H	O	CF_3	Me
Me	H	Me	H	1	H	H	O	CF_3	Me
Me	Me	Me	H	1	H	H	O	CF_3	Me
Me	Me	H	H	1	Me	H	O	CF_3	Me
Me	Me	H	H	1	Et	H	O	CF_3	Me
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	O	CF_3	Me
Me	Me	H	H	1	Me	Me	O	CF_3	Me
Me	Et	H	H	1	H	H	O	CF_3	Me
Et	Et	H	H	1	H	H	O	CF_3	Me
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	O	CF_3	Me
Me	Pr	H	H	1	H	H	O	CF_3	Me
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	O	CF_3	Me
Me	CH_2Pr-c	H	H	1	H	H	O	CF_3	Me
$-(CH_2)_2-$		H	H	1	H	H	O	CF_3	Me
$-(CH_2)_3-$		H	H	1	H	H	O	CF_3	Me
$-(CH_2)_4-$		H	H	1	H	H	O	CF_3	Me
$-(CH_2)_5-$		H	H	1	H	H	O	CF_3	Me
H	$-(CH_2)_3-$		H	1	H	H	O	CF_3	Me
H	$-(CH_2)_4-$		H	1	H	H	O	CF_3	Me
H	$-(CH_2)_5-$		H	1	H	H	O	CF_3	Me
H	$-(CH_2)_6-$		H	1	H	H	O	CF_3	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	F
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	OPr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	S	$OCHF_2$	F
Me	Me	H	H	1	H	H	S	$OCHF_2$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	S	$OCHF_2$	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	F
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	Cl

Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	SMe
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	SO_2Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	SEt
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	SO_2Et
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	SP r -i
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	SO_2P r -i
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	SPh
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	SO_2Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	$SCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	SO_2CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	SCF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	SO_2CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	NH_2
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	NHC(=O)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	$NHC(=O)CH_2Ph$
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	$NHC(=O)CF_3$
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	$NHSO_2Me$
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	$NHSO_2Ph$
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	$NHSO_2CHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	$NHSO_2CF_3$
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	NHMe
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	NHPh
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	N(Me)C(=O)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	$N(Me)C(=O)CH_2Ph$
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	$N(Me)C(=O)CF_3$
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	$N(Me)SO_2Me$
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	$N(Me)SO_2Ph$
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	$N(Me)SO_2CHF_2$

Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	$N(Me)SO_2CF_3$
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	$N(Me)_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF_3	CN
H	H	H	H	1	H	H	S	CF_3	Cl
Me	H	H	H	1	H	H	S	CF_3	Cl
Me	H	Me	H	1	H	H	S	CF_3	Cl
Me	Me	Me	H	1	H	H	S	CF_3	Cl
Me	Me	H	H	1	Me	H	S	CF_3	Cl
Me	Me	H	H	1	Et	H	S	CF_3	Cl
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	S	CF_3	Cl
Me	Me	H	H	1	Me	Me	S	CF_3	Cl
Me	Et	H	H	1	H	H	S	CF_3	Cl
Et	Et	H	H	1	H	H	S	CF_3	Cl
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	S	CF_3	Cl
Me	Pr	H	H	1	H	H	S	CF_3	Cl
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	S	CF_3	Cl
Me	CH_2Pr-c	H	H	1	H	H	S	CF_3	Cl
$-(CH_2)_2-$		H	H	1	H	H	S	CF_3	Cl
$-(CH_2)_3-$		H	H	1	H	H	S	CF_3	Cl
$-(CH_2)_4-$		H	H	1	H	H	S	CF_3	Cl
$-(CH_2)_5-$		H	H	1	H	H	S	CF_3	Cl
H	$-(CH_2)_3-$		H	1	H	H	S	CF_3	Cl
H	$-(CH_2)_4-$		H	1	H	H	S	CF_3	Cl
H	$-(CH_2)_5-$		H	1	H	H	S	CF_3	Cl
H	$-(CH_2)_6-$		H	1	H	H	S	CF_3	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	F
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	OPr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	Me

Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	O	$OCHF_2$	F
Me	Me	H	H	0	H	H	O	$OCHF_2$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	O	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	O	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	O	$OCHF_2$	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	F
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	OP r -i
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	SMe
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	SO_2Me
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	SEt
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	SO_2Et
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	SP r -i
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	SO_2P r -i
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	SPh
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	SO_2Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	$SCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	SO_2CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	SCF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	SO_2CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	NH_2
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	NHC(=O)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	$NHC(=O)CH_2Ph$
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	$NHC(=O)CF_3$
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	$NHSO_2Me$
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	$NHSO_2Ph$
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	$NHSO_2CHF_2$

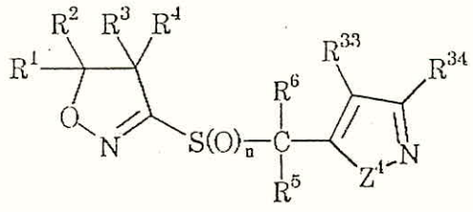
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	$NHSO_2CF_3$
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	NHMe
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	NHPh
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	N(Me)C(=O)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	$N(Me)C(=O)CH_2Ph$
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	$N(Me)C(=O)CF_3$
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	$N(Me)SO_2Me$
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	$N(Me)SO_2Ph$
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	$N(Me)SO_2CHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	$N(Me)SO_2CF_3$
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	$N(Me)_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Ph	Me
H	H	H	H	0	H	H	O	CF_3	Me
Me	H	H	H	0	H	H	O	CF_3	Me
Me	H	Me	H	0	H	H	O	CF_3	Me
Me	Me	Me	H	0	H	H	O	CF_3	Me
Me	Me	H	H	0	Me	H	O	CF_3	Me
Me	Me	H	H	0	Et	H	O	CF_3	Me
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	O	CF_3	Me
Me	Me	H	H	0	Me	Me	O	CF_3	Me
Me	Et	H	H	0	H	H	O	CF_3	Me
Et	Et	H	H	0	H	H	O	CF_3	Me
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	O	CF_3	Me
Me	Pr	H	H	0	H	H	O	CF_3	Me
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	O	CF_3	Me
Me	CH_2Pr-c	H	H	0	H	H	O	CF_3	Me
$-(CH_2)_2-$		H	H	0	H	H	O	CF_3	Me
$-(CH_2)_3-$		H	H	0	H	H	O	CF_3	Me
$-(CH_2)_4-$		H	H	0	H	H	O	CF_3	Me
$-(CH_2)_5-$		H	H	0	H	H	O	CF_3	Me

H	-$(CH_2)_3$-		H	0	H	H	O	CF_3	Me
H	-$(CH_2)_4$-		H	0	H	H	O	CF_3	Me
H	-$(CH_2)_5$-		H	0	H	H	O	CF_3	Me
H	-$(CH_2)_6$-		H	0	H	H	O	CF_3	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	F
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	OPr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	S	$OCHF_2$	F
Me	Me	H	H	0	H	H	S	$OCHF_2$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	S	$OCHF_2$	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	F
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	SMe
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	SO_2Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	SEt
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	SO_2Et
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	SP r -i
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	SO_2P r -i
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	SPh
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	SO_2Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	$SCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	SO_2CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	SCF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	SO_2CF_3

Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	NH_2
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	NHC(=O)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	$NHC(=O)CH_2Ph$
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	$NHC(=O)CF_3$
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	$NHSO_2Me$
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	$NHSO_2Ph$
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	$NHSO_2CHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	$NHSO_2CF_3$
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	NHMe
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	NHPh
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	N(Me)C(=O)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	$N(Me)C(=O)CH_2Ph$
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	$N(Me)C(=O)CF_3$
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	$N(Me)SO_2Me$
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	$N(Me)SO_2Ph$
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	$N(Me)SO_2CHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	$N(Me)SO_2CF_3$
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	$N(Me)_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF_3	CN
H	H	H	H	0	H	H	S	CF_3	Cl
Me	H	H	H	0	H	H	S	CF_3	Cl
Me	H	Me	H	0	H	H	S	CF_3	Cl
Me	Me	Me	H	0	H	H	S	CF_3	Cl
Me	Me	H	H	0	Me	H	S	CF_3	Cl
Me	Me	H	H	0	Et	H	S	CF_3	Cl
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	S	CF_3	Cl
Me	Me	H	H	0	Me	Me	S	CF_3	Cl
Me	Et	H	H	0	H	H	S	CF_3	Cl
Et	Et	H	H	0	H	H	S	CF_3	Cl
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	S	CF_3	Cl
Me	Pr	H	H	0	H	H	S	CF_3	Cl

Me	Pr-c	H	H	0	H	H	S	CF_3	Cl
Me	CH_2Pr-c	H	H	0	H	H	S	CF_3	Cl
-$(CH_2)_2$-		H	H	0	H	H	S	CF_3	Cl
-$(CH_2)_3$-		H	H	0	H	H	S	CF_3	Cl
-$(CH_2)_4$-		H	H	0	H	H	S	CF_3	Cl
-$(CH_2)_5$-		H	H	0	H	H	S	CF_3	Cl
H	-$(CH_2)_3$-	H	H	0	H	H	S	CF_3	Cl
H	-$(CH_2)_4$-	H	H	0	H	H	S	CF_3	Cl
H	-$(CH_2)_5$-	H	H	0	H	H	S	CF_3	Cl
H	-$(CH_2)_6$-	H	H	0	H	H	S	CF_3	Cl

Tabla 5



R^1	R^2	R^3	R^4	n	R^5	R^6	Z^4	R^{33}	R^{34}
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Cl	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Cl	Et
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Cl	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	CF_3	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	CF_3	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	C(=O)Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	-$(CH_2)_3$-	
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	-$(CH_2)_4$-	

Me	Me	H	H	2	H	H	NEt	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NEt	CF_3	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NEt	CF_3	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NEt	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NEt	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NEt	$-(CH_2)_3-$	
Me	Me	H	H	2	H	H	NEt	$-(CH_2)_4-$	
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr-i	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr-i	CF_3	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr-i	CF_3	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr-i	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr-i	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr-i	$-(CH_2)_3-$	
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr-i	$-(CH_2)_4-$	
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr	CF_3	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr	CF_3	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr	$-(CH_2)_3-$	
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr	$-(CH_2)_4-$	
Me	Me	H	H	2	H	H	NBu-t	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NBu-t	CF_3	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NBu-t	CF_3	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NBu-t	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NBu-t	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NBu-t	$-(CH_2)_3-$	
Me	Me	H	H	2	H	H	NBu-t	$-(CH_2)_4-$	
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH_2Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH_2Ph	CF_3	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH_2Ph	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH_2OMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH_2OMe	CF_3	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH_2OMe	$OCHF_2$	H

Me	Me	H	H	2	H	H	$NCH_2C\equiv CH$	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	$NCH_2C\equiv CH$	CF_3	H
Me	Me	H	H	2	H	H	$NCH_2C\equiv CH$	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	2	H	H	$NCH_2CH=CH_2$	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	$NCH_2CH=CH_2$	CF_3	H
Me	Me	H	H	2	H	H	$NCH_2CH=CH_2$	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	2	H	H	$NCHF_2$	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	$NCHF_2$	CF_3	H
Me	Me	H	H	2	H	H	$NCHF_2$	CF_3	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	$NCHF_2$	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	2	H	H	$NCHF_2$	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	$NCHF_2$	C(=O)Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	$NCHF_2$	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	$NCHF_2$	$-(CH_2)_3-$	
Me	Me	H	H	2	H	H	$NCHF_2$	$-(CH_2)_4-$	
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	OMe	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	OEt	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	OCH_2CF_3	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	CF_3	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	$OCH_2CH=CH_2$	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	$OCH_2C\equiv CH$	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(2-Cl)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(2-F)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(2-OMe)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(2-Me)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(3-Cl)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(3-F)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(3-OMe)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(3-Me)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(4-Cl)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(4-F)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(4-OMe)Ph	Cl	Me

Me	Me	H	H	2	H	H	N(4-Me)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(tiofen-2-ilo)	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(tiofen-2-ilo)	CF_3	H
Me	Me	H	H	2	H	H	N(tiofen-2-ilo)	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)Me	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)Me	CF_3	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)Me	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	2	H	H	$NC(=O)CF_3$	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	$NC(=O)CF_3$	CF_3	H
Me	Me	H	H	2	H	H	$NC(=O)CF_3$	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	2	H	H	$NC(=O)CH_2Ph$	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	$NC(=O)CH_2Ph$	CF_3	H
Me	Me	H	H	2	H	H	$NC(=O)CH_2Ph$	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)Ph	CF_3	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)Ph	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)OMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)OMe	CF_3	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)OMe	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	2	H	H	$NC(=O)OCH_2Ph$	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	$NC(=O)OCH_2Ph$	CF_3	H
Me	Me	H	H	2	H	H	$NC(=O)OCH_2Ph$	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)OPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)OPh	CF_3	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)OPh	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)NHMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)NHMe	CF_3	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)NHMe	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	2	H	H	$NC(=O)N(Me)_2$	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	$NC(=O)N(Me)_2$	CF_3	H
Me	Me	H	H	2	H	H	$NC(=O)N(Me)_2$	$OCHF_2$	H
H	H	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
Me	H	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
Me	H	Me	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	Me	H	NPh	Cl	Me

Me	Me	H	H	2	Et	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	Me	Me	NPh	Cl	Me
Me	Et	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
Et	Et	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Pr	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
Me	CH_2Pr-c	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
-$(CH_2)_2$-		H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
-$(CH_2)_3$-		H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
-$(CH_2)_4$-		H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
-$(CH_2)_5$-		H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
H	-$(CH_2)_3$-		H	2	H	H	NPh	Cl	Me
H	-$(CH_2)_4$-		H	2	H	H	NPh	Cl	Me
H	-$(CH_2)_5$-		H	2	H	H	NPh	Cl	Me
H	-$(CH_2)_6$-		H	2	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	O	H	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	H	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	Cl	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	Cl	Et
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	Cl	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	CF_3	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	CF_3	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	C(=O)Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	-$(CH_2)_3$-	
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	-$(CH_2)_4$-	
Me	Me	H	H	1	H	H	NEt	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NEt	CF_3	H

Me	Me	H	H	1	H	H	NEt	CF_3	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NEt	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NEt	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NEt	$-(CH_2)_3-$	
Me	Me	H	H	1	H	H	NEt	$-(CH_2)_4-$	
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr-i	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr-i	CF_3	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr-i	CF_3	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr-i	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr-i	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr-i	$-(CH_2)_3-$	
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr-i	$-(CH_2)_4-$	
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr	CF_3	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr	CF_3	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr	$-(CH_2)_3-$	
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr	$-(CH_2)_4-$	
Me	Me	H	H	1	H	H	NBu-t	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NBu-t	CF_3	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NBu-t	CF_3	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NBu-t	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NBu-t	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NBu-t	$-(CH_2)_3-$	
Me	Me	H	H	1	H	H	NBu-t	$-(CH_2)_4-$	
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH_2Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH_2Ph	CF_3	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH_2Ph	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH_2OMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH_2OMe	CF_3	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH_2OMe	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	1	H	H	$NCH_2C\equiv CH$	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	$NCH_2C\equiv CH$	CF_3	H

Me	Me	H	H	1	H	H	$NCH_2C\equiv CH$	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	1	H	H	$NCH_2CH=CH_2$	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	$NCH_2CH=CH_2$	CF_3	H
Me	Me	H	H	1	H	H	$NCH_2CH=CH_2$	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	1	H	H	$NCHF_2$	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	$NCHF_2$	CF_3	H
Me	Me	H	H	1	H	H	$NCHF_2$	CF_3	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	$NCHF_2$	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	1	H	H	$NCHF_2$	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	$NCHF_2$	C(=O)Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	$NCHF_2$	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	$NCHF_2$	$-(CH_2)_3-$	
Me	Me	H	H	1	H	H	$NCHF_2$	$-(CH_2)_4-$	
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	OMe	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	OEt	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	OCH_2CF_3	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	CF_3	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	$OCH_2CH=CH_2$	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	$OCH_2C\equiv CH$	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(2-Cl)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(2-F)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(2-OMe)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(2-Me)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(3-Cl)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(3-F)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(3-OMe)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(3-Me)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(4-Cl)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(4-F)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(4-OMe)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(4-Me)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(tiofen-2-ilo)	Cl	Me

Me	Me	H	H	1	H	H	N(tiofen-2-ilo)	CF_3	H
Me	Me	H	H	1	H	H	N(tiofen-2-ilo)	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)Me	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)Me	CF_3	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)Me	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	1	H	H	$NC(=O)CF_3$	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	$NC(=O)CF_3$	CF_3	H
Me	Me	H	H	1	H	H	$NC(=O)CF_3$	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	1	H	H	$NC(=O)CH_2Ph$	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	$NC(=O)CH_2Ph$	CF_3	H
Me	Me	H	H	1	H	H	$NC(=O)CH_2Ph$	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)Ph	CF_3	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)Ph	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)OMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)OMe	CF_3	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)OMe	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	1	H	H	$NC(=O)OCH_2Ph$	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	$NC(=O)OCH_2Ph$	CF_3	H
Me	Me	H	H	1	H	H	$NC(=O)OCH_2Ph$	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)OPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)OPh	CF_3	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)OPh	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)NHMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)NHMe	CF_3	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)NHMe	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	1	H	H	$NC(=O)N(Me)_2$	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	$NC(=O)N(Me)_2$	CF_3	H
Me	Me	H	H	1	H	H	$NC(=O)N(Me)_2$	$OCHF_2$	H
H	H	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
Me	H	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
Me	H	Me	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	Me	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	Et	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	NPh	Cl	Me

Me	Me	H	H	1	Me	Me	NPh	Cl	Me
Me	Et	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
Et	Et	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Pr	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
Me	CH_2Pr-c	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
-(CH_2)$_2$-		H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
-(CH_2)$_3$-		H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
-(CH_2)$_4$-		H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
-(CH_2)$_5$-		H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
H	-(CH_2)$_3$-		H	1	H	H	NPh	Cl	Me
H	-(CH_2)$_4$-		H	1	H	H	NPh	Cl	Me
H	-(CH_2)$_5$-		H	1	H	H	NPh	Cl	Me
H	-(CH_2)$_6$-		H	1	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	O	H	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	O	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	H	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	Cl	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	Cl	Et
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	Cl	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	CF_3	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	CF_3	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	C(=O)Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	-(CH_2)$_3$-	
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	-(CH_2)$_4$-	
Me	Me	H	H	0	H	H	NEt	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NEt	CF_3	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NEt	CF_3	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NEt	$OCHF_2$	H

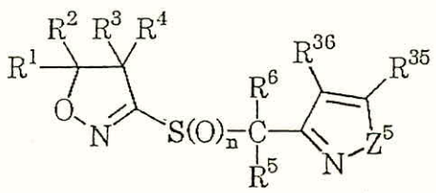
Me	Me	H	H	0	H	H	NEt	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NEt	$-(CH_2)_3-$	
Me	Me	H	H	0	H	H	NEt	$-(CH_2)_4-$	
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr-i	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr-i	CF_3	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr-i	CF_3	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr-i	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr-i	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr-i	$-(CH_2)_3-$	
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr-i	$-(CH_2)_4-$	
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr	CF_3	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr	CF_3	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr	$-(CH_2)_3-$	
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr	$-(CH_2)_4-$	
Me	Me	H	H	0	H	H	NBu-t	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NBu-t	CF_3	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NBu-t	CF_3	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NBu-t	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NBu-t	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NBu-t	$-(CH_2)_3-$	
Me	Me	H	H	0	H	H	NBu-t	$-(CH_2)_4-$	
Me	Me	H	H	0	H	H	NCH_2Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NCH_2Ph	CF_3	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NCH_2Ph	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NCH_2OMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NCH_2OMe	CF_3	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NCH_2OMe	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	0	H	H	$NCH_2C\equiv CH$	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	$NCH_2C\equiv CH$	CF_3	H
Me	Me	H	H	0	H	H	$NCH_2C\equiv CH$	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	0	H	H	$NCH_2CH=CH_2$	Cl	Me

Me	Me	H	H	0	H	H	$NCH_2CH=CH_2$	CF_3	H
Me	Me	H	H	0	H	H	$NCH_2CH=CH_2$	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	0	H	H	$NCHF_2$	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	$NCHF_2$	CF_3	H
Me	Me	H	H	0	H	H	$NCHF_2$	CF_3	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	$NCHF_2$	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	0	H	H	$NCHF_2$	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	$NCHF_2$	C(=O)Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	$NCHF_2$	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	$NCHF_2$	$-(CH_2)_3-$	
Me	Me	H	H	0	H	H	$NCHF_2$	$-(CH_2)_4-$	
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	OMe	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	OEt	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	OCH_2CF_3	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	CF_3	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	$OCH_2CH=CH_2$	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	$OCH_2C\equiv CH$	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(2-Cl)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(2-F)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(2-OMe)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(2-Me)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(3-Cl)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(3-F)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(3-OMe)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(3-Me)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(4-Cl)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(4-F)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(4-OMe)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(4-Me)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(tiofen-2-ilo)	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(tiofen-2-ilo)	CF_3	H
Me	Me	H	H	0	H	H	N(tiofen-2-ilo)	$OCHF_2$	H

Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)Me	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)Me	CF_3	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)Me	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	0	H	H	$NC(=O)CF_3$	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	$NC(=O)CF_3$	CF_3	H
Me	Me	H	H	0	H	H	$NC(=O)CF_3$	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	0	H	H	$NC(=O)CH_2Ph$	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	$NC(=O)CH_2Ph$	CF_3	H
Me	Me	H	H	0	H	H	$NC(=O)CH_2Ph$	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)Ph	CF_3	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)Ph	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)OMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)OMe	CF_3	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)OMe	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	0	H	H	$NC(=O)OCH_2Ph$	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	$NC(=O)OCH_2Ph$	CF_3	H
Me	Me	H	H	0	H	H	$NC(=O)OCH_2Ph$	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)OPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)OPh	CF_3	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)OPh	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)NHMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)NHMe	CF_3	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)NHMe	$OCHF_2$	H
Me	Me	H	H	0	H	H	$NC(=O)N(Me)_2$	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	$NC(=O)N(Me)_2$	CF_3	H
Me	Me	H	H	0	H	H	$NC(=O)N(Me)_2$	$OCHF_2$	H
H	H	H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
Me	H	H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
Me	H	Me	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	Me	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	Et	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	Me	Me	NPh	Cl	Me
Me	Et	H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me

Et	Et	H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Pr	H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
Me	CH_2Pr-c	H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
-$(CH_2)_2$-		H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
-$(CH_2)_3$-		H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
-$(CH_2)_4$-		H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
-$(CH_2)_5$-		H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
H	-$(CH_2)_3$-		H	0	H	H	NPh	Cl	Me
H	-$(CH_2)_4$-		H	0	H	H	NPh	Cl	Me
H	-$(CH_2)_5$-		H	0	H	H	NPh	Cl	Me
H	-$(CH_2)_6$-		H	0	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	O	H	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	H	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	Me
Me	Et	H	H	2	H	H	NH	H	H

Tabla 6



R^1	R^2	R^3	R^4	n	R^5	R^6	Z^5	R^{35}	R^{36}
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	H	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	H	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	H	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	H	OCH_2CF_3

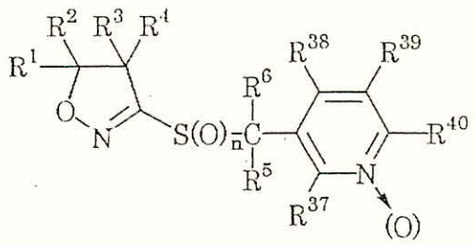
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	-$(CH_2)_3$-	
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	-$(CH_2)_4$-	
Me	Me	H	H	2	H	H	NEt	-$(CH_2)_3$-	
Me	Me	H	H	2	H	H	NEt	-$(CH_2)_4$-	
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr-i	-$(CH_2)_3$-	
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr-i	-$(CH_2)_4$-	
Me	Me	H	H	2	H	H	$NCHF_2$	-$(CH_2)_3$-	
Me	Me	H	H	2	H	H	$NCHF_2$	-$(CH_2)_4$-	
Me	Me	H	H	2	H	H	$N(CH_2)_3O$-		H
Me	Me	H	H	2	H	H	$N(CH_2)_4O$-		H
Me	Me	H	H	2	H	H	$N(CH_2)_4$-		H
Me	Me	H	H	2	H	H	$N(CH_2)_5$-		H
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	H	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	H	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	H	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	H	OCH_2CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	H
H	H	H	H	2	H	H	NPh	H	OMe
Me	H	H	H	2	H	H	NPh	H	OEt
Me	H	Me	H	2	H	H	NPh	H	OMe
Me	Me	H	H	2	Me	H	NPh	H	OEt
Me	Me	H	H	2	Et	H	NPh	H	OMe
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	NPh	H	OEt
Me	Me	H	H	2	Me	Me	NPh	H	OMe
Me	Et	H	H	2	H	H	NPh	H	OEt
Et	Et	H	H	2	H	H	NPh	H	OMe
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	NPh	H	OEt
Me	Pr	H	H	2	H	H	NPh	H	OMe
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	NPh	H	OEt
Me	CH_2Pr-c	H	H	2	H	H	NPh	H	OMe
-$(CH_2)_2$-		H	H	2	H	H	NPh	H	OEt
-$(CH_2)_3$-		H	H	2	H	H	NPh	H	OMe
-$(CH_2)_4$-		H	H	2	H	H	NPh	H	OEt

-$(CH_2)_5$-		H	H	2	H	H	NPh		H	OMe
H	-$(CH_2)_3$-		H	2	H	H	NPh		H	OEt
H	-$(CH_2)_4$-		H	2	H	H	NPh		H	OMe
H	-$(CH_2)_5$-		H	2	H	H	NPh		H	OMe
H	-$(CH_2)_6$-		H	2	H	H	NPh		H	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe		H	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe		H	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe		H	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe		H	OCH_2CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe		-$(CH_2)_3$-	
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe		-$(CH_2)_4$-	
Me	Me	H	H	1	H	H	NEt		-$(CH_2)_3$-	
Me	Me	H	H	1	H	H	NEt		-$(CH_2)_4$-	
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr-i		-$(CH_2)_3$-	
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr-i		-$(CH_2)_4$-	
Me	Me	H	H	1	H	H	$NCHF_2$		-$(CH_2)_3$-	
Me	Me	H	H	1	H	H	$NCHF_2$		-$(CH_2)_4$-	
Me	Me	H	H	1	H	H	N$(CH_2)_3$O-			H
Me	Me	H	H	1	H	H	N$(CH_2)_4$O-			H
Me	Me	H	H	1	H	H	N$(CH_2)_4$-			H
Me	Me	H	H	1	H	H	N$(CH_2)_5$-			H
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh		H	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh		H	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh		H	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh		H	OCH_2CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	O		Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S		Me	H
H	H	H	H	1	H	H	NPh		H	OMe
Me	H	H	H	1	H	H	NPh		H	OEt
Me	H	Me	H	1	H	H	NPh		H	OMe
Me	Me	H	H	1	Me	H	NPh		H	OEt
Me	Me	H	H	1	Et	H	NPh		H	OMe
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	NPh		H	OEt
Me	Me	H	H	1	Me	Me	NPh		H	OMe

Me	Et	H	H	1	H	H	NPh		H	OEt
Et	Et	H	H	1	H	H	NPh		H	OMe
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	NPh		H	OEt
Me	Pr	H	H	1	H	H	NPh		H	OMe
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	NPh		H	OEt
Me	CH_2Pr-c	H	H	1	H	H	NPh		H	OMe
-$(CH_2)_2$-		H	H	1	H	H	NPh		H	OEt
-$(CH_2)_3$-		H	H	1	H	H	NPh		H	OMe
-$(CH_2)_4$-		H	H	1	H	H	NPh		H	OEt
-$(CH_2)_5$-		H	H	1	H	H	NPh		H	OMe
H	-$(CH_2)_3$-		H	1	H	H	NPh		H	OEt
H	-$(CH_2)_4$-		H	1	H	H	NPh		H	OMe
H	-$(CH_2)_5$-		H	1	H	H	NPh		H	OMe
H	-$(CH_2)_6$-		H	1	H	H	NPh		H	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe		H	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe		H	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe		H	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe		H	OCH_2CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	-$(CH_2)_3$-		
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	-$(CH_2)_4$-		
Me	Me	H	H	0	H	H	NEt	-$(CH_2)_3$-		
Me	Me	H	H	0	H	H	NEt	-$(CH_2)_4$-		
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr-i	-$(CH_2)_3$-		
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr-i	-$(CH_2)_4$-		
Me	Me	H	H	0	H	H	$NCHF_2$	-$(CH_2)_3$-		
Me	Me	H	H	0	H	H	$NCHF_2$	-$(CH_2)_4$-		
Me	Me	H	H	0	H	H	N$(CH_2)_3$O-			H
Me	Me	H	H	0	H	H	N$(CH_2)_4$O-			H
Me	Me	H	H	0	H	H	N$(CH_2)_4$-			H
Me	Me	H	H	0	H	H	N$(CH_2)_5$-			H
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	H		OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	H		OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	H		$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	H		OCH_2CF_3

Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	H
H	H	H	H	0	H	H	NPh	H	OMe
Me	H	H	H	0	H	H	NPh	H	OEt
Me	H	Me	H	0	H	H	NPh	H	OMe
Me	Me	H	H	0	Me	H	NPh	H	OEt
Me	Me	H	H	0	Et	H	NPh	H	OMe
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	NPh	H	OEt
Me	Me	H	H	0	Me	Me	NPh	H	OMe
Me	Et	H	H	0	H	H	NPh	H	OEt
Et	Et	H	H	0	H	H	NPh	H	OMe
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	NPh	H	OEt
Me	Pr	H	H	0	H	H	NPh	H	OMe
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	NPh	H	OEt
Me	CH_2Pr-c	H	H	0	H	H	NPh	H	OMe
-$(CH_2)_2$-		H	H	0	H	H	NPh	H	OEt
-$(CH_2)_3$-		H	H	0	H	H	NPh	H	OMe
-$(CH_2)_4$-		H	H	0	H	H	NPh	H	OEt
-$(CH_2)_5$-		H	H	0	H	H	NPh	H	OMe
H	-$(CH_2)_3$-		H	0	H	H	NPh	H	OEt
H	-$(CH_2)_4$-		H	0	H	H	NPh	H	OMe
H	-$(CH_2)_5$-		H	0	H	H	NPh	H	OMe
H	-$(CH_2)_6$-		H	0	H	H	NPh	H	OEt
Me	Et	H	H	2	H	H	O	H	H
Me	Et	H	H	2	H	H	S	H	H
Me	Et	H	H	2	H	H	NH	H	H

Tabla 7



R^1	R^2	R^3	R^4	n	R^5	R^6	R^{37}	R^{38}	R^{39}	R^{40}	
Me	Me	H	H	2	H	H	H	H	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	H	H	H	H	N-óxido
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Ph	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Ph	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CF_3	H	H	N-óxido
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	H	H	N-óxido
Me	Me	H	H	2	H	H	Ph	Ph	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	(4-Cl)Ph	H	Me	-
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	(4-Cl)Ph	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Cl	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$(CH_2)_3$		H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	$(CH_2)_3$		H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$(CH_2)_4$		H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	$(CH_2)_4$		H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	H	$(CH_2)_3$		-
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	H	$(CH_2)_3$		-

Me	Me	H	H	2	H	H	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Me
H	H	H	H	2	H	H	H
Me	H	H	H	2	H	H	H
Me	H	Me	H	2	H	H	H
Me	Me	Me	H	2	H	H	H
Me	Me	H	H	2	Me	H	H
Me	Me	H	H	2	Et	H	H
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	H
Me	Me	H	H	2	Me	Me	H
Me	Et	H	H	2	H	H	H
Et	Et	H	H	2	H	H	H
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	H
Me	Pr	H	H	2	H	H	H
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	H
Me	CH_2Pr-c	H	H	2	H	H	H
-$(CH_2)_2$-		H	H	2	H	H	H
-$(CH_2)_3$-		H	H	2	H	H	H
-$(CH_2)_4$-		H	H	2	H	H	H
-$(CH_2)_5$-		H	H	2	H	H	H
H	-$(CH_2)_3$-		H	2	H	H	H
H	-$(CH_2)_4$-		H	2	H	H	H
H	-$(CH_2)_5$-		H	2	H	H	H
H	-$(CH_2)_6$-		H	2	H	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H

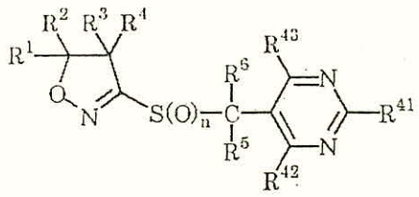
H	$(CH_2)_4$		-
H	$(CH_2)_4$		-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
CF_3	H	H	-
H	H	H	-
H	H	H	N-óxido
Ph	H	H	-
Ph	H	H	-
Me	H	H	-
Me	H	H	-
CF_3	H	H	-

Me	Me	H	H	l	H	H	Cl	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	l	H	H	CN	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	l	H	H	OMe	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	l	H	H	OEt	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	l	H	H	Me	Me	H	H	N-óxido
Me	Me	H	H	l	H	H	Ph	Ph	H	H	-
Me	Me	H	H	l	H	H	Cl	(4-Cl)Ph	H	Me	-
Me	Me	H	H	l	H	H	Cl	(4-Cl)Ph	H	H	-
Me	Me	H	H	l	H	H	OMe	Cl	H	H	-
Me	Me	H	H	l	H	H	Cl	$(CH_2)_3$		H	-
Me	Me	H	H	l	H	H	Me	$(CH_2)_3$		H	-
Me	Me	H	H	l	H	H	Cl	$(CH_2)_4$		H	-
Me	Me	H	H	l	H	H	Me	$(CH_2)_4$		H	-
Me	Me	H	H	l	H	H	Cl	H	$(CH_2)_3$		-
Me	Me	H	H	l	H	H	Me	H	$(CH_2)_3$		-
Me	Me	H	H	l	H	H	Cl	H	$(CH_2)_4$		-
Me	Me	H	H	l	H	H	Me	H	$(CH_2)_4$		-
H	H	H	H	l	H	H	H	CF_3	H	H	-
Me	H	H	H	l	H	H	H	CF_3	H	H	-
Me	H	Me	H	l	H	H	H	CF_3	H	H	-
Me	Me	Me	H	l	H	H	H	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	l	Me	H	H	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	l	Et	H	H	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	l	Pr-i	H	H	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	l	Me	Me	H	CF_3	H	H	-
Me	Et	H	H	l	H	H	H	CF_3	H	H	-
Et	Et	H	H	l	H	H	H	CF_3	H	H	-
Me	Pr-i	H	H	l	H	H	H	CF_3	H	H	-
Me	Pr	H	H	l	H	H	H	CF_3	H	H	-
Me	Pr-c	H	H	l	H	H	H	CF_3	H	H	-
Me	CH_2Pr-c	H	H	l	H	H	H	CF_3	H	H	-

-$(CH_2)_2$-		H	H	1	H	H	H	CF_3	H	H	-
-$(CH_2)_3$-		H	H	1	H	H	H	CF_3	H	H	-
-$(CH_2)_4$-		H	H	1	H	H	H	CF_3	H	H	-
-$(CH_2)_5$-		H	H	1	H	H	H	CF_3	H	H	-
H	-$(CH_2)_3$-		H	1	H	H	H	CF_3	H	H	-
H	-$(CH_2)_4$-		H	1	H	H	H	CF_3	H	H	-
H	-$(CH_2)_5$-		H	1	H	H	H	CF_3	H	H	-
H	-$(CH_2)_6$-		H	1	H	H	H	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	H	H	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	H	H	H	H	N-óxido
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Ph	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Ph	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Me	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Me	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	CN	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Me	H	H	N-óxido
Me	Me	H	H	0	H	H	Ph	Ph	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	(4-Cl)Ph	H	Me	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	(4-Cl)Ph	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Cl	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$(CH_2)_3$		H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	$(CH_2)_3$		H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$(CH_2)_4$		H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	$(CH_2)_4$		H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	H	$(CH_2)_3$		-
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	H	$(CH_2)_3$		-
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	H	$(CH_2)_4$		-

Me	Me	H	H	0	H	H	Me	H	$(CH_2)_4$		-
Me	Me	H	H	0	H	H	(2-cloropiridin-3-il)metiltio	H	H	H	-
H	H	H	H	0	H	H	H	CF_3	H	H	-
Me	H	H	H	0	H	H	H	CF_3	H	H	-
Me	Me	Me	H	0	H	H	H	CF_3	H	H	-
Me	H	Me	H	0	H	H	H	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	0	Me	H	H	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	0	Et	H	H	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	H	CF_3	H	H	-
Me	Me	H	H	0	Me	Me	H	CF_3	H	H	-
Me	Et	H	H	0	H	H	H	CF_3	H	H	-
Et	Et	H	H	0	H	H	H	CF_3	H	H	-
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	H	CF_3	H	H	-
Me	Pr	H	H	0	H	H	H	CF_3	H	H	-
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	H	CF_3	H	H	-
Me	CH_2Pr-c	H	H	0	H	H	H	CF_3	H	H	-
$-(CH_2)_2-$		H	H	0	H	H	H	CF_3	H	H	-
$-(CH_2)_3-$		H	H	0	H	H	H	CF_3	H	H	-
$-(CH_2)_4-$		H	H	0	H	H	H	CF_3	H	H	-
$-(CH_2)_5-$		H	H	0	H	H	H	CF_3	H	H	-
H	$-(CH_2)_3-$		H	0	H	H	H	CF_3	H	H	-
H	$-(CH_2)_4-$		H	0	H	H	H	CF_3	H	H	-
H	$-(CH_2)_5-$		H	0	H	H	H	CF_3	H	H	-
H	$-(CH_2)_6-$		H	0	H	H	H	CF_3	H	H	-
Me	Et	H	H	2	H	H	H	H	H	H	-

Tabla 8



R^1	R^2	R^3	R^4	n	R^5	R^6	R^{41}	R^{42}	R^{43}
Me	Me	H	H	2	H	H	H	Cl	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Bu-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Pen-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Hex-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$OCHF_2$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	Cl

Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Et	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$SCHF_2$	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH_2	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe_2	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt_2	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	F	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	Me

Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Pr-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Bu-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Pen-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Hex-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Ph	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Et	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Pr-i	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Ph	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$SCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2CHF_2	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH_2	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe_2	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt_2	Me

Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	F	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	Cl	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Pr-c	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Bu-c	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Pen-c	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Hex-c	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$OCHF_2$	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Me	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Et	Pr-i

Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Pr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$SCHF_2$	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2CHF_2	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH_2	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe_2	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt_2	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	F	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	Cl	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Pr-c	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Bu-c	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Pen-c	Pr-c

Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Hex-c	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$OCHF_2$	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Me	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Et	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Pr-i	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$SCHF_2$	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2CHF_2	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH_2	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe_2	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt_2	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	Pr-c

Me	Me	H	H	2	H	H	H	F	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	Cl	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Pr-c	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Bu-c	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Pen-c	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Hex-c	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Ph	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$OCHF_2$	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Me	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Et	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Pr-i	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	CHF_2

Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Ph	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$SCHF_2$	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2CHF_2	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH_2	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe_2	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt_2	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	CHF_2
Me	Me	H	H	2	H	H	H	F	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	Cl	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	CF_3

Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Et	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$SCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	F	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	OMe

Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Pr-c	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Bu-c	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Pen-c	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Hex-c	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Ph	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$OCHF_2$	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Me	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Et	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Pr-i	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Ph	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$SCHF_2$	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2CHF_2	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH_2	OMe

Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe_2	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt_2	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	F	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Pr-c	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Bu-c	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Pen-c	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Hex-c	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Ph	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$OCHF_2$	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	OPh

Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Me	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Et	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Pr-i	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Ph	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$SCHF_2$	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2CHF_2	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH_2	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe_2	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt_2	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	F	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Pr-c	$OCHF_2$

Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Bu-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Pen-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Hex-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH_2Ph	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$OCHF_2$	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Et	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Pr-i	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2Ph	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	$SCHF_2$	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO_2CHF_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	$OCHF_2$

Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	F	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Cl	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OH	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OPr	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OBu-t	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OCH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OCH_2Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OCH_2Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OCH_2Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OPen-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OHex-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OCH_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OPh	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SH	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SO_2Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SO_2Et	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SPr-i	CF_3

Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SO_2Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SPh	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SO_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	$SCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SO_2CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	NH_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	NHMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	NMe_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	NHEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	NEt_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	NHPh	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	N(Me)Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CN	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	F	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Cl	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OH	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OPr	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OBu-t	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OCH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OCH_2Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OCH_2Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OCH_2Hex-c	CF_3

Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OPen-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OHex-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OCH_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OPh	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SH	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SO_2Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SO_2Et	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SO_2Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SPh	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SO_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	$SCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SO_2CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	NH_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	NHMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	NMe_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	NHEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	NEt_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	NHPh	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	N(Me)Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	CN	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	F	CF_3

Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	Cl	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OH	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OPr	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OBu-t	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OCH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OCH_2Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OCH_2Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OCH_2Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OPen-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OHex-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OCH_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OPh	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SH	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SO_2Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SO_2Et	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SO_2Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SPh	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SO_2Ph	CF_3

Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	$SCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SO_2CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	NH_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	NHMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	NMe_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	NHEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	NEt_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	NHPh	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	N(Me)Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	CN	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	F	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	Cl	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	OH	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	OPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	OPr	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	OBu-t	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	OCH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	OCH_2Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	OCH_2Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	OCH_2Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	OPen-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	OHex-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	OCH_2Ph	CF_3

Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	OPh	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	SH	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	SMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	SO_2Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	SEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	SO_2Et	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	SPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	SO_2Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	SPh	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	SO_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	$SCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	SO_2CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	NH_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	NHMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	NMe_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	NHEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	NEt_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	NHPh	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	N(Me)Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	CN	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	F	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	Cl	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	OH	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	OMe	CF_3

Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	OPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	OPr	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	OBu-t	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	OCH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	OCH_2Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	OCH_2Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	OCH_2Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	OPen-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	OHex-c	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	OCH_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	OPh	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	SH	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	SMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	SO_2Me	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	SEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	SO_2Et	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	SPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	SO_2Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	SPh	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	SO_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	$SCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	SO_2CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	NH_2	CF_3

Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	NHMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	NMe_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	NHEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	NEt_2	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	NHPh	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	N(Me)Ph	CF_3
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	CN	CF_3
H	H	H	H	2	H	H	H	OMe	CF_3
H	H	H	H	2	H	H	H	OEt	CF_3
Me	H	H	H	2	H	H	H	OMe	CF_3
Me	H	H	H	2	H	H	H	OEt	CF_3
Me	H	Me	H	2	H	H	H	OMe	CF_3
Me	H	Me	H	2	H	H	H	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	Me	H	H	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	Me	H	H	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	Et	H	H	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	Et	H	H	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	H	H	CF_3
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	H	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	H	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	2	Me	Me	H	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	2	Me	Me	H	OEt	CF_3
Me	Et	H	H	2	H	H	H	OMe	CF_3
Me	Et	H	H	2	H	H	H	OEt	CF_3
Et	Et	H	H	2	H	H	H	OMe	CF_3

Et	Et	H	H	2	H	H	H	OEt	CF_3
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	H	OMe	CF_3
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	H	OEt	CF_3
Me	Pr	H	H	2	H	H	H	OMe	CF_3
Me	Pr	H	H	2	H	H	H	OEt	CF_3
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	H	OMe	CF_3
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	H	OEt	CF_3
Me	CH_2Pr-c	H	H	2	H	H	H	OMe	CF_3
Me	CH_2Pr-c	H	H	2	H	H	H	OEt	CF_3
-(CH_2)$_2$-		H	H	2	H	H	H	OMe	CF_3
-(CH_2)$_2$-		H	H	2	H	H	H	OEt	CF_3
-(CH_2)$_3$-		H	H	2	H	H	H	OMe	CF_3
-(CH_2)$_3$-		H	H	2	H	H	H	OEt	CF_3
-(CH_2)$_4$-		H	H	2	H	H	H	OMe	CF_3
-(CH_2)$_4$-		H	H	2	H	H	H	OEt	CF_3
-(CH_2)$_5$-		H	H	2	H	H	H	OMe	CF_3
-(CH_2)$_5$-		H	H	2	H	H	H	OEt	CF_3
H	-(CH_2)$_3$-	H	2	H	H	H	OMe	CF_3	
H	-(CH_2)$_3$-	H	2	H	H	H	OEt	CF_3	
H	-(CH_2)$_4$-	H	2	H	H	H	OMe	CF_3	
H	-(CH_2)$_4$-	H	2	H	H	H	OEt	CF_3	
H	-(CH_2)$_5$-	H	2	H	H	H	OMe	CF_3	
H	-(CH_2)$_5$-	H	2	H	H	H	OEt	CF_3	
H	-(CH_2)$_6$-	H	2	H	H	H	OMe	CF_3	
H	-(CH_2)$_6$-	H	2	H	H	H	OEt	CF_3	

Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OEt	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Bu-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Pen-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Hex-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	$OCHF_2$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Et	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Ph	Cl

Me	Me	H	H	1	H	H	H	$SCHF_2$	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH_2	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe_2	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt_2	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	F	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OEt	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Pr-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Bu-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Pen-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Hex-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Ph	Me

Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Et	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Pr-i	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Ph	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	$SCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2CHF_2	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH_2	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe_2	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt_2	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	F	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	Pr-i

Me	Me	H	H	1	H	H	H	OEt	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Pr-c	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Bu-c	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Pen-c	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Hex-c	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	$OCHF_2$	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Me	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Et	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Pr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	$SCHF_2$	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2CHF_2	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH_2	Pr-i

Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe_2	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt_2	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	F	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OEt	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Pr-c	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Bu-c	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Pen-c	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Hex-c	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	$OCHF_2$	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	Pr-c

Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Me	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Et	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Pr-i	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	$SCHF_2$	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2CHF_2	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH_2	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe_2	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt_2	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	F	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OEt	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	CHF_2

Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Pr-c	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Bu-c	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Pen-c	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Hex-c	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Ph	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	$OCHF_2$	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Me	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Et	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Pr-i	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Ph	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	$SCHF_2$	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2CHF_2	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH_2	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe_2	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	CHF_2

Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt_2	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	CHF_2
Me	Me	H	H	1	H	H	H	F	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Me	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	CF_3

Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Et	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	$SCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	H	F	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OEt	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Pr-c	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Bu-c	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Pen-c	OMe

Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Hex-c	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Ph	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	$OCHF_2$	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Me	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Et	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Pr-i	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Ph	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	$SCHF_2$	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2CHF_2	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH_2	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe_2	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt_2	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	OMe

Me	Me	H	H	1	H	H	H	F	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OEt	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Pr-c	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Bu-c	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Pen-c	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Hex-c	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Ph	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	$OCHF_2$	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Me	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Et	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Pr-i	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Ph	OPh

Me	Me	H	H	1	H	H	H	$SCHF_2$	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2CHF_2	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH_2	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe_2	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt_2	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	F	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OEt	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Pr-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Bu-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Pen-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Hex-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH_2Ph	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	$OCHF_2$

Me	Me	H	H	1	H	H	H	$OCHF_2$	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Et	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Pr-i	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2Ph	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	$SCHF_2$	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO_2CHF_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	F	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Cl	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OH	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OEt	CF_3

Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OPr	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OBu-t	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OCH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OCH_2Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OCH_2Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OCH_2Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OPen-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OHex-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OCH_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OPh	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SH	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SO_2Me	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SO_2Et	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SO_2Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SPh	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SO_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	$SCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SO_2CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	NH_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	NHMe	CF_3

Me	Me	H	H	1	H	H	Me	NMe_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	NHEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	NEt_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	NHPh	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	N(Me)Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	CN	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	F	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	Cl	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OH	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OPr	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OBu-t	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OCH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OCH_2Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OCH_2Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OCH_2Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OPen-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OHex-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OCH_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OPh	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SH	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SMe	CF_3

Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SO_2Me	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SO_2Et	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SO_2Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SPh	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SO_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	$SCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SO_2CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	NH_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	NHMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	NMe_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	NHEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	NEt_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	NHPh	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	N(Me)Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	CN	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	F	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	Cl	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OH	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OPr	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OBu-t	CF_3

Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OCH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OCH_2Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OCH_2Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OCH_2Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OPen-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OHex-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OCH_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OPh	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SH	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SO_2Me	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SO_2Et	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SO_2Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SPh	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SO_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	$SCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SO_2CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	NH_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	NHMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	NMe_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	NHEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	NEt_2	CF_3

Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	NHPh	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	N(Me)Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	CN	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	F	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	Cl	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	OH	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	OPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	OPr	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	OBu-t	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	OCH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	OCH_2Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	OCH_2Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	OCH_2Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	OPen-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	OHex-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	OCH_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	OPh	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	SH	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	SMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	SO_2Me	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	SEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	SO_2Et	CF_3

Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	SPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	SO_2Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	SPh	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	SO_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	$SCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	SO_2CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	NH_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	NHMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	NMe_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	NHEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	NEt_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	NHPh	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	N(Me)Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	SO_2Me	CN	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	F	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	Cl	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	OH	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	OPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	OPr	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	OBu-t	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	OCH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	OCH_2Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	OCH_2Pen-c	CF_3

Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	OCH_2Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	OPen-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	OHex-c	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	OCH_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	OPh	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	SH	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	SMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	SO_2Me	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	SEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	SO_2Et	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	SPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	SO_2Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	SPh	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	SO_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	$SCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	SO_2CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	NH_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	NHMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	NMe_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	NHEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	NEt_2	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	NHPh	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	N(Me)Ph	CF_3
Me	Me	H	H	1	H	H	NH_2	CN	CF_3

H	H	H	H	1	H	H	H	OMe	CF_3
H	H	H	H	1	H	H	H	OEt	CF_3
Me	H	H	H	1	H	H	H	OMe	CF_3
Me	H	H	H	1	H	H	H	OEt	CF_3
Me	H	Me	H	1	H	H	H	OMe	CF_3
Me	H	Me	H	1	H	H	H	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	Me	H	H	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	Me	H	H	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	Et	H	H	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	Et	H	H	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	H	H	CF_3
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	H	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	H	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	1	Me	Me	H	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	1	Me	Me	H	OEt	CF_3
Me	Et	H	H	1	H	H	H	OMe	CF_3
Me	Et	H	H	1	H	H	H	OEt	CF_3
Et	Et	H	H	1	H	H	H	OMe	CF_3
Et	Et	H	H	1	H	H	H	OEt	CF_3
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	H	OMe	CF_3
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	H	OEt	CF_3
Me	Pr	H	H	1	H	H	H	OMe	CF_3
Me	Pr	H	H	1	H	H	H	OEt	CF_3
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	H	OMe	CF_3
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	H	OEt	CF_3

Me	CH_2Pr-c	H	H	1	H	H	H	OMe	CF_3
Me	CH_2Pr-c	H	H	1	H	H	H	OEt	CF_3
-$(CH_2)_2$-		H	H	1	H	H	H	OMe	CF_3
-$(CH_2)_2$-		H	H	1	H	H	H	OEt	CF_3
-$(CH_2)_3$-		H	H	1	H	H	H	OMe	CF_3
-$(CH_2)_3$-		H	H	1	H	H	H	OEt	CF_3
-$(CH_2)_4$-		H	H	1	H	H	H	OMe	CF_3
-$(CH_2)_4$-		H	H	1	H	H	H	OEt	CF_3
-$(CH_2)_5$-		H	H	1	H	H	H	OMe	CF_3
-$(CH_2)_5$-		H	H	1	H	H	H	OEt	CF_3
H	-$(CH_2)_3$-	H	H	1	H	H	H	OMe	CF_3
H	-$(CH_2)_3$-	H	H	1	H	H	H	OEt	CF_3
H	-$(CH_2)_4$-	H	H	1	H	H	H	OMe	CF_3
H	-$(CH_2)_4$-	H	H	1	H	H	H	OEt	CF_3
H	-$(CH_2)_5$-	H	H	1	H	H	H	OMe	CF_3
H	-$(CH_2)_5$-	H	H	1	H	H	H	OEt	CF_3
H	-$(CH_2)_6$-	H	H	1	H	H	H	OMe	CF_3
H	-$(CH_2)_6$-	H	H	1	H	H	H	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	Cl	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	Cl

Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Bu-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Pen-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Hex-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	$OCHF_2$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Et	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	$SCHF_2$	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2CHF_2	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH_2	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe_2	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt_2	Cl

Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Pr-c	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Bu-c	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Pen-c	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Hex-c	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Ph	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	$OCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Et	Me

Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Pr-i	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Ph	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	$SCHF_2$	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2CHF_2	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH_2	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe_2	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt_2	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	Cl	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Pr-c	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Bu-c	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Pen-c	Pr-i

Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Hex-c	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	$OCHF_2$	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Me	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Et	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Pr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	$SCHF_2$	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2CHF_2	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH_2	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe_2	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt_2	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	Pr-i

Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	Cl	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Pr-c	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Bu-c	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Pen-c	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Hex-c	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	$OCHF_2$	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Me	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Et	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Pr-i	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	Pr-c

Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	$SCHF_2$	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2CHF_2	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH_2	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe_2	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt_2	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	Cl	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Pr-c	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Bu-c	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Pen-c	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Hex-c	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	CHF_2

Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Ph	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	$OCHF_2$	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Me	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Et	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Pr-i	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Ph	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	$SCHF_2$	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2CHF_2	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH_2	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe_2	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt_2	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	CHF_2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	Cl	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	CF_3

Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Me	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Et	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	$SCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2CHF_2	CF_3

Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Pr-c	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Bu-c	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Pen-c	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Hex-c	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Ph	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	$OCHF_2$	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	OMe

Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Me	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Et	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Pr-i	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Ph	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	$SCHF_2$	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2CHF_2	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH_2	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe_2	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt_2	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	OPh

Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Pr-c	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Bu-c	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Pen-c	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Hex-c	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Ph	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	$OCHF_2$	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Me	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Et	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Pr-i	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Ph	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	$SCHF_2$	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2CHF_2	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH_2	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe_2	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt_2	OPh

Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Pr-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Bu-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Pen-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Hex-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH_2Ph	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	$OCHF_2$	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Me	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Et	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	$OCHF_2$

Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Pr-i	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2Ph	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	$SCHF_2$	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO_2CHF_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt_2	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	$OCHF_2$
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	F	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Cl	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OH	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OPr	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OBu-t	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OCH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OCH_2Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OCH_2Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OCH_2Hex-c	CF_3

Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OPen-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OHex-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OCH_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OPh	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SH	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SO_2Me	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SO_2Et	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SO_2Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SPh	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SO_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	$SCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SO_2CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	NH_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	NHMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	NMe_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	NHEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	NEt_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	NHPh	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	N(Me)Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	CN	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	F	CF_3

Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Cl	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OH	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OPr	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OBu-t	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OCH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OCH_2Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OCH_2Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OCH_2Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OPen-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OHex-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OCH_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OPh	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SH	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SO_2Me	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SO_2Et	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SO_2Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SPh	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SO_2Ph	CF_3

Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	$SCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SO_2CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	NH_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	NHMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	NMe_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	NHEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	NEt_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	NHPh	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	N(Me)Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	CN	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	F	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	Cl	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OH	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OPr	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OBu-t	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OCH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OCH_2Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OCH_2Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OCH_2Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OPen-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OHex-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OCH_2Ph	CF_3

Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OPh	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SH	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SO_2Me	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SO_2Et	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SO_2Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SPh	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SO_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	$SCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SO_2CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	NH_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	NHMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	NMe_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	NHEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	NEt_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	NHPh	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	N(Me)Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	CN	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	F	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	Cl	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	OH	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	OMe	CF_3

Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	OPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	OPr	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	OBu-t	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	OCH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	OCH_2Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	OCH_2Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	OCH_2Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	OPen-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	OHex-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	OCH_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	OPh	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	SH	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	SMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	SO_2Me	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	SEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	SO_2Et	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	SPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	SO_2Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	SPh	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	SO_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	$SCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	SO_2CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	NH_2	CF_3

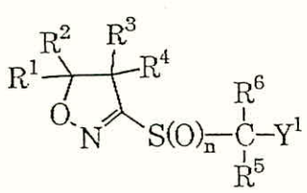
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	NHMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	NMe_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	NHEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	NEt_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	NHPh	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	N(Me)Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	SO_2Me	CN	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	F	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	Cl	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	OH	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	OPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	OPr	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	OBu-t	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	OCH_2Pr-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	OCH_2Bu-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	OCH_2Pen-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	OCH_2Hex-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	OPen-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	OHex-c	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	OCH_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	OPh	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	$OCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	SH	CF_3

Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	SMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	SO_2Me	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	SEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	SO_2Et	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	SPr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	SO_2Pr-i	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	SPh	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	SO_2Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	$SCHF_2$	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	SO_2CHF_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	NH_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	NHMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	NMe_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	NHEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	NEt_2	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	NHPh	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	N(Me)Ph	CF_3
Me	Me	H	H	0	H	H	NH_2	CN	CF_3
H	H	H	H	0	H	H	H	OMe	CF_3
H	H	H	H	0	H	H	H	OEt	CF_3
Me	H	H	H	0	H	H	H	OMe	CF_3
Me	H	H	H	0	H	H	H	OEt	CF_3
Me	H	Me	H	0	H	H	H	OMe	CF_3
Me	H	Me	H	0	H	H	H	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	Me	H	H	OMe	CF_3

Me	Me	H	H	0	Me	H	H	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	Et	H	H	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	Et	H	H	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	H	H	CF_3
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	H	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	H	OEt	CF_3
Me	Me	H	H	0	Me	Me	H	OMe	CF_3
Me	Me	H	H	0	Me	Me	H	OEt	CF_3
Me	Et	H	H	0	H	H	H	OMe	CF_3
Me	Et	H	H	0	H	H	H	OEt	CF_3
Et	Et	H	H	0	H	H	H	OMe	CF_3
Et	Et	H	H	0	H	H	H	OEt	CF_3
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	H	OMe	CF_3
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	H	OEt	CF_3
Me	Pr	H	H	0	H	H	H	OMe	CF_3
Me	Pr	H	H	0	H	H	H	OEt	CF_3
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	H	OMe	CF_3
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	H	OEt	CF_3
Me	CH_2Pr-c	H	H	0	H	H	H	OMe	CF_3
Me	CH_2Pr-c	H	H	0	H	H	H	OEt	CF_3
-$(CH_2)_2$-		H	H	0	H	H	H	OMe	CF_3
-$(CH_2)_2$-		H	H	0	H	H	H	OEt	CF_3
-$(CH_2)_3$-		H	H	0	H	H	H	OMe	CF_3
-$(CH_2)_3$-		H	H	0	H	H	H	OEt	CF_3
-$(CH_2)_4$-		H	H	0	H	H	H	OMe	CF_3

$-(CH_2)_4-$		H	H	0	H	H	H	OEt	CF_3
$-(CH_2)_5-$		H	H	0	H	H	H	OMe	CF_3
$-(CH_2)_5-$		H	H	0	H	H	H	OEt	CF_3
H	$-(CH_2)_3-$		H	0	H	H	H	OMe	CF_3
H	$-(CH_2)_3-$		H	0	H	H	H	OEt	CF_3
H	$-(CH_2)_4-$		H	0	H	H	H	OMe	CF_3
H	$-(CH_2)_4-$		H	0	H	H	H	OEt	CF_3
H	$-(CH_2)_5-$		H	0	H	H	H	OMe	CF_3
H	$-(CH_2)_5-$		H	0	H	H	H	OEt	CF_3
H	$-(CH_2)_6-$		H	0	H	H	H	OMe	CF_3
H	$-(CH_2)_6-$		H	0	H	H	H	OEt	CF_3

Tabla 9



R^1	R^2	R^3	R^4	n	R^5	R^6	Y^1
Me	Me	H	H	2	H	H	Piridin-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	1-óxido de piridin-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	Piridin-4-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	1-óxido de piridin-4-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	1,2,4-oxadiazol-3-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	3-fenil-1,2,4-oxadiazol-5-ilo

Me	Me	H	H	2	H	H	3-bencil-1,2,4-oxadiazol-5-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	2-clorotiazol-4-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	5-trifluorometil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	1,4-dimetilimidazol-5-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	1-fenil-4-metoxicarbonil-1,2,3-triazol-5-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	1-diflluorometil-1,2,4-triazol-3-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	1-diflluorometil-1,2,4-triazol-5-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	4-diflluorometil-1,2,4-triazol-3-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	4,6-dietoxipirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	4,6-dimetilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	4-cloro-6-metilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	4-metoxi-6-metilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	4-difluorometoxi-6-metilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	4-fenoxi-6-metilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	4-cloro-6-trifluorometilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	4-metoxi-6-trifluorometilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	4-difluorometoxi-6-trifluorometilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	4-fenoxi-6-trifluorometilpirimidin-2-ilo
H	H	H	H	2	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	H	H	H	2	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	H	Me	H	2	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	2	Me	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	2	Et	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	2	Me	Me	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Et	Et	H	H	2	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Pr	H	H	2	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo

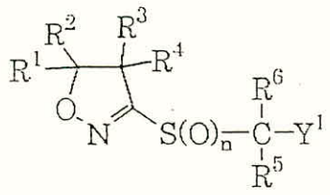
Me	CH_2Pr-c	H	H	2	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
$-(CH_2)_2-$		H	H	2	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
$-(CH_2)_3-$		H	H	2	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
$-(CH_2)_4-$		H	H	2	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
$-(CH_2)_5-$		H	H	2	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
H	$-(CH_2)_3-$		H	2	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
H	$-(CH_2)_4-$		H	2	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
H	$-(CH_2)_5-$		H	2	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
H	$-(CH_2)_6-$		H	2	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	Piridin-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	1-óxido de piridin-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	Piridin-4-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	1-óxido de piridin-4-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	1,2,4-oxadiazol-3-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	3-fenil-1,2,4-oxadiazol-5-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	3-bencil-1,2,4-oxadiazol-5-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	2-clorotiazol-4-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	5-trifluorometil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	1,4-dimetilimidazol-5-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	1-fenil-4-metoxicarbonil-1,2,3-triazol-5-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	1-diflluorometil-1,2,4-triazol-3-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	1-diflluorometil-1,2,4-triazol-5-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	4-diflluorometil-1,2,4-triazol-3-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	4,6-dietoxipirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	4,6-dimetilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	4-cloro-6-metilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	4-metoxi-6-metilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	4-difluorometoxi-6-metilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	4-fenoxi-6-metilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	4-cloro-6-trifluorometilpirimidin-2-ilo

Me	Me	H	H	1	H	H	4-metoxi-6-trifluorometilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	4-difluorometoxi-6-trifluorometilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	4-Phenoxi-6-trifluorometilpirimidin-2-ilo
H	H	H	H	1	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	H	H	H	1	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	H	Me	H	1	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	1	Me	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	1	Et	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	1	Me	Me	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Et	H	H	1	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Et	Et	H	H	1	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Pr	H	H	1	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	CH_2Pr-c	H	H	1	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
-(CH_2)$_2$-		H	H	1	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
-(CH_2)$_3$-		H	H	1	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
-(CH_2)$_4$-		H	H	1	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
-(CH_2)$_5$-		H	H	1	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
H	-(CH_2)$_3$-		H	1	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
H	-(CH_2)$_4$-		H	1	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
H	-(CH_2)$_5$-		H	1	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
H	-(CH_2)$_6$-		H	1	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	Piridin-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	1-óxido de piridin-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	Piridin-4-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	1-óxido de piridin-4-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	1,2,4-oxadiazol-3-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	3-fenil-1,2,4-oxadiazol-5-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	3-bencil-1,2,4-oxadiazol-5-ilo

Me	Me	H	H	0	H	H	2-clorotiazol-4-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	5-trifluorometil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	1,4-dimetilimidazol-5-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	1-fenil-4-metoxicarbonil-1,2,3-triazol-5-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	1-diflluorometil-1,2,4-triazol-3-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	1-diflluorometil-1,2,4-triazol-5-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	4-diflluorometil-1,2,4-triazol-3-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	4,6-dietoxipirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	4,6-dimetilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	4-cloro-6-metilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	4-metoxi-6-metilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	4-difluorometoxi-6-metilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	4-fenoxi-6-metilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	4-cloro-6-trifluorometilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	4-Metoxi-6-trifluorometilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	4-difluorometoxi-6-trifluorometilpirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	4-fenoxi-6-trifluorometilpirimidin-2-ilo
H	H	H	H	0	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	H	H	H	0	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	H	Me	H	0	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	0	Me	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	0	Et	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Me	H	H	0	Me	Me	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Et	H	H	0	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Et	Et	H	H	0	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Pr	H	H	0	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	CH_2Pr-c	H	H	0	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo

-$(CH_2)_2$-		H	H	0	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
-$(CH_2)_3$-		H	H	0	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
-$(CH_2)_4$-		H	H	0	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
-$(CH_2)_5$-		H	H	0	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
H	-$(CH_2)_3$-		H	0	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
H	-$(CH_2)_4$-		H	0	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
H	-$(CH_2)_5$-		H	0	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
H	-$(CH_2)_6$-		H	0	H	H	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	Pirrol-1-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	Oxazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	Tiazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	Tiazol-4-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	1,2,3-tiadiazol-4-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	1,2,3-tiadiazol-5-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	1,2,4-tiadiazol-3-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	1,2,4-tiadiazol-5-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	1,3,4-tiadiazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	1,3,4-tiadiazol-5-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	Piridin-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	Piridin-3-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	Piridin-4-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	1H-imidazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	1H-imidazol-4-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	1H-imidazol-5-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	1H-1,3,4-triazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	1H-1,3,4-triazol-5-ilo

Tabla 10



R^1	R^2	R^3	R^4	n	R^5	R^6	Y^1
Me	Me	H	H	2	H	H	Benzimidazol-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	Benzotiofen-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	3-clorobenzotiofen-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	Benzotriazol-1-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	1-metilindazol-4-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	Benzotiazol-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	Benzotiofen-3-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	5-clorobenzotiofen-3-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	Benzoxazol-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	3-metilbenzotiofen-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	3-bromobenzotiofen-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	Benzofuran-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	2-metilbenzofuran-7-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	3-bromobenzofuran-2-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	Benzotiofen-7-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	1-metilindazol-7-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	1-difluorometilindazol-7-ilo
Me	Me	H	H	2	H	H	3-metilbenzofuran-2-ilo

Me	Me	H	H	2	H	H	3-cloro-1-metilindol-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	Benzimidazol-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	Benzotiofen-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	3-clorobenzotiofen-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	Benzotriazol-1-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	1-metilindazol-4-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	Benzotiazol-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	Benzotiofen-3-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	5-clorobenzotiofen-3-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	Benzoxazol-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	3-metilbenzotiofen-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	3-Bromobenzotiofen-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	Benzofuran-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	2-metilbenzofuran-7-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	3-Bromobenzofuran-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	Benzotiofen-7-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	1-metilindazol-7-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	3-metilbenzofuran-2-ilo
Me	Me	H	H	1	H	H	3-cloro-1-metilindol-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	Benzimidazol-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	Benzotiofen-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	3-clorobenzotiofen-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	Benzotriazol-1-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	1-metilindazol-4-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	Benzotiazol-2-ilo

Me	Me	H	H	0	H	H	Benzotiofen-3-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	5-clorobenzotiofen-3-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	Benzoxazol-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	3-metilbenzotiofen-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	3-Bromobenzotiofen-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	Benzofuran-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	2-metilbenzofuran-7-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	3-bromobenzofuran-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	Benzotiofen-7-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	1-metilindazol-7-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	3-metilbenzofuran-2-ilo
Me	Me	H	H	0	H	H	3-cloro-1-metilindol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	Benzoxazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	4-clorobenzoxazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	5-clorobenzoxazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	6-clorobenzoxazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	7-clorobenzoxazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	4-fluorobenzoxazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	5-fluorobenzoxazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	6-fluorobenzoxazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	7-fluorobenzoxazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	4-metilbenzoxazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	5-metilbenzoxazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	6-metilbenzoxazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	7-metilbenzoxazol-2-ilo

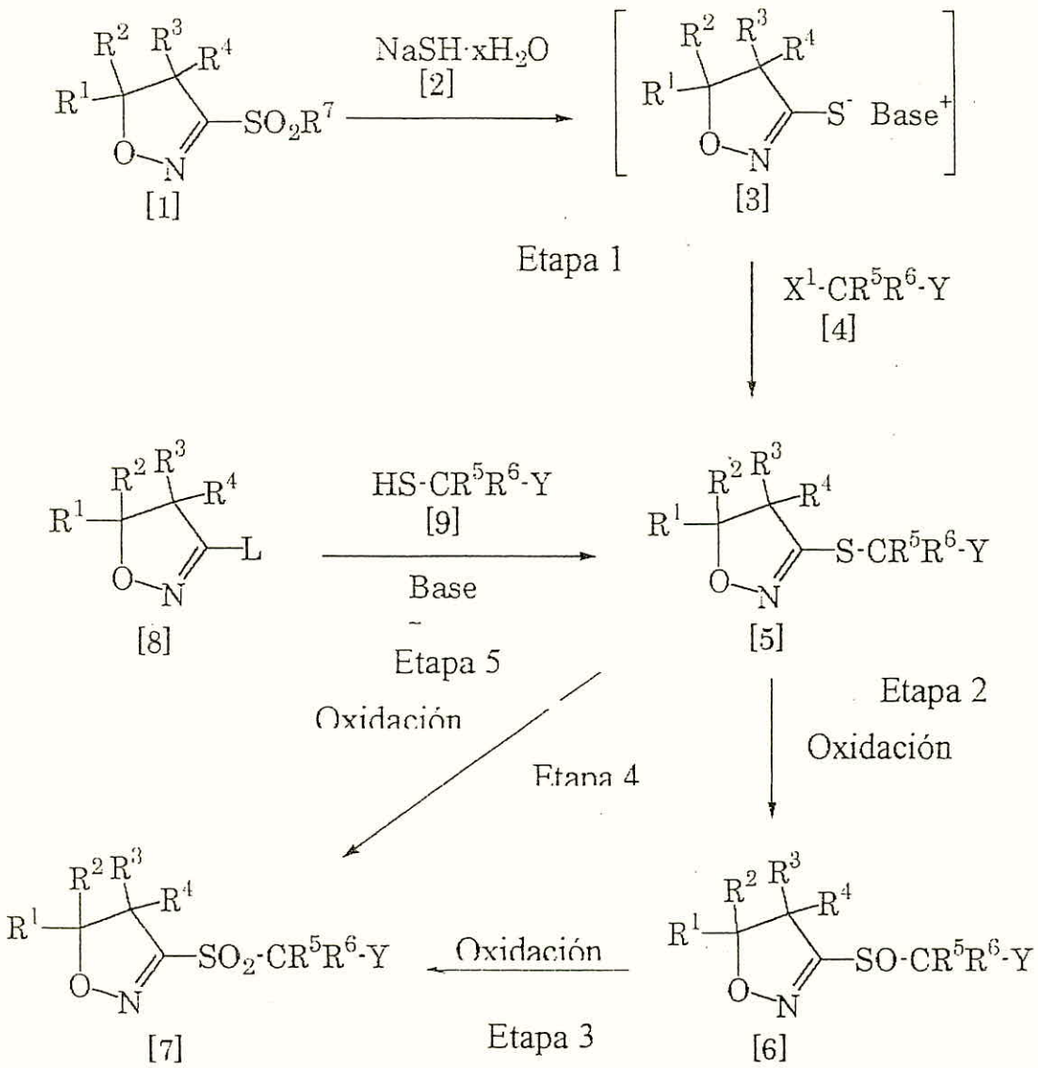
Me	Et	H	H	2	H	H	4-metoxibenzoxazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	5-metoxibenzoxazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	6-metoxibenzoxazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	7-metoxibenzoxazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	Benzotiazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	4-clorobenzotiazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	5-clorobenzotiazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	6-clorobenzotiazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	7-clorobenzotiazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	4-fluorobenzotiazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	5-fluorobenzotiazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	6-fluorobenzotiazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	7-fluorobenzotiazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	4-metilbenzotiazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	5-metilbenzotiazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	6-metilbenzotiazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	7-metilbenzotiazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	4-metoxibenzotiazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	5-metoxibenzotiazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	6-metoxibenzotiazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	7-metoxibenzotiazol-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	Quinolin-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	Quinolin-6-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	Quinoxalin-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	Benzofuran-2-ilo

Me	Et	H	H	2	H	H	3-clorobenzofuran-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	4-clorobenzofuran-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	5-clorobenzofuran-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	6-clorobenzofuran-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	7-clorobenzofuran-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	3-metilbenzofuran-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	4-metilbenzofuran-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	5-metilbenzofuran-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	6-metilbenzofuran-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	7-metilbenzofuran-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	3-metoxibenzofuran-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	4-metoxibenzofuran-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	5-metoxibenzofuran-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	6-metoxibenzofuran-2-ilo
Me	Et	H	H	2	H	H	7-metoxibenzofuran-2-ilo

El presente compuesto representado por la fórmula general [I] puede prepararse de acuerdo con los procesos que se indican más abajo; sin embargo, el compuesto puede producirse también mediante otros procesos.

5

<Proceso de producción 1> Etapa 1 a Etapa 5



En el esquema de producción anterior, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6 e Y tienen las mismas definiciones que las mencionadas con anterioridad; X^1 es un átomo de halógeno; R^7 es un grupo alquilo C1 a C4, un grupo fenilo opcionalmente sustituido o un grupo bencilo opcionalmente sustituido; L es un grupo de salida como átomo de halógeno, grupo alquilsulfonilo C1 a C4, grupo fenilsulfonilo opcionalmente sustituido, grupo bencilsulfonilo

opcionalmente sustituido o similares; y x es un número entero de 1 ó más.

A continuación, el proceso de producción anterior se describe detalladamente en cada etapa.

(Etapa 1)

Un derivado de sulfuro representado por la fórmula general [5] puede producirse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula general [1] con hidrosulfuro de sodio hidratado representado por la fórmula general [2] en presencia o ausencia de un solvente (preferentemente en un solvente apropiado) en presencia de una sal para producir una base de un mercaptano, representado por la fórmula general [3] en el sistema de reacción, y luego, sin aislar la sal de un mercaptano [3], hacer reaccionar la sal [3] con un derivado de halógeno representado por la fórmula general [4] [en este caso, puede agregarse un agente generador de radicales, por ejemplo, Rongalit (marca comercial): $CH_2(OH)SO_2Na \cdot 2H_2O$].

La temperatura en cada reacción es cualquier temperatura entre 0° C y la temperatura de reflujo de cada sistema de reacción y es, preferentemente, de 10 a 100° C. El tiempo de reacción varía según los compuestos usados, pero es de 0,5 a 24 horas.

Con respecto a las cantidades de reactivos utilizados en cada reacción, cada uno de los compuestos representados por la fórmula general [2] y el compuesto representado por la fórmula general [4] se usa en una cantidad de 1 a 3 equivalentes respecto de un equivalente del compuesto representado por la fórmula general [1] y, cuando se usa una base, la base de utiliza en una cantidad de 0,5 a 3 equivalentes.

Como solvente pueden mencionarse, por ejemplo, éteres como dioxano, tetrahidrofurano (TF) y similares; hidrocarburos halogenados como dicloroetano, tetracloruro de carbono, clorobenceno, diclorobenceno y similares; amidas como N,N-dimetilacetamida, N,N-dimetilformamida, N-metil-2-pirrolidinona y similares; compuestos de azufre como dimetilsulfóxido, sulfolano y similares; hidrocarburos aromáticos como benceno, tolueno, xileno y similares; alcoholes como metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol, ter-butanol y similares; cetonas como acetona, 2-butanona y similares; nitrilos como acetonitrilo y similares; agua; y mezclas de los mismos.

Como bases pueden mencionarse, por ejemplo, hidruros metálicos como hidruro de sodio y similares; amidas de metales alcalinos como amida de sodio, diisopropilamida de sodio y similares; bases orgánicas

como piridina, trietilamina, 1,8-diazabiciclo[5,4,0]-7-undeceno y similares; hidróxidos de metales alcalinos como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio y similares; hidróxidos de metales alcalinotérreos como hidróxido de calcio, hidróxido de magnesio y similares; carbonatos de metales alcalinos como carbonato de sodio, carbonato de potasio y similares; hidrogenocarbonatos de metales alcalinos como hidrogenocarbonato de sodio, hidrogenocarbonato de potasio y similares; y alcoholatos de metal como metóxido de sodio, ter-butóxido de potasio y similares.

(Etapa 2)

Puede producirse un derivado de sulfóxido representado por la fórmula general [6] haciendo reaccionar el derivado de sulfuro representado por la fórmula general [5] con un agente de oxidación en un solvente apropiado.

La temperatura de reacción es cualquier temperatura entre 0° C y la temperatura de reflujo del sistema de reacción y es, preferentemente, de 0 a 60° C. El tiempo de reacción varía según los compuestos usados, pero es de 1 a 72 horas.

Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, el

agente de oxidación se usa en una cantidad de 1 a 3 equivalentes por equivalente del compuesto representado por la fórmula general [5].

Como solvente pueden mencionarse, por ejemplo, hidrocarburos halogenados como diclorometano, cloroformo, dicloroetano, tetracloruro de carbono, clorobenceno, diclorobenceno y similares; éteres como dioxano, tetrahidrofurano (TF), dimetoxietano, éter dietílico y similares; amidas como N,N-dimetilacetamida, N,N-dimetilformamida, N-metil-2-pirrolidinona y similares; alcoholes como metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol, ter-butanol y similares; cetonas como acetona, 2-butanona y similares; nitrilos como acetonitrilo y similares; ácido acético; agua; y mezclas de los mismos.

Como agentes de oxidación pueden mencionarse, por ejemplo, peróxidos orgánicos como ácido m-cloroperbenzoico, ácido perfórmico, ácido peracético y similares; y peróxidos inorgánicos como peróxido de hidrógeno, permanganato de potasio, peryodato de sodio y similares.

(Etapa 3)

Puede producirse un derivado de sulfona representado por la fórmula general [7] haciendo reaccionar el derivado de sulfóxido

representado por la fórmula general [6] con un agente de oxidación en un solvente apropiado.

La temperatura de reacción es cualquier temperatura entre 0° C y la temperatura de reflujo del sistema de reacción y es, preferentemente, de 0 a 60° C. El tiempo de reacción varía según los compuestos usados, pero es de 1 a 72 horas.

Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, el agente de oxidación se usa en una cantidad de 1 a 3 equivalentes por equivalente del compuesto representado por la fórmula general [6].

Como solvente y agente de oxidación pueden mencionarse los mismos solventes y agentes de oxidación que en la etapa 2.

(Etapa 4)

También puede producirse el derivado de sulfona representado por la fórmula general [7] haciendo reaccionar el derivado de sulfuro representado por la fórmula general [5] con un agente de oxidación de una cantidad apropiada en un solvente apropiado sin aislar el derivado de sulfóxido representado por la fórmula general [6].

La temperatura de reacción es cualquier temperatura entre 0° C y la temperatura de reflujo del sistema de reacción y es, preferentemente, de 0 a 60° C. El tiempo de reacción varía según los compuestos usados, pero es de 1 a 72 horas.

Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, el agente de oxidación se usa en una cantidad de 1 a 3 equivalentes por equivalente del compuesto representado por la fórmula general [5].

Como solventes y agentes de oxidación pueden mencionarse los mismos solventes y agentes de oxidación que en la etapa 2.

(Etapa 5)

También se puede producir el derivado de sulfuro representado por la fórmula general [5] haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula general [8] con un derivado de mercaptano representado por la fórmula general [9] en presencia o ausencia de un solvente (preferentemente, en un solvente apropiado) en presencia de una base.

La temperatura de reacción es cualquier temperatura entre 0° C y la

temperatura de reflujo del sistema de reacción y es, preferentemente, de 10 a 100° C. El tiempo de reacción varía según los compuestos usados, pero es de 0,5 a 24 horas.

Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, el compuesto representado por la fórmula general [9] se usa en una cantidad de 1 a 3 equivalentes por equivalente del compuesto representado por la fórmula general [8], y la base se usa en una cantidad de 0,5 a 3 equivalentes.

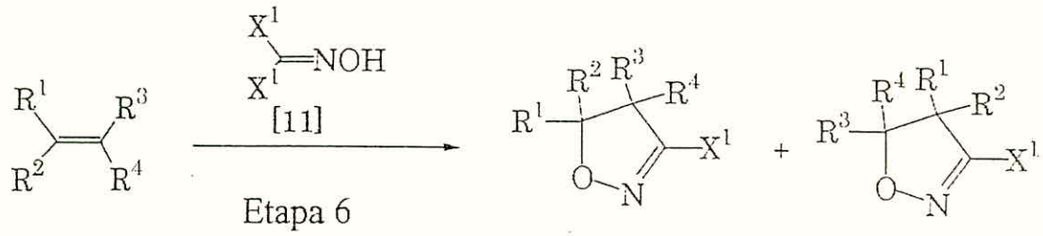
Como solventes pueden mencionarse, por ejemplo, éteres como éter dietílico, dimetoxietano, dioxano, tetrahidrofurano (TF) y similares; hidrocarburos halogenados como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, dicloroetano, clorobenceno, diclorobenceno y similares; amidas como N,N-dimetilacetamida, N,N-dimetilformamida, N-metil-2-pirrolidinona y similares; compuestos de azufre como dimetilsulfóxido, sulfolano y similares; hidrocarburos aromáticos como benceno, tolueno, xileno y similares; alcoholes como metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol, ter-butanol y similares; cetonas como acetona, 2-butanona y similares; nitrilos como acetonitrilo y similares; agua; y mezclas de los mismos.

Como bases pueden mencionarse, por ejemplo, hidruros metálicos

como hidruro de sodio y similares; amidas de metales alcalinos como amida de sodio, diisopropilamida de sodio y similares; bases orgánicas como piridina, trietilamina, 1,8-diazabiciclo[5,4,0]-7-undeceno y similares; hidróxidos de metales alcalinos como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio y similares; hidróxidos de metales alcalinotérreos como hidróxido de calcio, hidróxido de magnesio y similares; carbonatos de metales alcalinos como carbonato de sodio, carbonato de potasio y similares; hidrogenocarbonatos de metales alcalinos como hidrogenocarbonato de sodio, hidrogenocarbonato de potasio y similares; y alcoholatos de metal como metóxido de sodio, ter-butóxido de potasio y similares.

Puede producirse un compuesto de la fórmula general [8], donde L es un átomo de halógeno, es decir, un compuesto [12], por medio del proceso indicado en la siguiente etapa 6. De ser necesario, se someten una mezcla del compuesto [12] y un compuesto [13] a un proceso de separación y purificación para aislar el compuesto [12].

(Etapa 6)



[10] [12] [13]

En la reacción anterior, X^1, R^1, R^2, R^3 y R^4 tienen las mismas definiciones que las mencionadas con anterioridad.

Los compuestos de isoxazolina representados por las fórmulas generales [12] y [13] pueden producirse haciendo reaccionar un derivado de olefina representado por la fórmula general [10] con un derivado de oxima representado por la fórmula general [11] en presencia o ausencia de un solvente (preferentemente en un solvente apropiado) en presencia de una base. Cuando R^3 y R^4 son, cada uno, un átomo de hidrógeno, puede obtenerse, preferentemente, el compuesto de isoxazolina representado por la fórmula general [12].

La temperatura de reacción es cualquier temperatura entre 0° C y la temperatura de reflujo del sistema de reacción y es, preferentemente, de 10 a 80° C. El tiempo de reacción varía según los compuestos usados, pero es de 0,5 horas a 2 semanas.

Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, el

compuesto representado por la fórmula general [10] se usa en una cantidad de 1 a 3 equivalentes por equivalente del compuesto representado por la fórmula general [11].

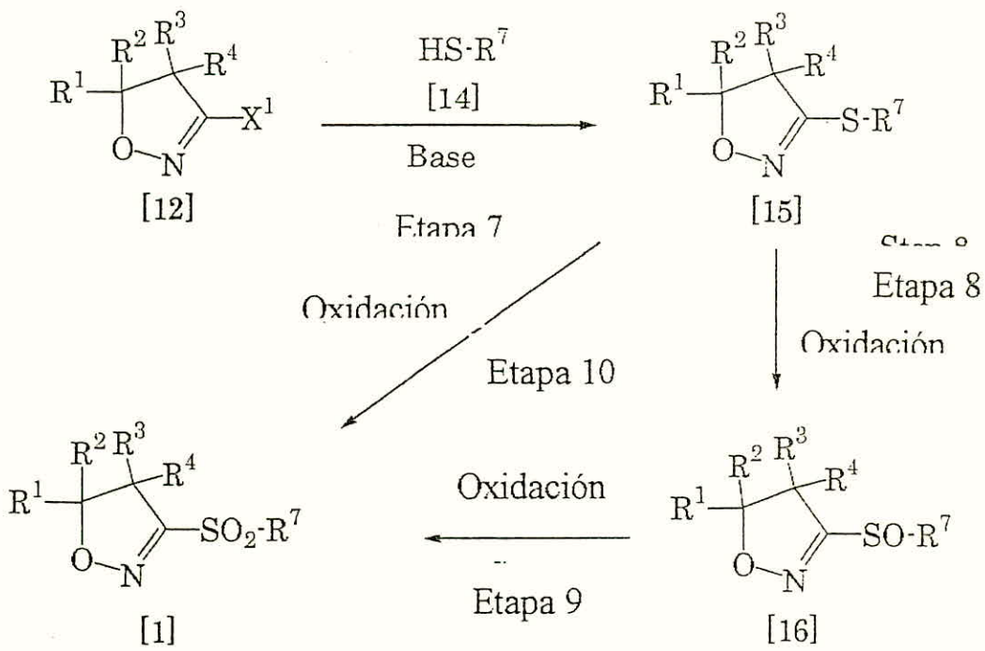
Como solventes pueden mencionarse, por ejemplo, éteres como etilenglicoldimetiléter, etilenglicoldietiléter, éter dietílico, dioxano, tetrahidrofurano y similares; hidrocarburos halogenados como dicloroetano, tetracloruro de carbono, clorobenceno, diclorobenceno y similares; hidrocarburos aromáticos como benceno, tolueno, xileno y similares; ésteres de ácido acético como acetato de etilo, acetato de butilo y similares; agua; y mezclas de los mismos.

Como bases pueden mencionarse, por ejemplo, hidróxidos de metales alcalinos como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio y similares; hidróxidos de metales alcalinotérreos como hidróxido de calcio, hidróxido de magnesio y similares; carbonatos de metales alcalinos como carbonato de sodio, carbonato de potasio y similares; hidrogenocarbonatos de metales alcalinos como hidrogenocarbonato de sodio, hidrogenocarbonato de potasio y similares; acetatos de metales alcalinos como acetato de sodio, acetato de potasio y similares; fluoruros de metales alcalinos como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio y similares; y bases orgánicas como piridina, trietilamina, 1,8-diazabiciclo[5,4,0]-7-undeceno y

similares.

En el proceso de producción anterior, el compuesto representado por la fórmula general [10], usado como un intermediario, puede ser un producto comercial o puede producirse por una reacción conocida como la reacción de Wittig o similares. El compuesto representado por la fórmula general [11] puede producirse, por ejemplo, mediante un proceso descripto en Liebigs Annalen der Chemie, 985 (1989).

El compuesto representado por la fórmula general [1] puede producirse a partir del compuesto indicado con anterioridad, representado por la fórmula general [12], mediante el siguiente proceso.

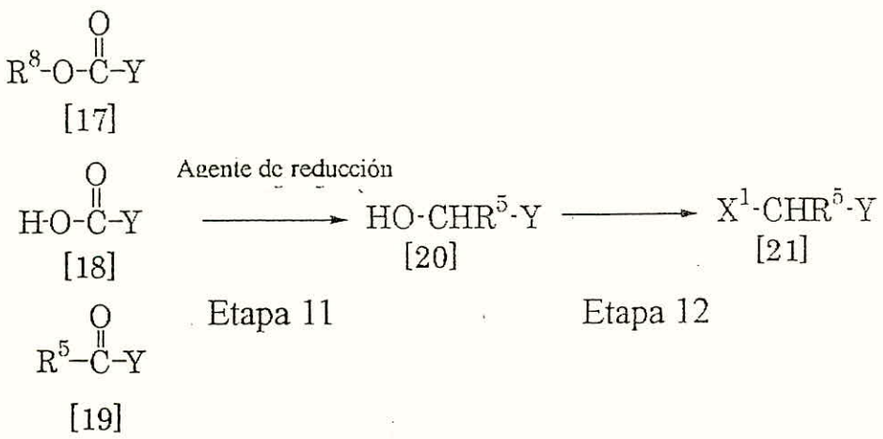


En la reacción anterior, X^1, R^1, R^2, R^3, R^4 y R^7 tienen las mismas definiciones que las mencionadas con anterioridad.

Un compuesto representado por la fórmula general [15] puede producirse mediante la etapa 5 descripta anteriormente; un compuesto representado por la fórmula general [16] puede producirse mediante la etapa 2 descripta anteriormente; y el compuesto representado por la fórmula general [1] puede producirse a partir del compuesto [15] por medio de la etapa 4 antes descripta o a partid del compuesto [16] mediante la etapa 3 descripta anteriormente.

Como solventes, bases y agentes de oxidación pueden mencionarse los mismos solventes, bases y agentes de oxidación que los mencionados en las etapas 2, 3, 4 ó 5.

Un compuesto representado por la fórmula general [4], donde R^6 es un átomo de hidrógeno, es decir, un compuesto representado por la fórmula general [21], puede producirse mediante el siguiente proceso.



En la reacción anterior, R^5, X^1 e Y tienen las mismas definiciones que las mencionadas con anterioridad; y R^8 es un grupo alquilo.

(Etapa 11)

Un compuesto representado por la fórmula general [20] puede producirse haciendo reaccionar un compuesto [17], [18] o [19] con un agente de reducción en un solvente.

Esta reacción se realiza comúnmente de -60 a 150° C durante 10 minutos a 24 horas.

Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, el agente de reducción se usa preferentemente en una cantidad de 0,5 a 2 equivalentes por equivalente del compuesto [17], [18] o [19]; sin embargo,

la cantidad puede variar apropiadamente según la condición de la reacción.

Como agentes de reducción pueden mencionarse, por ejemplo, hidruros metálicos (por ejemplo hidruro de diisobutilaluminio) y compuestos de complejo de hidrógeno metálico (por ejemplo, borhidruro de sodio e hidruro de litio-aluminio) produciendo [20] a partir de [17]; e hidruros metálicos (por ejemplo, hidruro de diisobutilaluminio), compuestos de complejo de hidrógeno metálico (por ejemplo, borhidruro de sodio e hidruro de litio-aluminio) y diborano, produciendo [20] a partir de [18] o [19].

Como solventes pueden mencionarse, por ejemplo, éteres como éter dietílico, tetrahidrofurano, dioxano y similares; hidrocarburos aromáticos como benceno, tolueno y similares; y alcoholes como metanol, etanol y similares.

(Etapa 12)

Un compuesto representado por la fórmula general [21] puede producirse haciendo reaccionar el compuesto [20] con un agente de halogenación en un solvente.

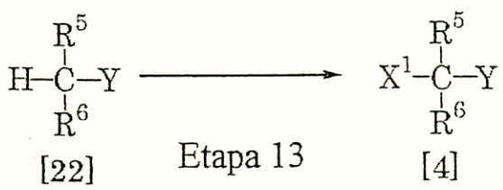
Esta reacción se realiza comúnmente de -50 a 100° C durante 10 minutos a 24 horas.

Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, el agente de halogenación se usa en una cantidad preferida de 1 a 3 equivalentes por equivalente del compuesto [20]; sin embargo, la cantidad puede variarse apropiadamente según la condición de la reacción.

Como agentes de halogenación pueden mencionarse, por ejemplo, cloruro de hidrógeno, bromuro de hidrógeno, tricloruro de fósforo, tribromuro de fósforo y cloruro de tionilo.

Como solventes pueden mencionarse, por ejemplo, hidrocarburos halogenados como dicloroetano, tetracloruro de carbono y similares; ácidos como ácido acético y similares; y éteres como tetrahidrofurano y similares.

El compuesto representado por la fórmula general [4] puede producirse mediante el siguiente proceso.



[22] Etapa 13 [4]

En la reacción anterior, R^5, R^6, X^1 e Y tienen las mismas definiciones que las mencionadas con anterioridad.

El compuesto representado por la fórmula general [4] puede producirse haciendo reaccionar un compuesto [22] con un agente de halogenación en un solvente en presencia o ausencia de un catalizador.

Esta reacción se realiza comúnmente de 30 a 150° C durante 10 minutos a 24 horas.

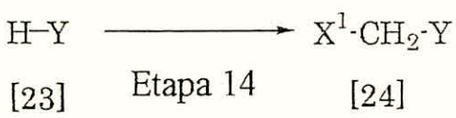
Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, el agente de halogenación se usa preferentemente en una cantidad de 1 a 10 equivalentes respecto de un equivalente del compuesto [22]; sin embargo, la cantidad del agente de halogenación puede variar apropiadamente según la condición de la reacción. El catalizador se usa en una cantidad de 0,01 a 0,5 equivalentes.

Como agentes de halogenación pueden mencionarse, por ejemplo, halógenos como bromo, cloro y similares; N-halosuccinimidas como N-bromosuccinimida y similares; y sales de piridina como perbromuro de piridinio y similares.

Como solventes pueden mencionarse, por ejemplo, hidrocarburos halogenados como dicloroetano, tetracloruro de carbono, clorobenceno, diclorobenceno y similares; amidas como N,N-dimetilacetamida, N,N-dimetilformamida, N-metil-2-pirrolidinona y similares; compuestos de azufre como dimetilsulfóxido, sulfolano y similares; y ácidos carboxílicos como ácido fórmico, ácido acético y similares.

Como catalizadores pueden mencionarse, por ejemplo, peróxido de benzoilo, α,α-azobisisobutironitrilo y una mezcla de los mismos.

Un compuesto representado por la fórmula general [4], donde R^5 y R^6 son, cada uno, un átomo de hidrógeno, es decir, un compuesto representado por la fórmula general [24], puede producirse mediante el siguiente proceso.



En la reacción anterior, X^1 e Y tienen las mismas definiciones que las mencionadas con anterioridad.

El compuesto representado por la fórmula general [24] puede

producirse haciendo reaccionar un compuesto [23], haluro de hidrógeno, y formaldehído o paraformaldehído en un solvente en presencia o ausencia de un ácido de Lewis de acuerdo con el método descripto en Org. Synth., III, 557 (1955) o J. Am. Chem. Soc., 72, 2216 (1950), o haciendo reaccionar el compuesto [23] con halogenmetiléter en un solvente en presencia de un ácido de Lewis de acuerdo con el método descripto en J. Am. Chem. Soc., 97, 6155 (1975).

Esta reacción se realiza comúnmente de -40 a 150° C durante 10 minutos a 24 horas.

Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, el haluro de hidrógeno, formaldehído, paraformaldehído, ácido de Lewis o halogenmetiléter se usa preferentemente en una cantidad de 1 a 2 equivalentes por equivalente del compuesto [23]; sin embargo, la cantidad del primero puede variar apropiadamente según la condición de la reacción.

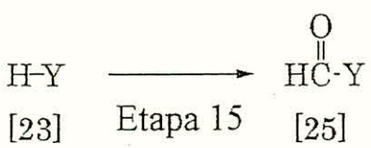
Como ácidos de Lewis pueden mencionarse, por ejemplo, tetracloruro de titanio, cloruro de cinc, cloruro de aluminio y bromuro de cinc.

Como haluros de hidrógeno pueden mencionarse cloruro de

hidrógeno, bromuro de hidrógeno y yoduro de hidrógeno.

Como solventes pueden mencionarse, por ejemplo, hidrocarburos halogenados como dicloroetano, tetracloruro de carbono, cloroformo y similares; hidrocarburos alifáticos como hexano, heptano y similares; éteres como dioxano, tetrahidrofurano y similares; ácidos carboxílicos como ácido acético y similares; disulfuro de carbono; y mezclas de los mismos.

Un compuesto representado por la fórmula general [19], donde R^5 es un átomo de hidrógeno, es decir, un compuesto representado por la fórmula general [25], puede producirse mediante el siguiente proceso.



[23] Etapa 15 [25]

En la reacción anterior, Y tiene la misma definición que la que se indicó con anterioridad.

El compuesto representado por la fórmula general [25] puede producirse haciendo reaccionar el compuesto [23] con N,N-dimetilformamida en presencia de cloruro de fosforilo, fosgeno o cloruro de tionilo en presencia o ausencia de un solvente de acuerdo con el método

de Vilsmeier descripto en Org. Synth., IV, 831 (1963), o haciendo reaccionar el compuesto [23] con un dihalogenmetiléter en un solvente en presencia de un ácido de Lewis y luego ocasionando la hidrólisis de acuerdo con el método descripto en Chem. Ber., 93, 88 (1960).

Esta reacción se realiza comúnmente de -40 a 150° C durante 10 minutos a 24 horas.

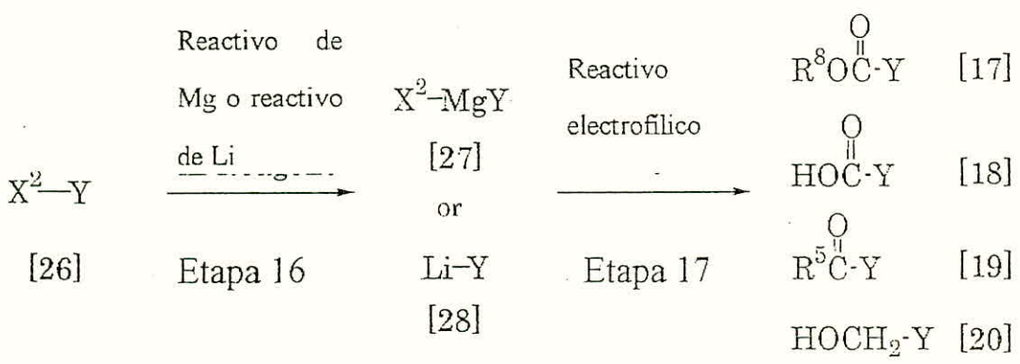
Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, el cloruro de fosforilo, fosgeno, cloruro de tionilo, N,N-dimetilformamida, ácido de Lewis o dihalogenmetiléter se usa preferentemente en una cantidad de 1 a 2 equivalentes por equivalente del compuesto [23]; sin embargo, la cantidad del primero puede variar apropiadamente según la condición de la reacción.

Como ácidos de Lewis pueden mencionarse, por ejemplo, tetracloruro de titanio, tetracloruro de estaño, cloruro de cinc, cloruro de aluminio y bromuro de cinc.

Como solventes pueden mencionarse, por ejemplo, hidrocarburos halogenados como dicloroetano, tetracloruro de carbono, cloroformo y similares; hidrocarburos alifáticos como hexano, heptano y similares; éteres

como dioxano, tetrahidrofurano y similares; ácidos carboxílicos como ácido acético y similares; amidas como N,N-dimetilformamida y similares; disulfuro de carbono; y mezclas de los mismos.

Los compuestos representados por las fórmulas generales [17], [18], [19] y [20] pueden producirse mediante el siguiente proceso.



En la reacción anterior, R^5, R^8 e Y tienen las mismas definiciones que las mencionadas con anterioridad; y X^2 es un átomo de cloro, un átomo de bromo o un átomo de yodo.

Los compuestos representados por las fórmulas generales [17], [18], [19] y [20] pueden producirse haciendo reaccionar un compuesto [26] con un reactivo de magnesio en presencia o ausencia de un solvente para obtener un compuesto [27] y luego haciendo reaccionar el compuesto [27]

con un reactivo electrofílico de acuerdo con el método descripto en J. Org. Chem., 65, 4618 (2000), o haciendo reaccionar el compuesto [26] con n-butillitio en un solvente para obtener un compuesto [28] y luego haciendo reaccionar el compuesto [28] con un reactivo electrofílico de acuerdo con el método descripto en Synth. Commun., 24 (2), 253 (1994).

Esta reacción se realiza comúnmente de -100 a 150° C durante 10 minutos a 24 horas.

Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, la cantidad preferible del reactivo de magnesio o el reactivo de litio es de 1 a 5 equivalentes por equivalente del compuesto [26], y la cantidad preferible del reactivo electrofílico es de 1 a 5 equivalentes; sin embargo, estas cantidades pueden variar apropiadamente según la condición de la reacción.

Como reactivos de magnesio pueden mencionarse, por ejemplo, magnesio metálico, bromuro de isopropilmagnesio y diisopropil-magnesio.

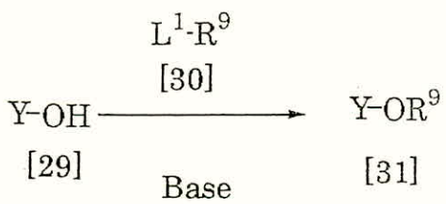
Como reactivos de litio pueden mencionarse, por ejemplo, n-butillitio, sec-butillitio y ter-butillitio.

Como reactivos electrofílico pueden mencionarse, por ejemplo,

ésteres como formato de etilo, cianoformato de etilo, acetato de etilo y similares; haluros ácidos como cloruro de acetilo, cloroformato de metilo y similares; amidas como N,N-dimetilformamida y similares; aldehídos como paraformaldehído y similares; y dióxido de carbono.

Como solventes pueden mencionarse, por ejemplo, hidrocarburos halogenados como dicloroetano, tetracloruro de carbono, cloroformo y similares; hidrocarburos alifáticos como hexano, pentano y similares; éteres como dioxano, tetrahidrofurano y similares; y mezclas de los mismos.

Entre los compuestos representados por las fórmulas generales [4], [17], [18], [19], [20], [22], [23], [26], [29] o [34], un compuesto representado por la fórmula general [31] puede producirse mediante el siguiente proceso.



En la reacción anterior, Y tiene la misma definición que la que se indicó con anterioridad; R^9 es un grupo alquilo, un grupo haloalquilo, un grupo cicloalquilo, un grupo cicloalquilalquilo, un grupo

alcoxicarbonilalquilo, un grupo bencilo opcionalmente sustituido, un grupo alquilo heterocíclico opcionalmente sustituido, un grupo alquenilo, un grupo alquinilo, un grupo alquilsulfonilo, un grupo haloalquilsulfonilo, un grupo heterocíclico aromático opcionalmente sustituido, un grupo fenilsulfonilo opcionalmente sustituido, un grupo acilo, un grupo haloalquilcabonilo, un grupo bencilcarbonilo opcionalmente sustituido o un grupo benzoilo opcionalmente sustituido; y L^1 es un grupo de salida como átomo de halógeno, un grupo alquilsulfonato C1 a C4, un grupo alquilsulfonilo C1 a C4, un grupo bencilsulfonilo opcionalmente sustituido, un grupo fenilsulfonato opcionalmente sustituido, un grupo bencilsulfonato opcionalmente sustituido o similares. Cuando R^9 es un grupo haloalquilo, L^1 es un grupo de salida que tiene una reactividad más elevada que el átomo de halógeno que queda luego de la haloalquilación. Por ejemplo, cuando R^9 es un grupo CHF_2, L^1 es un átomo de cloro o un átomo de bromo; y cuando R^9 es un grupo CH_2CF_3, L^1 es un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo p-toluensulfoniloxi o un grupo metilsulfoniloxi.

El compuesto representado por la fórmula general [31] puede producirse haciendo reaccionar un compuesto [29] con un compuesto [30] en un solvente en presencia de una base.

Esta reacción se realiza comúnmente de 0 a 120° C durante 10

minutos a 24 horas.

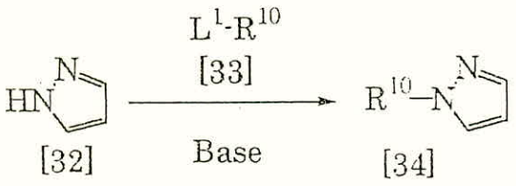
Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, la cantidad del compuesto [30] es de 1 a 20 equivalentes por equivalente del compuesto [29], y la cantidad de la base es de 1 a 3 equivalentes.

Como bases pueden mencionarse, por ejemplo, carbonatos de metales alcalinos como carbonato de sodio, carbonato de potasio y similares; hidróxidos de metales alcalinos como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio y similares; hidruros metálicos alcalinos como hidruro de potasio, hidruro de sodio y similares; alcoholatos de metales alcalinos como etóxido de sodio, metóxido de sodio y similares; y bases orgánicas como 1,8-diazabiciclo[5,4,0]-7-undeceno y similares.

Como solvente pueden mencionarse, por ejemplo, hidrocarburos halogenados como diclorometano, cloroformo y similares; éteres como éter dietílico, tetrahidrofurano y similares; hidrocarburos aromáticos como benceno, tolueno y similares; hidrocarburos alifáticos como hexano, heptano y similares; cetonas como acetona, metilisobutilcetona y similares; ésteres como acetato de etilo, acetato de metilo y similares; amidas como N-metilpirrolidona, N,N-dimetilformamida y similares; compuestos de azufre como dimetilsulfóxido, sulfolano y similares; nitrilos como

acetonitrilo y similares; y mezclas de los mismos.

Entre los compuestos representados por las fórmulas generales [4], [17], [18], [19], [20], [22], [23], [26], [29] o [31], un compuesto representado por la fórmula general [34] puede producirse mediante el siguiente proceso.



En la reacción anterior, L^1 tiene la misma definición que la que se indicó con anterioridad; y R^{10} es un grupo alquilo, un grupo alquilo monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente β, un grupo haloalquilo, un grupo cicloalquilo, un grupo alquenilo, un grupo alquinilo, un grupo alquilsulfinilo, un grupo alquilsulfonilo, un grupo alquilsulfonilo monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente γ, un grupo haloalquilsulfonilo, un grupo fenilo opcionalmente sustituido, un grupo heterocíclico aromático opcionalmente sustituido, un grupo fenilsulfonilo opcionalmente sustituido, un grupo sulfonilo heterocíclico aromático opcionalmente sustituido, un grupo acilo, un grupo haloalquilcarbonilo, un grupo bencilcarbonilo opcionalmente sustituido, un

grupo benzoilo opcionalmente sustituido, un grupo alcoxicarbonilo, un grupo benciloxicarbonilo opcionalmente sustituido, un grupo fenoxicarbonilo opcionalmente sustituido, o un grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos iguales o diferentes seleccionados de grupos alquilo y grupo fenilo opcionalmente sustituido). Los átomos de carbono del anillo pirazol pueden estar sustituidos con 1 a 2 grupos iguales o diferentes seleccionados del grupo sustituyente α.

El compuesto representado por la fórmula general [34] puede producirse haciendo reaccionar un compuesto [32] con un compuesto [33] en un solvente en presencia de una base.

Esta reacción se realiza comúnmente de 0 a 120° C durante 10 minutos a 24 horas.

Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, la cantidad del compuesto [33] es de 1 a 20 equivalentes por equivalente del compuesto [32], y la cantidad de la base es de 1 a 3 equivalentes.

Como bases y solventes pueden mencionarse, por ejemplo, las mismas bases y solventes que se mencionaron en la producción del compuesto [31] a partir del compuesto [29].

La introducción de un grupo trifluorometilo en Y puede realizarse de acuerdo con o sobre la base de, por ejemplo, los métodos descriptos en J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 8, 2293-2299 (1990); J. Fluorine Chem., 50 (3), 411-426 (1990); J. Chem. Soc. Chem. Commun., 18, 1389-1391 (1993); J. Chem. Soc. Chem. Commun., 1, 53-54 (1992); Chem. Lett., 1719-1720 (1981); Chem. Pharm. Bull., 38 (9), 2446-2458 (1990); J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 921-926 (1988); Heterocycles, 37 (2), 775-782 (1994); Tetrahedron Lett., 30 (16), 2133-2136 (1989); J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 2755-2761 (1980); Heterocycles, 22 (1), 117-124 (1984); Eur. J. Med. Chem. Chim. Ter., 24, 249-258 (1989); Acta Chem. Scand. Ser. B, 38 (6), 505-508 (1984); J. Fluorine Chem., 21, 495-514 (1982); J. Chem. Soc. Chem. Commun., 10, 638-639 (1988); J. Fluorine Chem., 67 (1), 5-6 (1994); J. Heterocycl. Chem., 31 (6), 1413-1416 (1994); Chem. Heterocycl. Compd., 30 (5), 576-578 (1994); J. Fluorine Chem., 78 (2), 177-182 (1996); J. Heterocycl. Chem., 34 (2), 551-556 (1997); Tetrahedron, 55 (52), 15067-15070 (1999); y Synthesis, 11, 932-933 (1980).

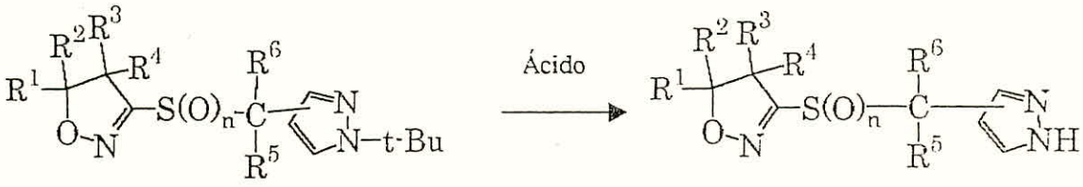
Los compuestos representados por las fórmulas generales [4], [17], [18], [19], [20], [21], [22], [23], [24], [25], [26], [29] y [31] pueden producirse de acuerdo con o sobre la base de, por ejemplo, los métodos descriptos en Methoden der Organischen Chemie, E6a, 16-185 (1994)

cuando Y es un grupo furilo; Methoden der Organischen Chemie, E6a, 186-555 (1994) cuando Y es un grupo tienilo; Methoden der Organischen Chemie, E6a, 556-798 (1994) cuando Y es un grupo pirrolilo; Methoden der Organischen Chemie, E8b, 399-763 (1994) y JP-A-2000-219679 cuando Y es un grupo pirazolilo; Methoden der Organischen Chemie, E8a, 45-225 (1993) cuando Y es un grupo isoxazolilo; Methoden der Organischen Chemie, E8a, 668-798 (1993) cuando Y es un grupo isotiazolilo; Methoden der Organischen Chemie, E8a, 891-1019 (1993) cuando Y es un grupo oxazolilo; Methoden der Organischen Chemie, E8b, 1-398 (1994) cuando Y es un grupo tiazolilo; Methoden der Organischen Chemie, E8c, 1-215 (1994) cuando Y es un grupo imidazolilo; Methoden der Organischen Chemie, E7a, 286-686 (1992) cuando Y es un grupo piridilo; Methoden der Organischen Chemie, E9a, 557-682 (1997) cuando Y es un grupo piridazinilo; Methoden der Organischen Chemie, E9b/1, 1-249 (1998) cuando Y es un grupo pirimidinilo; Methoden der Organischen Chemie, E9b/1, 250-372 (1998) cuando Y es un grupo pirazinilo; Methoden der Organischen Chemie, E9c, 530-796 (1998) cuando Y es un grupo triazinilo; Methoden der Organischen Chemie, E8d, 305-405 y 479-598 (1994) cuando Y es un grupo triazolilo; Methoden der Organischen Chemie, E8c, 397-818 (1994) cuando Y es un grupo oxadiazolilo; Methoden der Organischen Chemie, E8d, 59-304 (1994) cuando Y es un grupo tiadiazolilo; Methoden der Organischen Chemie, E6b1, 33-216

(1994) y solicitud internacional de patente publicada WO-1997/29105 cuando Y es un grupo benzofurilo; Methoden der Organischen Chemie, E6b1, 217-322 (1994) cuando Y es un grupo benzotienilo; Methoden der Organischen Chemie, E6b1,546-848 (1994), Methoden der Organischen Chemie, E6b2, 849-1336 (1994) y solicitud internacional de patente publicada WO-1997/42188-A1 cuando Y es un grupo indolilo; Methoden der Organischen Chemie, E8a, 1020-1194 (1993) cuando Y es un grupo benzoxazolilo; Methoden der Organischen Chemie, E8b, 865-1062 (1994). cuando Y es un grupo benzotiazolilo; Methoden der Organischen Chemie, E8c, 216-391 (1994) cuando Y es un grupo benzimidazolilo; Methoden der Organischen Chemie, E8a, 226-348 (1993) cuando Y es un grupo benzisoxazolilo; Methoden der Organischen Chemie, E8a, 799-852 (1993) cuando Y es un grupo benzisotiazolilo; Methoden der Organischen Chemie, E8b, 764-864 (1994) cuando Y es un grupo indazolilo; Methoden der Organischen Chemie, E7a, 290-570 (1991) cuando Y es un grupo quinolilo; Methoden der Organischen Chemie, E7a, 571-758 (1991) cuando Y es un grupo isoquinolilo; Methoden der Organischen Chemie, E9a, 744-789 (1997) cuando Y es un grupo ftalazinilo; Methoden der Organischen Chemie, E9b/2, 93-265 (1998) cuando Y es un grupo quinoxalinilo; Methoden der Organischen Chemie, E9b/2, 1-192 (1998) cuando Y es un grupo quinazolinilo; Methoden der Organischen Chemie, E9a, 683-743 (1997) cuando Y es un grupo cinnolinilo; y Methoden der Organischen

Chemie, E8d, 406-478 (1994) cuando Y es un grupo benzotriazolilo.

<Proceso de producción 2>



[35] [36]

En la reacción anterior, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5 y R^6 tienen las mismas definiciones que las mencionadas con anterioridad. Los átomos de carbono del anillo pirazol pueden estar sustituidos con 1 a 2 grupos iguales o diferentes seleccionados del grupo sustituyente α.

Un compuesto de la presente invención representado por la fórmula general [36] puede producirse haciendo reaccionar un compuesto [35] de la presente invención, generado mediante el proceso de producción 1, con un ácido en un solvente.

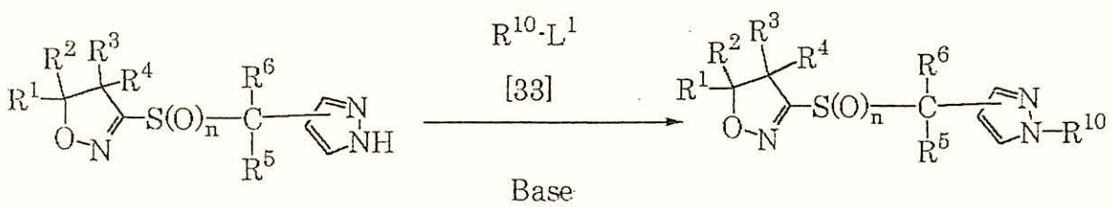
Esta reacción se realiza comúnmente de 0 a 120° C durante 10 minutos a 24 horas.

Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, la cantidad de ácido es de 1 a 10 equivalentes por equivalente del compuesto [35]; sin embargo, la cantidad puede variarse apropiadamente según la condición de la reacción.

Como ácidos pueden mencionarse, por ejemplo, ácido clorhídrico, ácido bromhídrico y ácido trifluoroacético.

Como solventes pueden mencionarse, por ejemplo, hidrocarburos halogenados como dicloroetano, tetracloruro de carbono, clorobenceno, diclorobenceno y similares; amidas como N,N-dimetilacetamida, N,N-dimetilformamida, N-metil-2-pirrolidinona y similares; compuestos de azufre como dimetilsulfóxido, sulfolano y similares; ácidos carboxílicos como ácido fórmico, ácido acético y similares; y agua.

<Proceso de producción 3>



[36] [37]

En la reacción anterior, n, L^1, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6 y R^{10} tienen las

mismas definiciones que las mencionadas con anterioridad. Los átomos de carbono del anillo pirazol pueden estar sustituidos con 1 a 2 grupos iguales o diferentes seleccionados del grupo sustituyente α.

Un compuesto de la presente invención representado por la fórmula general [37] puede producirse haciendo reaccionar el compuesto [36] de la presente invención con el compuesto [33] en un solvente en presencia de una base.

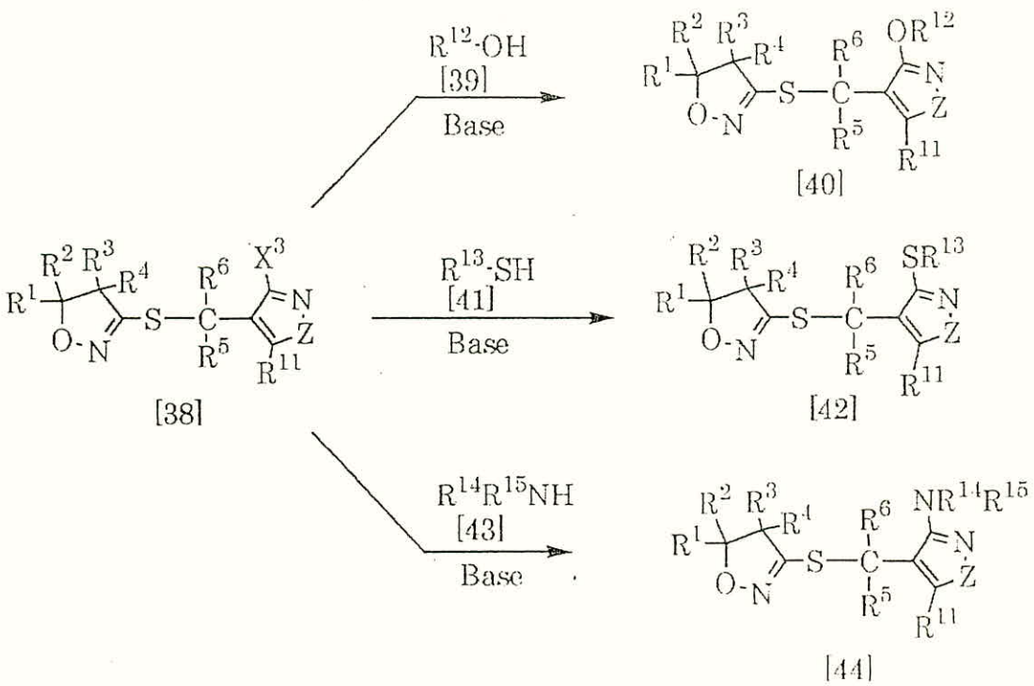
Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, la cantidad del compuesto [33] es de 1 a 3 equivalentes por equivalente del compuesto representado por la fórmula general [36] y la cantidad de la base es de 1 a 3 equivalentes.

Como solventes pueden mencionarse, por ejemplo, éteres como dioxano, tetrahidrofurano (TF) y similares; hidrocarburos halogenados como dicloroetano, tetracloruro de carbono, clorobenceno, diclorobenceno y similares; amidas como N,N-dimetilacetamida, N,N-dimetilformamida, N-metil-2-pirrolidinona y similares; compuestos de azufre como dimetilsulfóxido, sulfolano y similares; hidrocarburos aromáticos como benceno, tolueno, xileno y similares; alcoholes como metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol, ter-butanol y similares; cetonas como

acetona, 2-butanona y similares; nitrilos como acetonitrilo y similares; agua; y mezclas de los mismos.

Como bases pueden mencionarse, por ejemplo, hidruros metálicos como hidruro de sodio y similares; amidas de metales alcalinos como amida de sodio, diisopropilamida de sodio y similares; bases orgánicas como piridina, trietilamina, 1,8-diazabiciclo[5,4,0]-7-undeceno y similares; hidróxidos de metales alcalinos como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio y similares; hidróxidos de metales alcalinotérreos como hidróxido de calcio, hidróxido de magnesio y similares; carbonatos de metales alcalinos como carbonato de sodio, carbonato de potasio y similares; hidrogenocarbonatos de metales alcalinos como hidrogenocarbonato de sodio, hidrogenocarbonato de potasio y similares; y alcoholatos de metal como metóxido de sodio, ter-butóxido de potasio y similares.

<Proceso de producción 4>



En la reacción anterior, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5 y R^6 tienen las mismas definiciones que las mencionadas con anterioridad; R^{11} es un átomo de hidrógeno o un grupo sustituyente α tal como se mencionó con anterioridad; X^3 es un átomo de cloro, un átomo de flúor, un grupo alquilsulfonilo o un grupo bencilsulfonilo opcionalmente sustituido; R^{12} es un grupo alquilo, un grupo haloalquilo, un grupo cicloalquilo, un grupo cicloalquilalquilo, un grupo alquenilo, un grupo alquinilo, un grupo fenilo opcionalmente sustituido, un grupo heterocíclico aromático opcionalmente sustituido, un grupo alcoxicarbonilalquilo, un grupo alquilo heterocíclico opcionalmente sustituido o un grupo bencilo opcionalmente sustituido; R^{13} es un grupo alquilo, un grupo haloalquilo, un grupo fenilo opcionalmente sustituido, un grupo heterocíclico aromático opcionalmente sustituido, un

grupo alcoxicarbonilalquilo o un grupo bencilo opcionalmente sustituido; R^{14} y R^{15} pueden ser iguales o diferentes y cada uno es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo, un grupo fenilo opcionalmente sustituido, un grupo acilo, un grupo haloalquilcarbonilo, un grupo bencilcarbonilo opcionalmente sustituido, un grupo benzoilo opcionalmente sustituido, un grupo alquilsulfonilo, un grupo haloalquilsulfonilo, un grupo bencilsulfonilo opcionalmente sustituido o un grupo fenilsulfonilo opcionalmente sustituido; y Z es un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, $N=CR^{11a}$, $CR^{11a}=N$, $CR^{11a}=CR^{11b}$ o $N-R^{16}$ (donde R^{16} es un átomo de hidrógeno o tiene la misma definición que R^{10}, y R^{11a} y R^{11b} tienen la misma definición que R^{11}).

Los compuestos de la presente invención representados por las fórmulas generales [40], [42] y [44] pueden producirse haciendo reaccionar un compuesto de la presente invención representado por la fórmula general [38] con un compuesto [39], un compuesto [41] y un compuesto [43], respectivamente, en presencia o ausencia de un solvente y, de ser necesario, en presencia de una base.

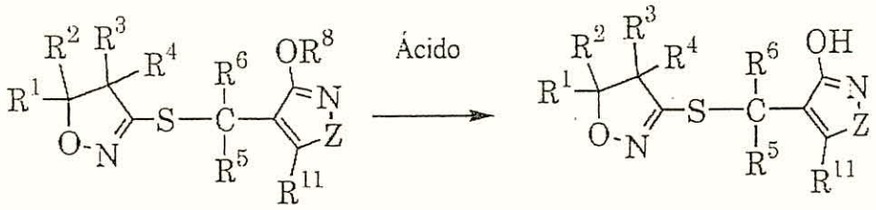
Esta reacción se realiza comúnmente de 20 a 200° C, preferentemente de 30 a 180° C, durante 10 minutos a 48 horas y, de ser necesario, bajo presión.

Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, la cantidad del compuesto [39], el compuesto [41] o el compuesto [43] es de 1 a 20 equivalentes por equivalente del compuesto [38].

Como bases usadas de ser necesario pueden mencionarse, por ejemplo, hidróxidos de metales alcalinos como hidróxido de potasio, hidróxido de sodio y similares; hidruros de metales alcalinos como hidruro de potasio, hidruro de sodio y similares; alcoholatos de metales alcalinos como etóxido de sodio, metóxido de sodio y similares; y bases orgánicas como 1,8-diazabiciclo[5,4,0]-7-undeceno y similares.

Como solventes pueden mencionarse, por ejemplo, hidrocarburos halogenados como cloroformo y similares; éteres como éter dietílico, tetrahidrofurano y similares; hidrocarburos aromáticos como benceno, tolueno y similares; hidrocarburos alifáticos como hexano, heptano y similares; cetonas como acetona, metilisobutilcetona y similares; ésteres como acetato de etilo y similares; amidas como N-metilpirrolidona, N,N-dimetilformamida y similares; compuestos de azufre como dimetilsulfóxido, sulfolano y similares; acetonitrilo; y mezclas de los mismos.

<Proceso de producción 5>



[45] [46]

En la reacción anterior, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^8, R^{11} y Z tienen las mismas definiciones que las mencionadas con anterioridad.

Un compuesto de la presente invención representado por la fórmula general [46] puede producirse haciendo reaccionar un compuesto [45] de la presente invención con un ácido en un solvente.

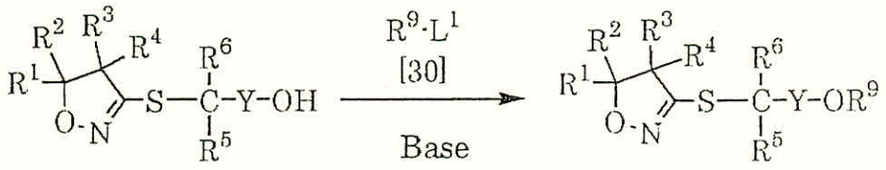
Esta reacción se realiza comúnmente de 0 a 120° C durante 10 minutos a 24 horas.

Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, la cantidad de ácido es, preferentemente, de 1 a 10 equivalentes por equivalente del compuesto [45]; sin embargo, la cantidad puede variarse apropiadamente según la condición de la reacción.

Como ácidos y solventes pueden mencionarse los mismos ácidos y

solventes que los mencionados en el proceso de producción 2.

<Proceso de producción 6>



[47] [48]

En la reacción anterior, Y, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^9 y L^1 tienen las mismas definiciones que las mencionadas con anterioridad. Y puede estar sustituido con 1 a 5 grupos iguales o diferentes seleccionados del grupo sustituyente α.

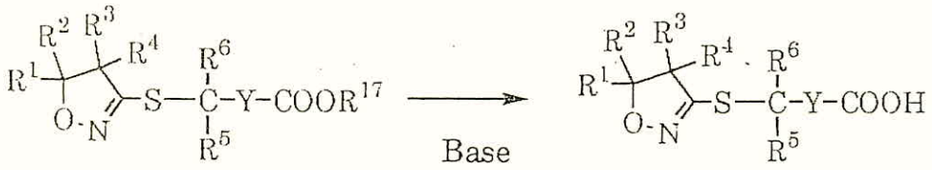
Un compuesto representado por la fórmula general [48] de acuerdo con la presente invención puede producirse haciendo reaccionar un compuesto [47] de la presente invención con el compuesto [30] en un solvente en presencia de una base.

Esta reacción se realiza comúnmente de 0 a 150° C durante 10 minutos a 24 horas.

Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, la cantidad de ácido es, preferentemente, de 1 a 1,2 equivalentes por equivalente del compuesto [47]; sin embargo, la cantidad puede variarse apropiadamente según la condición de la reacción.

Como bases y solventes pueden mencionarse las mismas bases y los mismos solventes que los mencionados en el proceso de producción 3.

<Proceso de producción 7>



[49] [50]

En la reacción anterior, Y, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5 y R^6 tienen las mismas definiciones que las mencionadas con anterioridad; y R^{17} es un grupo alquilo, un grupo bencilo opcionalmente sustituido o un grupo fenilo opcionalmente sustituido. Y puede estar sustituido con 1 a 5 grupos iguales o diferentes seleccionados del grupo sustituyente α.

Un compuesto representado por la fórmula general [50] de acuerdo con la presente invención puede producirse hidrolizando un compuesto [49]

de la presente invención en agua o un solvente mezclado con agua y otro solvente en presencia o ausencia de una base.

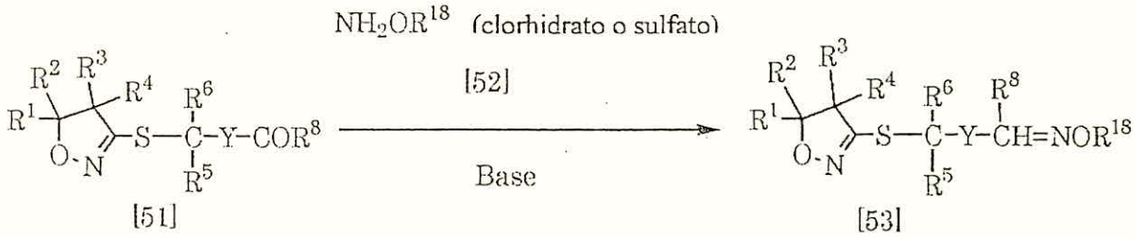
Esta reacción se realiza comúnmente de 0 a 100° C durante 10 minutos a 24 horas.

Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, la cantidad de base, cuando se usa, es preferiblemente de 1 a 2 equivalentes por equivalente del compuesto [49]; sin embargo, la cantidad puede variarse apropiadamente según la condición de la reacción.

Como bases pueden mencionarse, por ejemplo, bases inorgánicas como carbonato de potasio, hidruro de sodio, hidróxido de sodio y similares; y bases orgánicas como 1,8-diazabiciclo[5,4,0]-7-undeceno y similares.

Como otros solventes mezclados con agua pueden mencionarse, por ejemplo, alcoholes como metanol, etanol y similares; éteres como tetrahidrofurano y similares; cetonas como acetona, metilisobutilcetona y similares; amidas como N,N-dimetilformamida y similares; compuestos de azufre como dimetilsulfóxido, sulfolano y similares; acetonitrilo; y mezclas de los mismos.

<Proceso de producción 8>



En la reacción anterior, Y, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6 y R^8 tienen las mismas definiciones que las mencionadas con anterioridad; y R^{18} es un grupo alquilo. Y puede estar sustituido con 1 a 5 grupos iguales o diferentes seleccionados del grupo sustituyente α.

Un compuesto representado por la fórmula general [53] de acuerdo con la presente invención puede producirse haciendo reaccionar un compuesto [51] de la presente invención con un compuesto [52] en un solvente en presencia de una base.

Esta reacción se realiza comúnmente de 0 a 100° C durante 10 minutos a 24 horas.

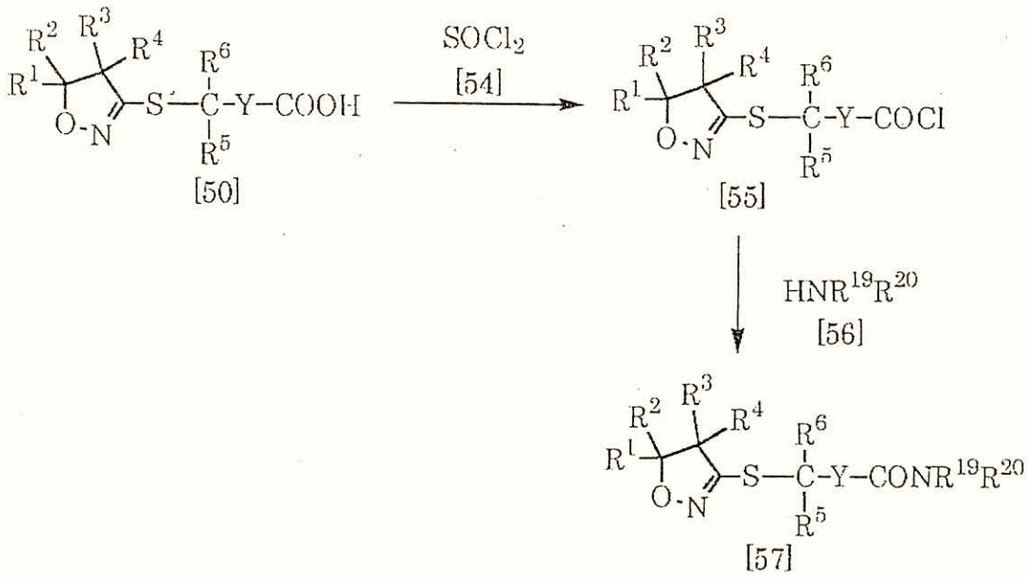
Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, la cantidad preferible de clorhidrato o sulfato del compuesto [52] es de 1 a 5

equivalentes por equivalente del compuesto [51] y la cantidad preferible de base es de 1 a 10 equivalentes; sin embargo, estas cantidades pueden variarse apropiadamente según la condición de la reacción.

Como bases pueden mencionarse, por ejemplo, carbonatos de metal como carbonato de potasio, carbonato de sodio y similares; acetatos de metal como acetato de potasio, acetato de sodio y similares; y bases orgánicas como trietilamina, dimetilamina, 1,8-diazabiciclo[5,4,0]-7-undeceno y similares.

Como solventes pueden mencionarse, por ejemplo, alcoholes como metanol, etanol y similares; éteres como tetrahidrofurano y similares; amidas como N,N-dimetilformamida y similares; agua; y mezclas de los mismos.

<Proceso de producción 9>



En la reacción anterior, Y, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5 y R^6 tienen las mismas definiciones que las mencionadas con anterioridad; y R^{19} y R^{20} son, cada uno, un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo. Y puede estar sustituido con 1 a 5 grupos iguales o diferentes seleccionados del grupo sustituyente α.

Un compuesto representado por la fórmula general [57] de acuerdo con la presente invención puede producirse haciendo reaccionar el compuesto [50] de la presente invención con cloruro de tionilo en presencia o ausencia de un solvente para obtener un compuesto [55] y luego haciendo reaccionar el compuesto [55] con un compuesto [56] en presencia o ausencia de un solvente.

La reacción a partir del compuesto [50] para formar el compuesto

[55] se realiza comúnmente de 0 a 100° C durante 10 minutos a 24 horas.

Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, la cantidad preferible de cloruro de tionilo [54] es de 1 a 100 equivalentes por equivalente del compuesto [50], pero puede variarse apropiadamente según la condición de la reacción.

Como solventes pueden mencionarse, por ejemplo, hidrocarburos halogenados como diclorometano, cloroformo y similares; éteres como éter dietílico, tetrahidrofurano y similares; y hidrocarburos aromáticos como benceno, tolueno y similares.

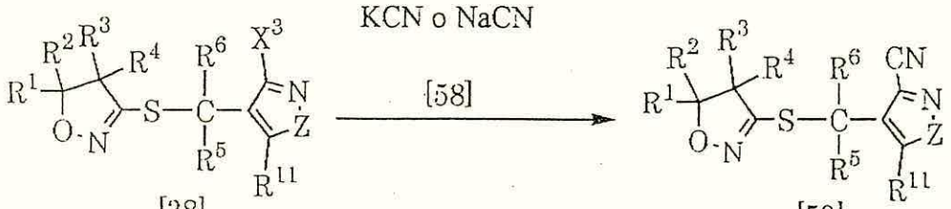
La reacción a partir del compuesto [55] para formar el compuesto [57] se realiza comúnmente de 0 a 100° C durante 10 minutos a 24 horas.

Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, la cantidad preferible del compuesto [56] es de 1 a 100 equivalentes por equivalente del compuesto [55], pero puede variarse apropiadamente según la condición de la reacción.

Como solventes pueden mencionarse, por ejemplo, los mismos solventes que se usaron en la reacción a partir del compuesto [50] para

formar el compuesto [55].

<Proceso de producción 10>



[38] [59]

En la reacción anterior, Z, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^{11} y X^3 tienen las mismas definiciones que las mencionadas con anterioridad.

Un compuesto representado por la fórmula general [59] de acuerdo con la presente invención puede producirse haciendo reaccionar el compuesto [38] de la presente invención con un compuesto [58] en un solvente.

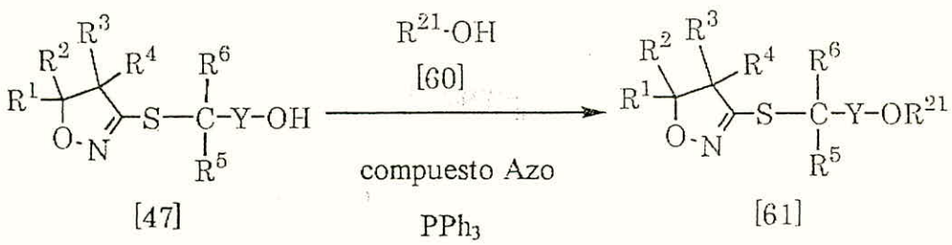
Esta reacción se realiza comúnmente de 0 a 100° C durante 10 minutos a 24 horas.

Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, la cantidad preferible del compuesto [58] es de 1 a 2 equivalentes por equivalente del compuesto [38], pero puede variarse apropiadamente según

la condición de la reacción.

Como solventes pueden mencionarse, por ejemplo, éteres como dioxano, tetrahidrofurano (TF) y similares; hidrocarburos halogenados como dicloroetano, tetracloruro de carbono, clorobenceno, diclorobenceno y similares; amidas como N,N-dimetilacetamida, N,N-dimetilformamida, N-metil-2-pirrolidinona y similares; compuestos de azufre como dimetilsulfóxido, sulfolano y similares; cetonas como acetona, 2-butanona y similares; nitrilos como acetonitrilo y similares; agua; y mezclas de los mismos.

<Proceso de producción 11>



En la reacción anterior, Y, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5 y R^6 tienen las mismas definiciones que las mencionadas con anterioridad; y R^{21} es un grupo alquilo, un grupo haloalquilo, un grupo cicloalquilo, un grupo cicloalquilalquilo, un grupo alquenilo, un grupo alquinilo, un grupo alcoxicarbonilalquilo, un grupo heteroalquilo opcionalmente sustituido o

un grupo bencilo opcionalmente sustituido. Y puede estar sustituido con 1 a 5 grupos iguales o diferentes seleccionados del grupo sustituyente α.

Un compuesto representado por la fórmula general [61] de acuerdo con la presente invención puede producirse haciendo reaccionar el compuesto [47] de la presente invención con un compuesto [60] en presencia de un compuesto azo y trifenilfosfina en un solvente de acuerdo con un método conocido [Synthesis, 1-28 (1981)].

Esta reacción se realiza comúnmente de 0 a 100° C durante 10 minutos a 24 horas.

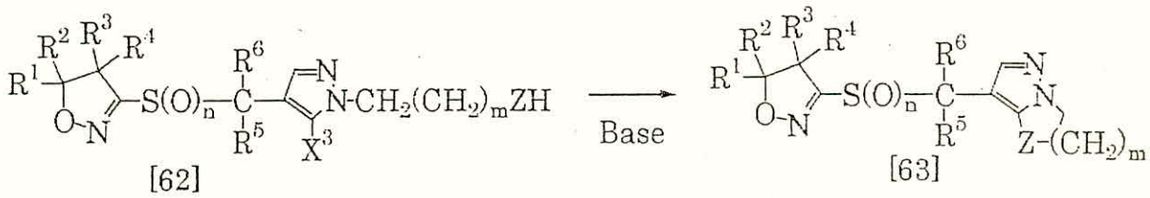
Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, las cantidades del compuesto [60], el compuesto azo y la trifenilfosfina son, preferentemente, de 1 a 1,5 equivalentes cada uno por equivalente del compuesto [47], pero las cantidades pueden variarse apropiadamente según la condición de la reacción.

Como solventes pueden mencionarse, por ejemplo, éteres como dioxano, tetrahidrofurano (TF) y similares; hidrocarburos halogenados como dicloroetano, tetracloruro de carbono, clorobenceno, diclorobenceno y similares; amidas como N,N-dimetilacetamida, N,N-dimetilformamida,

N-metil-2-pirrolidinona y similares; compuestos de azufre como dimetilsulfóxido, sulfolano y similares; hidrocarburos aromáticos como benceno, tolueno, xileno y similares; acetonitrilo; y mezclas de los mismos.

Como compuestos azo pueden mencionarse, por ejemplo, dietilazodicarboxilato y diisopropilazodicarboxilato.

<Proceso de producción 12>



[62] [63]

En la reacción anterior, X^3, n, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6 y Z tienen las mismas definiciones que las mencionadas con anterioridad; y m es un número entero de 1 a 4. El átomo de carbono de la posición 3 del anillo pirazol puede estar sustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente α.

Un compuesto representado por la fórmula general [63] de acuerdo con la presente invención puede producirse haciendo reaccionar un compuesto [62] de la presente invención en presencia de una base en un

solvente.

Esta reacción se realiza comúnmente de 0 a 120° C durante 10 minutos a 24 horas.

Con respecto a las cantidades de reactivos usadas en la reacción, la cantidad de la base preferible es de 1 a 3 equivalentes por equivalente del compuesto representado por la fórmula general [62], pero la cantidad puede variarse apropiadamente según la condición de la reacción.

Como bases y solventes pueden mencionarse las mismas bases y los mismos solventes que los mencionados en el proceso de producción 3.

Incidentalmente, el compuesto de sulfuro mencionado en el proceso de producción 2 ó los procesos de producción 4 a 11 puede convertirse en un compuesto de sulfóxido o un compuesto de sulfona por oxidación de acuerdo con el método descripto en el proceso de producción 1. Además, el compuesto de sulfuro mencionado en el proceso de producción 2 ó los procesos de producción 4 a 11, donde el sustituyente Y está sustituido por un grupo alquiltio C1 a C10, un grupo alquiltio C1 a C10 monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente γ o un grupo haloalquiltio C1 a C4, puede convertirse en un compuesto de sulfóxido o un compuesto

de sulfona de acuerdo con el método descripto en el proceso de producción 1, adicionando una cantidad equimolar a una cantidad en exceso de un agente de oxidación al compuesto de sulfuro; oxidando el sustituyente sustituido en el sustituyente Y (grupo alquiltio C1 a C10, grupo alquiltio C1 a C10 monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente γ o grupo haloalquiltio C1 a C4) al mismo tiempo, y conviertiendo este sustituyente en un grupo sulfóxido o un grupo sulfona.

Luego se hace una descripción específica del proceso de producción del presente compuesto, el método de producción del presente herbicida y la aplicación del presente herbicida por medio de ejemplos. También se hace una descripción del proceso de producción de cada uno de los intermediarios del presente compuesto.

<Ejemplo 1>

Producción de 3-(5-cloro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0001)

Se agregaron 2,1 g de hidrosulfuro de sodio hidratado (pureza: 70 %, 26,2 mmoles) a una solución de 2,3 g (13,1 mmoles) de 5,5-dimetil-3-metilsulfonil-2-isoxazolina disueltos en 20 ml de N,N-dimetilformamida.

La mezcla se agitó durante 2 horas. A esto se agregaron 1,8 g (13,1 mmoles) de carbonato de potasio anhidro, 2,0 g (13,1 mmoles) de Rongalit y 3,6 g (10,5 mmoles) de 4-bromometil-5-cloro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 15 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 2,7 g (rendimiento: 65,5 %) de 3-(5-cloro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina como cristales blancos (punto de fusión: 89 a 90° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,55-7,50 (5H,m), 4,33 (2H,s), 2,83 (2H,s), 1,45 (6H,s)

<Ejemplo 2>

Producción de 3-(5-cloro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-

ilmetilsulfonil)-5,5-dimetil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0002)

Se agregaron 0,63 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 2,6 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 0,4 g (1,0 mmoles) de 3-(5-cloro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina disueltos en 15 ml de cloroformo. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 22 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. Los cristales resultantes se lavaron con hexano para obtener 0,4 g (rendimiento: 83,2 %) de 3-(5-cloro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-5,5-dimetil-2-isoxazolina como cristales blancos (punto de fusión: 132 a 133° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,60-7,51 (5H,m), 4,37 (2H,s), 3,14 (2H,s) 1,53 (6H,s)

<Ejemplo 3>

Producción de 3-(5-cloro-1-metil-3-fenil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfinil)-5,5-dimetil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0003)

Se agregaron 0,87 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 3,54 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 0,85 g (2,53 mmoles) de 3-(5-cloro-1-metil-3-fenil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina disueltos en 30 ml de cloroformo. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 0,48 g (rendimiento: 53,9 %) de 3-(5-cloro-1-metil-3-fenil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfinil)-5,5-dimetil-2-isoxazolina como una sustancia viscosa transparente.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,63-7,60 (2H,m), 7,48-7,37 (3H,m), 4,29 (2H,q), 3,91 (3H,s), 3,12 (1H,d), 2,79 (1H,d), 1,41 (3H,s), 1,35 (3H,s)

<Ejemplo 4>

Producción de 5,5-dimetil-3-(5-fluoro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0021)

Se agregaron 9,3 g de hidrosulfuro de sodio hidratado (pureza: 70 %, 116,3 mmoles) a una solución de 18,7 g (105,7 mmoles) de 5,5-dimetil-3-metilsulfonil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 2-1) disueltos en 300 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó durante 2 horas. El sistema de reacción se enfrió con hielo. A esto se agregó una solución de 30,3 g (93,8 mmoles) de 4-bromometil-5-fuoro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol disueltos en 200 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó a 0° C durante 30 minutos para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para

eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 13,11 g (rendimiento: 37,4 %) de 5,5-dimetil-3-(5-fluoro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina como una sustancia oleosa amarilla.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,65-7,39 (5H,m), 4,24 (2H,s), 2,81 (2H,s), 1,43 (6H,s)

<Ejemplo 5>

Producción de 5,5-dimetil-3-(5-etiltio-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0022)

Se agregaron 0,2 g (4,0 mmoles) de hidróxido de sodio y 1 ml de agua a una solución de 0,25 g (4,0 mmoles) de etantiol disueltos en 10 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. A esto se agregó una solución de 0,5 g (1,4 mmoles) de 5,5-dimetil-3-(5-fluoro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina disueltos en 5 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla resultante se agitó durante 1 hora para provocar una reacción. Luego de

completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 0,6 g (rendimiento: 100 %) de 5,5-dimetil-3-(5-etiltio-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,62-7,47 (5H,m), 4,44 (2H,s), 2,83 (2H,s), 2,50 (2H,q), 1,45 (6H,s), 1,02 (3H,t)

<Ejemplo 6>

Producción de 5,5-dimetil-3-(5-etilsulfonil-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0004)

Se agregaron 1,7 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 6,7 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 0,6 g (1,3 mmoles) de 5,5-dimetil-3-(5-etiltio-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina disueltos en 10 ml de cloroformo. La mezcla se agitó a

temperatura ambiente durante 16 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. Los cristales resultantes se lavaron con hexano para obtener 0,6 g (rendimiento: 93,0 %) de 5,5-dimetil-3-(5-etilsulfonil-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-2-isoxazolina como cristales de color amarillo claro (punto de fusión: 158 a 160° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,58-7,54 (5H,m), 5,16 (2H,s), 3,18 (2H,s), 3,15 (2H,q), 1,55 (6H,s), 1,24 (3H,t)

<Ejemplo 7>

Producción de 5,5-dimetil-3-(5-dimetilamino-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0023)

Se agregaron 0,8 g (6,7 mmoles) de una solución acuosa de dimetilamina al 40 % a una solución de 0,5 g (1,3 mmoles) de 5,5-dimetil-3-(5-fluoro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina disueltos en 10 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó a 100° C durante 9 horas en un tubo sellado. A esto se agregaron 3,0 g (26,6 mmoles) de una solución acuosa de dimetilamina al 40 %, y la mezcla resultante se agitó durante 9 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y después se secó sobre sulfato de sodio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 0,4 g (rendimiento: 80,6 %) de 5,5-dimetil-3-(5-dimetilamino-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,58-7,38 (5H,m), 4,35 (2H,s), 2,82 (2H,s), 2,77 (6H,s), 1,45 (6H,s)

<Ejemplo 8>

Producción de 5,5-dimetil-3-(5-dimetilamino-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0005)

Se agregaron 0,7 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 2,7 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 0,4 g (1,1 mmoles) de 5,5-dimetil-3-(5-dimetilamino-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina disueltos en 10 ml de cloroformo. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 20 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. Los cristales resultantes se lavaron con hexano para obtener 0,2 g (rendimiento: 52,0 %) de 5,5-dimetil-3-(5-dimetilamino-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-2-isoxazolina como un polvo blanco (punto de fusión: 150 a 151° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,61-7,38 (5H,m), 4,75 (2H,s), 3,13 (2H,s), 2,76 (6H,s), 1,53 (6H,s)

<Ejemplo 9>

Producción de 3-(1-ter-butil-5-cloro-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0006)

Se agregaron 21,8 g de hidrosulfuro de sodio (pureza: 70 %, 272,5 mmoles) a una solución de 24,1 g (136,0 mmoles) de 5,5-dimetil-3-metilsulfonil-2-isoxazolina disueltos en 200 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó durante 1 hora. A esto se agregaron 18,8 g (136,2 mmoles) de carbonato de potasio anhidro y 21,0 g (136,2 mmoles) de Rongalit. La mezcla resultante se agitó durante 2 horas. A esto se agregaron, con enfriamiento con hielo, 40 g (125 mmoles) de 4-bromometil-1-ter-butil-5-cloro-3-trifluorometil-1H-pirazol. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de

sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 23,0 g (rendimiento: 57,1 %) de 3-(1-ter-butil-5-cloro-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina como cristales de color rosa claro (punto de fusión: 79,0 a 81,0° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,24 (2H,s), 2,80 (2H,s), 1,71 (9H,s), 1,43 (6H,s)

<Ejemplo 10>

Producción de 3-(5-cloro-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0007)

Se agregaron 19,8 g (53,4 mmoles) de 3-(1-ter-butil-5-cloro-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina a 170 ml de una solución de bromuro de hidrógeno-ácido acético al 25 %. La mezcla se agitó de 40 a 50° C durante 2 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar la terminación de la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se

sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 12,0 g (rendimiento: 60,6 %) de 3-(5-cloro-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina como cristales de color amarillo claro (punto de fusión: 120,0 a 122,0° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,26 (2H,s), 2,81 (2H,s), 1,44 (6H,s)

<Ejemplo 11>

Producción de 3-(5-cloro-1-difluorometil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0008) y 3-(3-cloro-1-difluorometil-5-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0009)

Se agregaron 3,1 g (22,5 mmoles) de carbonato de potasio anhidro a una solución de 2,3 g (7,3 mmoles) de 3-(5-cloro-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina disueltos en 50 ml de N,N-dimetilformamida. Allí se insufló clorodifluorometano. La mezcla resultante se agitó de 130 a 140° C durante 3 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de

reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 0,69 g (rendimiento: 25,8 %) de 3-(5-cloro-1-difluorometil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina como cristales de color amarillo claro (punto de fusión: 41,0 a 42,0° C) y 0,54 g (rendimiento: 20,2 %) de 3-(3-cloro-1-difluorometil-5-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina como un polvo blanco (punto de fusión: 89,0 a 90,0° C).

3-(5-cloro-1-difluorometil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,22 (1H,t), 4,25 (2H,s), 2,80 (2H,s), 0,44 (6H,s)

3-(3-cloro-1-difluorometil-5-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,19 (1H,t), 4,28 (2H,s), 2,80 (2H,s), 1,44 (6H,s)

<Ejemplo 12>

Producción de 3-(5-cloro-1-difluorometil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-5,5-dimetil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0010)

Se agregaron 1,4 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 8,1 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 0,69 g (1,9 mmoles) de 3-(5-cloro-1-difluorometil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina disueltos en 20 ml de cloroformo. La mezcla se agitó durante 1 hora y luego a temperatura ambiente durante 12 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio, agua y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el

solvente allí contenido. El sólido resultante se lavó con n-hexano para obtener 0,4 g (rendimiento: 53,3 %) de 3-(5-cloro-1-difluorometil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-5,5-dimetil-2-isoxazolina como un polvo blanco (punto de fusión: 126,0 a 127,0° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,26 (1H,t), 4,68 (2H,s), 3,11 (2H,s), 1,53 (6H,s)

<Ejemplo 13>

Producción de 3-(3-cloro-1-difluorometil-5-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-5,5-dimetil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0011)

Se agregaron 1,1 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 6,4 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 0,54 g (1,5 mmoles) de 3-(3-cloro-1-difluorometil-5-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina disueltos en 20 ml de cloroformo. La mezcla se agitó durante 1 hora y luego a temperatura ambiente durante 12 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una

solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio, agua y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El sólido resultante se lavó con n-hexano para obtener 0,47 g (rendimiento: 79,7 %) de 3-(3-cloro-1-difluorometil-5-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-5,5-dimetil-2-isoxazolina como un polvo blanco (punto de fusión: 136,0 a 137,0° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,23 (1H,t), 4,71 (2H,s), 3,11 (2H,s), 1,53 (6H,s)

<Ejemplo 14>

Producción de 5,5-dimetil-3-(3-metoxi-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0024)

Se agregaron 3,1 g de hidrosulfuro de sodio hidratado (pureza: 70 %, 22,0 mmoles) a una solución de 3,3 g (17,3 mmoles) de 5,5-dimetil-3-etilsulfonil-2-isoxazolina disueltos en 10 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó durante 2 horas. A esto se agregaron 3,1 g (22,0

mmoles) de carbonato de potasio anhidro, 2,7 g (17,5 mmoles) de Rongalit y 4,0 g (17,5 mmoles) de 4-clorometil-3-metoxi-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 2,8 g (rendimiento: 52,0 %) de 5,5-dimetil-3-(3-metoxi-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina.

<Ejemplo 15>

Producción de 5,5-dimetil-3-(3-hidroxi-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0025)

A 20 ml de una solución de bromuro de hidrógeno - ácido acético al 25 % se agregaron 3,3 g (10,6 mmoles) de 5,5-dimetil-3-(3-metoxi-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina. La mezcla se agitó a 50° C durante 3 horas para provocar una reacción. Luego de completar la

reacción, la mezcla de reacción se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se vertió en agua. Los cristales resultantes se recogieron por filtración, se lavaron con agua y se secaron para obtener 3,1 g (rendimiento: 96,0 %) de la 5,5-dimetil-3-(3-hidroxi-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina deseada.

<Ejemplo 16>

Producción de 5,5-dimetil-3-(3-etoxi-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0026)

Se agregaron 0,20 g (1,3 mmoles) de carbonato de potasio anhidro y 0,20 g (1,5 mmoles) de yoduro de etilo a una solución de 0,30 g (1,0 mmoles) de 5,5-dimetil-3-(3-hidroxi-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina disueltos en 10 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó a 50° C durante 3 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 0,30 g

(rendimiento: 92,0 %) de la 5,5-dimetil-3-(3-etoxi-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina deseada.

<Ejemplo 17>

Producción de 5,5-dimetil-3-(3-etoxi-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0012)

Se agregaron 0,68 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 2,76 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 0,30 g (0,92 mmoles) de 5,5-dimetil-3-(3-etoxi-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina disueltos en 10 ml de cloroformo. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 5 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. Los cristales resultantes se lavaron con hexano para obtener 0,24 g (rendimiento: 73,0 %) de 5,5-dimetil-3-(3-etoxi-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-2-isoxazolina como cristales

blancos (punto de fusión: 124 a 125° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,50 (2H,s), 4,27 (2H,q), 3,86 (3H,s), 3,04 (2H,s), 1,49 (6H,s), 1,39 (3H,t)

<Ejemplo 18>

Producción de 5,5-dimetil-3-(5-fluoro-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0027)

Se agregaron 19,3 g de hidrosulfuro de sodio (pureza: 70 %, 344,6 mmoles) a una solución de 21,3 g (120,3 mmoles) de 5,5-dimetil-3-metilsulfonil-2-isoxazolina disueltos en 200 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó durante 1 hora. A esto se agregaron 16,7 g (121,0 mmoles) de carbonato de potasio anhidro y 18,6 g (120,7 mmoles) de Rongalit. La mezcla resultante se agitó durante 2 horas. A esto se agregó, con enfriamiento con hielo, 31,4 g (120,3 mmoles) de 4-bromometil-5-fluoro-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se

vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 29,0 g (rendimiento: 90,3 %) de 5,5-dimetil-3-(5-fluoro-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina como una sustancia oleosa amarilla.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,24 (2H,s), 3,90 (3H,s), 2,78 (2H,s), 1,42 (6H,s)

<Ejemplo 19>

Producción de 5,5-dimetil-3-(5-metoxi-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0028)

Se agregaron 0,77 g (4,0 mmoles) de metóxido de sodio (una solución de metano al 28 %) a una solución de 0,5 g (1,6 mmoles) de 5,5-dimetil-3-(5-fluoro-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina disueltos en 20 ml de metanol. La mezcla se agitó durante 4 horas a reflujo, para provocar una reacción. Luego de confirmar que la

reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 0,5 g (rendimiento: 96,7 %) de 5,5-dimetil-3-(5-metoxi-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina como una sustancia oleosa amarilla.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,26 (2H,s), 4,07 (3H,s), 3,72 (3H,s), 2,80 (2H,s), 1,43 (6H,s)

<Ejemplo 20>

Producción de 5,5-dimetil-3-(5-metoxi-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0013)

Se agregaron 1,3 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 7,5 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 0,5 g (1,5 mmoles) de 5,5-dimetil-3-(5-metoxi-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina disueltos en 20 ml de cloroformo. La mezcla se

agitó durante 1 hora y luego a temperatura ambiente durante 12 horas para provocar una reacción. Después de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio, agua y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El sólido resultante se lavó con n-hexano para obtener 0,31 g (rendimiento: 58,2 %) de 5,5-dimetil-3-(5-metoxi-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-2-isoxazolina como un polvo blanco (punto de fusión: 113,0 a 114,0° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,60 (2H,s), 4,11 (3H,s), 3,79 (3H,s), 3,10 (2H,s), 1,51(6H,s)

<Ejemplo 21>

Producción de 3-(5-(2-clorofenoxi)-1-metil-3-trifluorometil-1H-piraxzol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0029)

Se agregaron 0,2 g (8,3 mmoles) de hidruro de sodio (pureza: 60 %), con enfriamiento con hielo, a una solución de 0,44 g (3,4 mmoles) de 2-clorofenol disueltos en 30 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó durante 1 hora. A esto se agregaron 0,7 g (2,2 mmoles) de 5,5-dimetil-3-(5-fluoro-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina. La mezcla resultante se agitó de 120 a 130° C durante 5 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 0,63 g (rendimiento: 66,7 %) de 3-(5-(2-clorofenoxi)-1-metil-3-trifluorometil-1H-piraxzol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina como una sustancia oleosa amarilla.

<Ejemplo 22>

Producción de 3-(5-(2-clorofenoxi)-1-metil-3-trifluorometil-1H-piraxzol-4-ilmetilsulfonil)-5,5-dimetil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0014)

Se agregó 1,0 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 5,8 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 0,63 g (1,5 mmoles) de 3-(5-(2-clorofenoxi)-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina disueltos en 20 ml de cloroformo. La mezcla se agitó durante 1 hora y después a temperatura ambiente durante 12 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio, agua y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El sólido resultante se lavó con n-hexano para obtener 0,31 g (rendimiento: 45,7 %) de 3-(5-(2-clorofenoxi)-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-5,5-dimetil-2-isoxazolina como un polvo blanco (punto de fusión: 67,0 a 70,0° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,50-6,91 (4H,m), 4,45 (2H,s), 3,71 (3H,s), 3,03 (2H,s), 1,47 (6H,s)

<Ejemplo 23>

Producción de 3-(5-ciclopentiloxi-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0030)

A una solución de 0,43 g (1,6 mmoles) de trifenilfosfina disueltos en 10 ml de benceno se agregaron 0,14 g (1,6 mmoles) de ciclopentanol, 0,5 g (1,6 mmoles) de 5,5-dimetil-3-(5-hidroxi-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina y 0,7 g (1,6 mmoles) de dietilazodicarboxilato (una solución de tolueno al 40 %). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La capa orgánica resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 0,52 g (rendimiento: 85,2 %) de 3-(5-ciclopentiloxi-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina como una sustancia oleosa transparente incolora.

<Ejemplo 24>

Producción de 3-(5-ciclopentiloxi-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-5,5-dimetil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0015)

Se agregaron 0,85 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 4,9 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 0,52 g (1,4 mmoles) de 3-(5-(ciclopentiloxi-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina disueltos en 20 ml de cloroformo. La mezcla se agitó durante 1 hora y después a temperatura ambiente durante 12 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio, agua y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El sólido resultante se lavó con n-hexano para obtener 0,2 g (rendimiento: 35,5 %) de 3-(5-ciclopentiloxi-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-5,5-dimetil-2-isoxazolina como un polvo blanco (punto de fusión: 113,0 a 114,0° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

5,03 (1H,br), 4,60 (2H,s), 3,73 (3H,s), 3,05 (2H,s), 1,88-1,70 (8H,m), 1,50 (6H,s)

<Ejemplo 25>

Producción de 3-(5-ciano-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0031)

Se agregaron 0,2 g (4,0 mmoles) de cianuro de sodio a una solución de 0,5 g (1,6 mmoles) de 5,5-dimetil-3-(5-fluoro-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina disueltos en 30 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó a 40° C durante 1 hora para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 0,9 g de 3-(5-ciano-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina cruda como una sustancia oleosa amarilla.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,30 (2H,s), 4,08 (3H,s), 2,81 (2H,s), 1,43 (6H,s)

<Ejemplo 26>

Producción de 3-(5-ciano-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-5,5-dimetil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0016)

Se agregaron 2,1 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 12,2 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 0,9 g de 3-(5-ciano-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina (compuesto crudo) disueltos en 50 ml de cloroformo. La mezcla se agitó durante 1 hora y después a temperatura ambiente durante 12 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio, agua y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El sólido resultante se lavó con n-hexano para

obtener 0,43 g (rendimiento: 76,4 %) de 3-(5-ciano-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-5,5-dimetil-2-isoxazolina como un polvo blanco (punto de fusión: 105,0 a 108,0° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,73 (2H,s), 4,16 (3H,s), 3,14 (2H,s), 1,53 (6H,s)

<Ejemplo 27>

Producción de 3-(3,5-dicloro-1-etil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0032)

Se agregaron 0,6 g de hidrosulfuro de sodio (pureza: 70 %, 10,7 mmoles) a una solución de 0,7 g (3,7 mmoles) de 5,5-dimetil-3-etilsulfonil-2-isoxazline disueltos en 30 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó durante 1 hora. A esto se agregaron 0,51 g (3,7 mmoles) de carbonato de potasio anhidro y 0,56 g (3,6 mmoles) de Rongalit. La mezcla resultante se agitó durante 2 horas. A esto se agregó, con enfriamiento con hielo, 0,9 g (3,5 mmoles) de 4-bromometil-3,5-dicloro-1-etil-1H-pirazol. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la

mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 0,8 g (rendimiento: 70,8 %) de 3-(3,5-dicloro-1-etil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina como una sustancia oleosa transparente incolora.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,14 (2H,s), 4,14 (2H, q), 2,81 (2H,s), 1,43 (6H,s), 1,42 (3H,t)

<Ejemplo 28>

Producción de 3-(3,5-dicloro-1-etil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-5,5-dimetil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0017)

Se agregaron 2,0 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 11,6 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 0,8 g (2,6 mmoles) de 3-(3,5-dicloro-1-etil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-

isoxazolina disueltos en 20 ml de cloroformo. La mezcla se agitó durante 1 hora y después a temperatura ambiente durante 12 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio, agua y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El sólido resultante se lavó con n-hexano para obtener 0,41 g (rendimiento: 46,6 %) de 3-(3,5-dicloro-1-etil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-5,5-dimetil-2-isoxazolina como un polvo blanco (punto de fusión: 105,0 a 107,0° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,48 (2H,s), 4,19 (2H,q), 3,05 (2H,s), 1,51 (6H,s), 1,45 (3H,t)

<Ejemplo 29>

Producción de 3-(5-cloro-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0020)

Se agregaron 1,2 g de hidrosulfuro de sodio hidratado (pureza: 70 %, 15,0 mmoles) a una solución de 1,9 g (10,0 mmoles) de 5,5-dimetil-3-etilsulfonil-2-isoxazolina disueltos en 30 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó durante 2 horas. A esto se agregaron 2,1 g (15,0 mmoles) de carbonato de potasio anhidro, 2,3 g (15,0 mmoles) de Rongalit y 2,6 g (10,0 mmoles) de 4-bromometil-5-cloro-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 15 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 2,1 g (rendimiento: 68,0 %) de 3-(5-cloro-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina como un líquido viscoso incoloro (n_D^{20} = 1,5183).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

6,70 (1H,t, J = 54,2 Hz), 4,24 (2H,s), 3,86 (3H,s), 2,80 (2H,s), 1,42 (6H,s)

<Ejemplo 30>

Producción de 3-(5-cloro-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-5,5-dimetil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 3-0018)

Se agregaron 3,6 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 14,5 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 1,8 g (5,8 mmoles) de 3-(5-cloro-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina disueltos en 15 ml de cloroformo. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 22 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y después se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. Los cristales resultantes se lavaron con hexano para obtener 1,7 g (rendimiento: 85,9 %) de 3-(5-cloro-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-ilmetilsulfonil)-5,5-dimetil-2-isoxazolina como cristales blancos (punto de fusión: 78 a 79° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

6,80 (1H,t, J = 54,8 Hz), 4,60 (2H,s), 3,91 (3H,s), 3,08 (2H,s), 1,51 (6H,s)

<Ejemplo 31>

Producción de 5,5-dimetil-3-(5-metil-3-trifluorometilisoxazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina (presente compuesto N° 4-0003)

Se agregaron 0,4 g de hidrosulfuro de sodio hidratado (pureza: 70 %, 4,6 mmoles) a una solución de 0,4 g (2,3 mmoles) de 5,5-dimetil-3-metilsulfonil-2-isoxazolina disueltos en 10 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó durante 2 horas. A esto se agregaron 0,3 g (2,3 mmoles) de carbonato de potasio, 0,4 g (2,3 mmoles) de Rongalit y 0,5 g (1,8 mmoles) de 4-bromometil-5-metil-3-trifluorometilisoxazol. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 14 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El

residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 0,4 g (rendimiento: 70,0 %) de 5,5-dimetil-3-(5-metil-3-trifluorometilisoxazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,11 (2H,s), 2,77 (2H,s), 2,54 (3H,s), 1,42 (6H,s)

<Ejemplo 32>

Producción de 5,5-dimetil-3-(5-metil-3-trifluorometilisoxazol-4-ilmetilsulfonil)-2-isoxazolina (presente compuesto N° 4-0001)

Se agregaron 0,8 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 3,2 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 0,4 g (1,3 mmoles) de 5,5-dimetil-3-(5-metil-3-trifluorometilisoxazol-4-ilmetiltio)-2-isoxazolina disueltos en 10 ml de cloroformo. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 4 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de

hidrogenocarbonato de sodio y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. Los cristales resultantes se lavaron con hexano para obtener 0,4 g (rendimiento: 95,0 %) de 5,5-dimetil-3-(5-metil-3-trifluorometilisoxazol-4-ilmetilsulfonil)-2-isoxazolina como cristales blancos (punto de fusión: 135 a 136° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,54 (2H,s), 3,11 (2H,s), 2,61 (3H,s), 1,52 (6H,s)

<Ejemplo 33>

Producción de [(5-cloro-3-metil-isotiazol-4-il)-metiltio]-5,5-dimetil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 4-0004)

Se agregaron 0,82 g de hidrosulfuro de sodio (pureza: 70 %, 10,00 mmoles) a temperatura ambiente a una solución de 0,89 g (5,00 mmoles) de 5,5-dimetil-3-metilsulfonil-2-isoxazolina disueltos en 10 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó durante 2 horas. A esto se agregaron 0,70 g (5,00 mmoles) de carbonato de potasio anhidro, 0,78 g (5,00

mmoles) de Rongalit y 0,91 g (5,00 mmoles) de 5-cloro-4-clorometil-3-metilisotiazol. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 1,38 g (rendimiento: cuantitativo) de [(5-cloro-3-metil-isotiazol-4-il)-metiltio]-5,5-dimetil-2-isoxazolina.

<Ejemplo 34>

Producción de [(5-cloro-3-metil-isotiazol-4-il)-metilsulfonil]-5,5-dimetil-2-isoxazolina (presente compuesto N° 4-0002)

Se agregaron 2,96 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 12,00 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 1,38 g (5,00 mmoles) de [(5-cloro-3-metil-isotiazol-4-il)-metiltio]-5,5-dimetil-2-isoxazolina disueltos en 20 ml de cloroformo. La mezcla se agitó durante 1 hora y después a temperatura ambiente durante toda la noche para provocar

una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,65 g (rendimiento: 47,0 %) de [(5-cloro-3-metil-isotiazol-4-il)-metilsulfonil]-5,5-dimetil-2-isoxazolina como un polvo de color amarillo claro (punto de fusión: 113 a 114° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

8,89 (1H,s), 4,67 (2H,s), 3,05 (2H,s), 2,59 (3H,s), 1,51 (6H,s)

<Ejemplo 35>

Producción de 5,5-dimetil-3-[2,5-dimetil-4-(1-metoxiiminoetil)-tiofen-3-ilmetiltio]-2-isoxazolina (presente compuesto N° 2-0002)

Se agregaron 0,57 g (6,8 mmoles) de clorhidrato de O-metilhidroxilamina y 0,56 g (6,8 mmoles) de acetato de sodio a una

solución de 1,0 g (3,4 mmoles) de 3-(4-acetil-2,5-dimetiltiofen-3-ilmetiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina disueltos en 50 ml de etanol. La mezcla se agitó durante 5 horas a reflujo, para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 0,4 g (36,4 %) de 5,5-dimetil-3-[2,5-dimetil-4-(1-metoxiiminoetil)-tiofen-3-ilmetiltio]-2-isoxazolina como una sustancia oleosa amarilla.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,21 (2H,s), 3,95 (3H,s), 2,76 (2H,s), 2,38 (3H,s), 2,34 (3H,s), 2,13 (3H,s), 1,42 (6H,s)

<Ejemplo 36>

Producción de 5,5-dimetil-3-[2,5-dimetil-4-(1-metoxiiminoetil)-tiofen-3-

ilmetilsulfonil]-2-isoxazolina (presente compuesto N° 2-0001)

Se agregaron 0,61 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 3,5 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 0,4 g (1,2 mmoles) de 5,5-dimetil-3-[2,5-dimetil-4-(1-metoxiiminoetil)-tiofen-3-ilmetiltio]-2-isoxazolina disueltos en 30 ml de cloroformo. La mezcla se agitó durante 1 hora y después a temperatura ambiente durante 12 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio, agua y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 0,35 g (80 %) de 5,5-dimetil-3-[2,5-dimetil-4-(1-metoxiiminoetil)-tiofen-3-ilmetilsulfonil]-2-isoxazolina como cristales blancos (punto de fusión: 95,0 a 96,0° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,79 (2H,s), 3,95 (3H,s), 2,93 (2H,s), 2,42 (3H,s), 2,37 (3H,s), 2,17 (3H,s), 1,47 (6H,s)

<Ejemplo 37>

Producción de 5,5-dimetil-3-(4-trifluorometil-piridin-3-ilmetiltio)-2-isoxazolina (presente compuesto N° 7-0003)

Se agregaron 0,26 g de hidrosulfuro de sodio (pureza: 70 %, 4,6 mmoles) a una solución de 0,3 g (1,6 mmoles) de 5,5-dimetil-3-etilsulfonil-2-isoxazolina disueltos en 20 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó durante 1 hora. A esto se agregaron 0,22 g (1,6 mmoles) de carbonato de potasio anhidro y 0,25 g (1,6 mmoles) de Rongalit. La mezcla resultante se agitó durante 2 horas. A esto se agregaron, con enfriamiento con hielo, 0,3 g (1,3 mmoles) de 3-bromometil-4-trifluorometil-piridina. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en

columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 0,45 g (rendimiento: 98,9 %) de 5,5-dimetil-3-(4-trifluorometil-piridin-3-ilmetiltio)-2-isoxazolina como una sustancia oleosa amarilla.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

8,98 (1H,s), 8,70 (1H,d), 7,51 (1H,d), 4,47 (2H,s), 2,79 (2H,s), 1,43 (6H,s)

<Ejemplo 38>

Producción de 5,5-dimetil-3-(4-trifluorometil-piridin-3-ilmetilsulfonil)-2-isoxazolina (presente compuesto N° 7-0001) y 5,5-dimetil-3-(4-trifluorometil-piridina-N-óxido-3-ilmetilsulfonil)-2-isoxazolina (presente compuesto N° 7-0002)

Se agregaron 0,77 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 4,5 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 0,45 g (1,6 mmoles) de 5,5-dimetil-3-(4-trifluorometil-piridin-3-ilmetiltio)-2-isoxazolina disueltos en 20 ml de cloroformo. La mezcla se agitó durante 1 hora y después a temperatura ambiente durante 12 horas para provocar una

reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio, agua y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 0,06 g (rendimiento: 12,0 %) de 5,5-dimetil-3-(4-trifluorometil-piridin-3-ilmetilsulfonil)-2-isoxazolina como cristales de color amarillo claro (punto de fusión: 77,0 a 80,0° C) y 0,12 g (rendimiento: 23,1 %) de 5,5-dimetil-3-(4-trifluorometil-piridin-N-óxido-3-ilmetilsulfonil)-2-isoxazolina como cristales blancos (punto de fusión: 114,0 a 116,0° C).

5,5-dimetil-3-(4-trifluorometil-piridin-3-ilmetilsulfonil)-2-isoxazolina

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

8,98 (1H,s), 8,84 (1H,d), 7,64 (1H,d), 4,92 (2H,s), 3,09 (2H,s), 1,52 (6H,s)

5,5-dimetil-3-(4-trifluorometil-piridin-N-óxido-3-ilmetilsulfonil)-2-isoxazolina

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

8,50 (1H,s), 8,25 (1H,d), 7,59 (1H,d), 4,81 (2H,s), 3,12 (2H,s), 1,53 (6H,s)

<Ejemplo 39>

Producción de 5,5-dimetil-[(4-metoxi-6-trifluorometilpirimidin-5-il)-metiltio]-2-isoxazolina (presente compuesto N° 8-0002)

Se agregaron 0,32 g de hidrosulfuro de sodio (pureza: 70 %, 4,00 mmoles), a temperatura ambiente, a una solución de 0,35 g (2,00 mmoles) de 5,5-dimetil-3-metilsulfonil-2-isoxazolina disueltos en 10 ml de dimetilformamida. La mezcla se agitó durante 2 horas. A la mezcla de reacción se agregaron 0,28 g (2,00 mmoles) de carbonato de potasio anhidro, 0,31 g (2,00 mmoles) de Rongalit y 0,45 g (2,00 mmoles) de 5-clorometil-4-metoxi-6-trifluorometilpirimidina. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción

se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,55 g (rendimiento: 85,9 %) de 5,5-dimetil-[(4-metoxi-6-trifluorometilpirimidin-5-il)-metiltio]-2-isoxazolina.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

8,81 (1H,s), 4,44 (2H,d), 4,12 (3H,s), 2,81 (2H,s), 1,45 (6H,s)

<Ejemplo 40>

Producción de 5,5-dimetil-[(4-metoxi-6-trifluorometilpirimidin-5-il)-metilsulfonil]-2-isoxazolina (presente compuesto N° 8-0001)

Se agregaron 1,05 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 4,28 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 0,55 g (1,71 mmoles) de 5,5-dimetil-[(4-metoxi-6-trifluorometilpirimidin-5-il)-metiltio]-2-isoxazolina disueltos en 20 ml de cloroformo. La mezcla se agitó durante 1 hora y después a temperatura ambiente durante 4 horas para

provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,45 g (rendimiento: 75,0 %) de 5,5-dimetil-[(4-metoxi-6-trifluorometilpirimidin-5-il)-metilsulfonil]-2-isoxazolina como cristales blancos como plumas (punto de fusión: 175 a 176° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

8,89 (1H,s), 5,00 (2H,d), 4,11 (3H,s), 3,11 (2H,s), 1,53 (6H,s)

<Ejemplo 41>

Producción de 3-(5,5-dimetil-2-isoxazolin-3-iltiometil)-2-trifluorometil-6,7-dihidro-5H-pirazolo[5,1-b][1,3]oxazina (presente compuesto N° 3-0033)

Una solución de 0,82 g (2,3 mmoles) de 3-[5-cloro-1-(3-hidroxipropil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetiltio]-5,5-dimetil-2-isoxazol disueltos en 5 ml de N,N-dimetilformamida se agregaron por goteo a una suspensión de 0,11 g (2,8 mmoles) de hidruro de sodio en 15 ml de N,N-dimetilformamida. Después de completar la adición por goteo, la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos, luego se calentó a 100° C, y se agitó durante 1 hora para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de ácido cítrico y una solución acuosa de cloruro de sodio, y después se secaron sobre sulfato de magnesio. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para obtener 0,77 g (rendimiento: 100 %) de 3-(5,5-dimetil-2-isoxazolin-3-iltiometil)-2-trifluorometil-6,7-dihidro-5H-pirazolo[5,1-b][1,3]oxazina.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,37 (2H,t), 4,19 (2H,t), 4,15 (2H,s), 2,80 (2H,s), 2,31 (2H,m), 1,42 (6H,s)

<Ejemplo 42>

Producción de 3-(5,5-dimetil-2-isoxazolin-3-ilsulfonilmetil)-2-trifluorometil-6,7-dihidro-5H-pirazolo[5,1-b][1,3]oxazina (presente compuesto N° 3-0019)

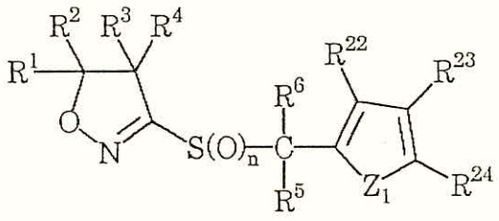
Se agregaron 1,25 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 5,1 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 0,77 g (2,3 mmoles) de 3-(6,7-dihidro-3-trifluorometil-5H-pirazolo[5,1-b][1,3]oxazin-4-il-metiltio)-5,5-dimetil-2-isoxazolina disueltos en 20 ml de cloroformo. La mezcla se agitó durante 1 hora y después a temperatura ambiente durante 12 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio, agua y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,36 g (rendimiento: 43 %) de 3-(5,5-dimetil-2-isoxazolin-3-ilsulfonilmetil)-2-trifluorometil-6,7-dihidro-5H-pirazolo[5,1-b][1,3]oxazina como un polvo blanco (punto de fusión: 151,0 a 152,0° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,47 (2H,s), 4,40 (2H,t), 4,23 (2H,t), 3,09 (2H,s), 2,34 (2H,m), 1,50 (6H,s)

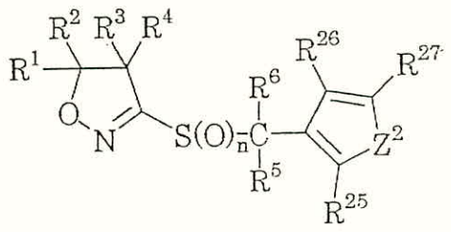
Los números de los compuestos indicados en las tablas 11 a 20 se refieren a los ejemplos.

Tabla 11



Nº de compuesto	R^1	R^2	R^3	R^4	n	R^5	R^6	Z_1	R^{22}	R^{23}	R^{24}	Punto de fusión (°C) o índice de refracción (n_D^{20})
1-0001	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	H	H	66-68
1-0002	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	Me	H	87-88
1-0003	Me	Me	H	H	2	H	H	S	H	H	Me	95-97
1-0004	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	H	H	70-72
1-0005	Me	Me	H	H	2	H	H	S	H	H	Cl	118-119
1-0006	Me	Me	H	H	2	H	H	O	H	H	H	Imposible de medir
1-0007	Me	Me	H	H	2	H	H	O	H	H	C(=O)OMe	124-125

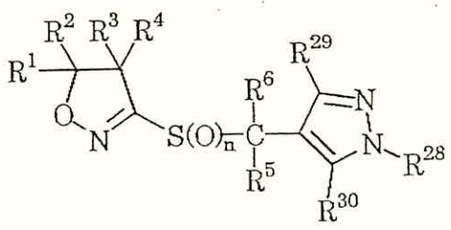
Tabla 12



Compuesto Nº.	R^1	R^2	R^3	R^4	n	R^5	R^6	Z^2	R^{25}	R^{26}	R^{27}	Punto de fusión (°C) o índice de refracción (n_D^{20})
2-0001	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=NOMe)Me	Me	95-96
2-0002	Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=NOMe)Me	Me	
2-0003	Me	Me	H	H	2	H	H	S	H	H	H	99-101
2-0004	Me	Me	H	H	2	H	H	S	H	Ome	H	96-97
2-0005	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	H	Cl	125-127
2-0006	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl	158-160
2-0007	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	Me	Me	117-117
2-0008	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)Me	Me	146-148
2-0009	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Ph	C(=O)Me	Me	1,5730
2-0010	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Ph	C(=NOMe)Me	Me	129-131
2-0011	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	C(=O)Ome	Cl	157-158

2-0012	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	C(=O)NHMe	Cl	178-180
2-0013	Me	Me	H	H	2	H	H	O	H	H	H	58-61
2-0014	Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	H	Cl	180-181

Tabla 13



Compuesto Nº.	R^1	R^2	R^3	R^4	n	R^5	R^6	R^{29}	R^{28}	R^{30}	Punto de fusión (°C) o índice de refracción (n_D^{20})
3-0001	Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	Cl	89-90
3-0002	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	Cl	132-133
3-0003	Me	Me	H	H	1	H	H	Ph	Me	Cl	Imposible de medir
3-0004	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	SO_2Et	158-160
3-0005	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	$N(Me)_2$	150-151
3-0006	Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Bu-t	Cl	79-81
3-0007	Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	H	Cl	120-122
3-0008	Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	CHF_2	Cl	41-42
3-0009	Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CHF_2	CF_3	89-90
3-0010	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CHF_2	Cl	126-127
3-0011	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CHF_2	CF_3	136-137
3-0012	Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	Me	CF_3	124-125
3-0013	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OMe	113-114
3-0014	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(2-Cl)Ph	67-70
3-0015	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OPen-c	113-114
3-0016	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	CN	105-108
3-0017	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Et	Cl	105-107

3-0018	Me	Me	H	H	2	H	H	CHF_2	Me	Cl	78-79
3-0019	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$-(CH_2)_3O-$		151-152
3-0020	Me	Me	H	H	0	H	H	CHF_2	Me	Cl	1,5183
3-0021	Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	F	
3-0022	Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	SEt	
3-0023	Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Ph	N(Me)2	
3-0024	Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Me	CF_3	
3-0025	Me	Me	H	H	0	H	H	OH	Me	CF_3	
3-0026	Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	Me	CF_3	
3-0027	Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	F	
3-0028	Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OMe	
3-0029	Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	O(2-Cl)Ph	
3-0030	Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	OPen-c	
3-0031	Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Me	CN	
3-0032	Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Et	Cl	
3-0033	Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$-(CH_2)_3O-$		
3-0034	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	H	Cl	138-140
3-0035	Me	Me	H	H	2	H	H	H	Me	Cl	105-106
3-0036	Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	Me	148-150
3-0037	Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	Cl	99-101
3-0038	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	Cl	143-145
3-0039	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	Cl	115-116
3-0040	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	CF_3	120-122
3-0041	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	F	79-82
3-0042	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OH	90-92
3-0043	Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	CF_3	125-126
3-0044	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OEt	92-94
3-0045	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OPr-i	69-71
3-0046	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OPr	82-83
3-0047	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OBu-t	86-89
3-0048	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OBu	61-62
3-0049	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OHex-c	124-125
3-0050	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OCH_2Pr-c	93-94
3-0051	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OCH_2Pen-c	112-113
3-0052	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OCH_2Hex-c	56-59

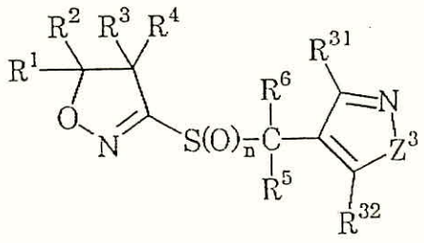
3-0053	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$OCH_2C\equiv CH$	92-93
3-0054	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	$OCHF_2$	129-130
3-0055	Me	Me	H	H	2	H	H	$OCHF_2$	Me	CF_3	Imposible de medir
3-0056	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OCH_2CHF_2	89-91
3-0057	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OCH_2CF_3	93-95
3-0058	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OCH_2CN	1,4872
3-0059	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OCH_2Ph	79-81
3-0060	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OPh	122-123
3-0061	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(3-Cl)Ph	Imposible de medir
3-0062	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(3-OMe)Ph	1,5059
3-0063	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(4-Cl)Ph	68-69
3-0064	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(4-Me)Ph	132-133
3-0065	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	O(4-OMe)Ph	115-117
3-0066	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	OC(=O)Me	130-131
3-0067	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SO_2Me	168-169
3-0068	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SEt	100-102
3-0069	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SO_2Et	107-108
3-0070	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	SO_2Ph	166-168
3-0071	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Me	Me	105-107
3-0072	Me	Me	H	H	2	H	H	Ph	Me	Cl	127-129
3-0073	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Et	Cl	111-112
3-0074	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Et	CF_3	112-114
3-0075	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pr-i	Cl	157-158
3-0076	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Pr-i	CF_3	135-136
3-0077	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pr	Cl	89-90
3-0078	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Pr	CF_3	111-113
3-0079	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Bu-t	H	101-103
3-0080	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Bu-t	Cl	118-119
3-0081	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Bu-s	Cl	110-112
3-0082	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Bu-s	CF_3	110-111
3-0083	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Bu-i	Cl	96-98
3-0084	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Bu-i	CF_3	140-141
3-0085	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Bu	Cl	89-90

3-0086	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Bu	CF_3	108-110
3-0087	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Ph	Cl	132-133
3-0088	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2Ph	CF_3	118-120
3-0089	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pen-c	Cl	130-131
3-0090	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Pen-c	CF_3	147-148
3-0091	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Hex-c	Cl	151-152
3-0092	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Pr-c	Cl	93-95
3-0093	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2Pr-c	CF_3	129-130
3-0094	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	1-ciclopropiletilo	Cl	87-89
3-0095	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	1-ciclopropiletilo	CF_3	121-123
3-0096	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2(2-metilciclopropilo)	Cl	102-103
3-0097	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2(2-metilciclopropilo)	CF_3	118-119
3-0098	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Bu-c	Cl	94-96
3-0099	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2Bu-c	CF_3	141-142
3-0100	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Pen-c	Cl	127-129
3-0101	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2Pen-c	CF_3	146-149
3-0102	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2Hex-c	Cl	152-154
3-0103	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2Hex-c	CF_3	115-117
3-0104	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2CH=CH_2$	Cl	78-80
3-0105	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2CH=CH_2$	CF_3	105-106
3-0106	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CH$	Cl	73-74
3-0107	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2C\equiv CH$	CF_3	108-109
3-0108	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CHMeC\equiv CH$	Cl	95-96
3-0109	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CHMeC\equiv CH$	CF_3	116-118
3-0110	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C\equiv CMe$	Cl	114-115
3-0111	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2C\equiv CMe$	CF_3	115-116
3-0112	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CHF_2	OMe	72-74
3-0113	Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	CHF_2	CF_3	108-109
3-0114	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2CHF_2	Cl	99-100
3-0115	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2CHF_2	CF_3	107-109
3-0116	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2CF_3	Cl	135-136
3-0117	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2CF_3	CF_3	112-115
3-0118	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2OMe	Cl	87-89
3-0119	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2OMe	CF_3	125-128

3-0120	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2OEt	Cl	97-98
3-0121	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2OEt	CF_3	128-129
3-0122	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2CH_2OH	Cl	79-81
3-0123	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2CH_2OH	CF_3	93-94
3-0124	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2CH_2OMe	Cl	102-104
3-0125	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2CH_2OMe	CF_3	118-119
3-0126	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2CH_2OEt	Cl	56-59
3-0127	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2CH_2OEt	CF_3	118-119
3-0128	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2SMe	Cl	103-105
3-0129	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2SMe	CF_3	128-129
3-0130	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2SO_2Me	Cl	157-159
3-0131	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2SO_2Me	CF_3	165-166
3-0132	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2CH_2SO_2Me$	Cl	155-157
3-0133	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2CH_2SO_2Me$	CF_3	166-168
3-0134	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2CN	Cl	128-129
3-0135	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2CN	CF_3	117-118
3-0136	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)OEt$	Cl	127-129
3-0137	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2C(=O)OEt$	CF_3	143-145
3-0138	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)NH_2$	Cl	173-174
3-0139	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2C(=O)NH_2$	CF_3	182-183
3-0140	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)N(Me)_2$	Cl	142-143
3-0141	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2C(=O)N(Me)_2$	CF_3	181-182
3-0142	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)Me$	Cl	148-149
3-0143	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$CH_2C(=O)Me$	CF_3	163-164
3-0144	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$CH_2CH_2C(=O)Me$	Cl	89-91
3-0145	Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Ph	Me	140-141
3-0146	Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Ph	Cl	124-125
3-0147	Me	Me	H	H	2	H	H	Et	Ph	Cl	112-113
3-0148	Me	Me	H	H	2	H	H	Pr	Ph	Cl	122-123
3-0149	Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Ph	Cl	116-117
3-0150	Me	Me	H	H	2	H	H	Bu-t	Ph	Cl	100-102
3-0151	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	H	111-112
3-0152	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	Me	129-132
3-0153	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	CF_3	112-113
3-0154	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	F	90-91

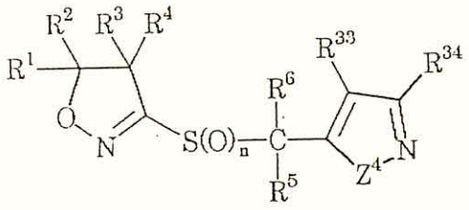
3-0155	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OMe	104-106
3-0156	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OEt	129-131
3-0157	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OPr-i	86-88
3-0158	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OPr	117-118
3-0159	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	OBu-t	105-108
3-0160	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	$OCHF_2$	90-92
3-0161	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	SO_2Me	167-168
3-0162	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	CN	113-115
3-0163	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(2-Cl)Ph	Cl	153-154
3-0164	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(3-Cl)Ph	Cl	106-107
3-0165	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(4-Cl)Ph	Cl	142-143
3-0166	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(4-F)Ph	Cl	135-138
3-0167	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(4-OMe)Ph	Cl	136-138
3-0168	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(4-Me)Ph	Cl	129-130
3-0169	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(4-NO_2)Ph	Cl	145-147
3-0170	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(4-CN)Ph	Cl	91-93
3-0171	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(4-C(=O)Me)Ph	Cl	133-135
3-0172	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	(4-C(=O)OMe)Ph	Cl	121-124
3-0173	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Pirimidin-2-ilo	Cl	148-150
3-0174	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo	Cl	117-118
3-0175	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	SO_2Me	Cl	146-148
3-0176	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	SO_2Ph	Cl	145-148
3-0177	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	C(=O)Me	Cl	130-131
3-0178	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	C(=O)Ph	Cl	114-117
3-0179	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	C(=O)OMe	Cl	104-106
3-0180	Me	Et	H	H	2	H	H	CF_3	Me	Cl	108-110
3-0181	Me	Me	H	H	0	H	H	CHF_2	Me	Cl	1,5183
3-0182	Me	Me	H	H	0	H	H	Ph	Me	Cl	76-77
3-0183	Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	Bu-t	OMe	1,4831
3-0184	Me	Me	H	H	0	H	H	CF_3	$CH_2C(=O)NH_2$	Cl	179-180
3-0185	Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Ph	Cl	58-60

Tabla 14



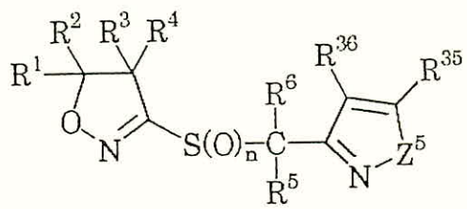
R^2	R^3	R^4	n	R^5	R^6	Z^3	R^{31}	R^{32}	Punto de fusión (°C) o índice de refracción (n_D^{20})
Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	Me	135-136
Me	H	H	2	H	H	S	Me	Cl	113-114
Me	H	H	0	H	H	O	CF_3	Me	
Me	H	H	0	H	H	S	Me	Cl	
Me	H	H	2	H	H	O	Me	Me	178-179
Me	H	H	2	H	H	O	CF_3	OEt	89-91
Me	H	H	2	H	H	O	Ph	Me	81-83
Me	H	H	2	H	H	S	Me	OEt	109-111

Tabla 15



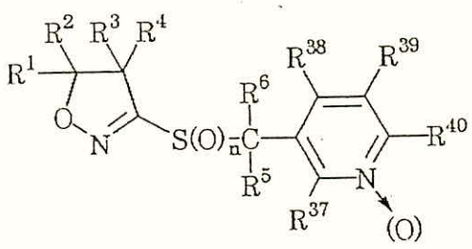
Compuesto Nº	R^1	R^2	R^3	R^4	n	R^5	R^6	Z^4	R^{33}	R^{34}	Punto de fusión (°C) o índice de refracción (n_D^{20})
5-0001	Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Cl	Me	114-115
5-0002	Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Cl	Et	107-108
5-0003	Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	CF_3	H	142-143
5-0004	Me	Me	H	H	2	H	H	NCHF_2	-$(CH_2)_4$-		123-125
5-0005	Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	Oet	Me	1,5397
5-0006	Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	$OCHF_2$	Me	1,5339
5-0007	Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	CF_3	H	99-101
5-0008	Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	$OCH_2CH=CH_2$	Me	87-90
5-0009	Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	$OCH_2CH=CH_2$	Me	1,5702

Tabla 16



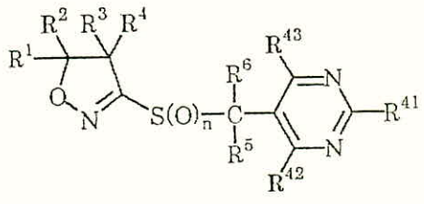
Compuesto Nº	R^1	R^2	R^3	R^4	n	R^5	R^6	Z^5	R^{35}	R^{36}	Punto de fusión (°C) o índice de refracción (n_D^{20})
6-0001	Me	Me	H	H	2	H	H	$NCHF_2$	$-(CH_2)_4-$		Imposible de medir
6-0002	Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	H	Oet	107-108
6-0003	Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	H	$OCHF_2$	1,5383
6-0004	Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	H	100-102
6-0005	Me	Me	H	H	0	H	H	$NCHF_2$	$-(CH_2)_4-$		1,5264

Tabla 17



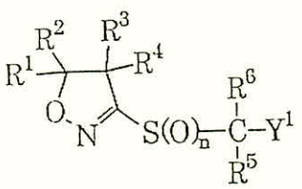
Compuesto Nº	R^1	R^2	R^3	R^4	n	R^5	R^6	R^{37}	R^{38}	R^{39}	R^{40}		Punto de fusión (°C) o índice de refracción (n_D^{20})
7-0001	Me	Me	H	H	2	H	H	H	CF_3	H	H	-	77-80
7-0002	Me	Me	H	H	2	H	H	H	CF_3	H	H	N-óxido	114-116
7-0003	Me	Me	H	H	0	H	H	H	CF_3	H	H	-	
7-0004	Me	Me	H	H	2	H	H	H	H	H	H	-	130-131
7-0005	Me	Me	H	H	2	H	H	H	H	H	H	N-óxido	166-168
7-0006	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Ph	H	H	-	118-120
7-0007	Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Ph	H	H	-	105-106
7-0008	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	H	H	-	115-116
7-0009	Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	H	H	-	134-135
7-0010	Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	H	H	N-óxido	198-199
7-0011	Me	Me	H	H	2	H	H	Ph	Ph	H	H	-	161-162
7-0012	Me	Me	H	H	1	H	H	H	H	H	H	-	97-99
7-0013	Me	Me	H	H	0	H	H	(2-cloropiridin-3-il)metiltio	H	H	H	-	154-155

Tabla 18



R^1	R^2	R^3	R^4	n	R^5	R^6	R^{41}	R^{42}	R^{43}	Punto de fusión (°C) o índice de refracción (n_D^{20})
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	CF_3	175-176
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	CF_3	
Me	Me	H	H	2	H	H	H	Cl	Cl	119-120
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	CF_3	94-95
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	OMe	186-187
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OMe	CF_3	143-144
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OMe	CF_3	144-145
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OMe	CF_3	160-162
Me	Me	H	H	2	H	H	SO_2Me	OMe	CF_3	144-146
Me	Me	H	H	2	H	H	NH_2	OMe	CF_3	208-209
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	H	H	CF_3	112-113
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	H	H	CF_3	1,4986

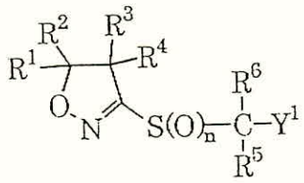
Tabla 19



Compuesto Nº	R^1	R^2	R^3	R^4	n	R^5	R^6	Y^1	Punto de fusión (ºC) o índice de refracción (n_D^{20})
9-0001	Me	Me	H	H	2	H	H	Piridin-2-ilo	116-118
9-0002	Me	Me	H	H	2	H	H	Piridin-2-ilo 1-óxido	140-143
9-0003	Me	Me	H	H	2	H	H	Piridin-4-ilo	133-136
9-0004	Me	Me	H	H	2	H	H	Piridin-4-il 1-óxido	110-113
9-0005	Me	Me	H	H	2	H	H	1,2,4-oxadiazol-3-ilo	Imposible de medir
9-0006	Me	Me	H	H	2	H	H	3-fenil-1,2,4-oxadiazol-5-ilo	153-154
9-0007	Me	Me	H	H	2	H	H	3-bencil-1,2,4-oxadiazol-5-ilo	108-109
9-0008	Me	Me	H	H	2	H	H	2-clorotiazol-4-ilo	110-112

9-0009	Me	Me	H	H	2	H	H	1,4-dimetilimidazol-5-ilo	163-164
9-0010	Me	Me	H	H	1	H	H	Piridin-2-ilo	81-82
9-0011	Me	Me	H	H	1	H	H	Piridin-4-ilo	94-96
9-0012	Me	Me	H	H	1	H	H	1,4-dimetilimidazol-5-ilo	138-140
9-0013	Me	Me	H	H	0	H	H	1,4-dimetilimidazol-5-ilo	1,5427

Tabla 20



Com-puesto Nº	R^1	R^2	R^3	R^4	n	R^5	R^6	Y^1	Punto de fusión (ºC) o índice de refracción (n_D^{20})
10-0001	Me	Me	H	H	2	H	H	Benzimidazol-2-ilo	171-174
10-0002	Me	Me	H	H	2	H	H	Benzotiofen-2-ilo	181-183
10-0003	Me	Me	H	H	2	H	H	3-clorobenzotiofen-2-ilo	109-112
10-0004	Me	Me	H	H	2	H	H	Benzotriazol-1-ilo	206-207
10-0005	Me	Me	H	H	2	H	H	1-metilindazol-4-ilo	128-130
10-0006	Me	Me	H	H	2	H	H	Benzotiazol-2-ilo	142-

									143
10-0007	Me	Me	H	H	2	H	H	Benzotiofen-3-ilo	188-191
10-0008	Me	Me	H	H	2	H	H	5-clorobenzotiofen-3-ilo	129-130
10-0009	Me	Me	H	H	2	H	H	Benzoxazol-2-ilo	127-129
10-0010	Me	Me	H	H	2	H	H	3-metilbenzotiofen-2-ilo	161-163
10-0011	Me	Me	H	H	2	H	H	3-bromobenzotiofen-2-ilo	118-119
10-0012	Me	Me	H	H	2	H	H	Benzofuran-2-ilo	123-124
10-0013	Me	Me	H	H	2	H	H	2-metilbenzofuran-7-ilo	135-137
10-0014	Me	Me	H	H	2	H	H	3-Bromobenzofuran-2-ilo	107-108
10-0015	Me	Me	H	H	2	H	H	Benzotiofen-7-ilo	95-97
10-0016	Me	Me	H	H	2	H	H	1-metilindazol-7-ilo	89-90
10-0017	Me	Me	H	H	2	H	H	3-metilbenzofuran-2-ilo	111-112
10-0018	Me	Me	H	H	2	H	H	3-cloro-1-metilindol-2-ilo	162-165

(Ejemplos de producción de los intermediarios)

<Ejemplo de referencia 1>

Producción de 3-cloro-5,5-dimetil-2-isoxazolina

Se agregaron gradualmente 534,0 g (4,0 moles) de N-clorosuccinimida, de 65 a 70° C, a una solución de 182,7 g (2,05 moles) de aldoxima de ácido glioxílico disueltos en 2 litros de 1,2-dimetoxietano. La mezcla se mantuvo a reflujo durante 1 hora con calentamiento. A esto se agregaron, con enfriamiento con hielo, 1,440,0 g (14,4 moles) de hidrogenocarbonato de potasio y 10 ml de agua. Después, se agregaron 360,0 g (6,4 moles) de 2-metilpropeno. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 24 horas para provocar una reacción. La mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con éter diisopropílico. La capa orgánica resultante se lavó con agua y solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 107,7 g (rendimiento: 40,0 %) de 3-cloro-5,5-dimetil-2-isoxazolina como un líquido viscoso de color amarillo.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

2,93 (2H,s), 1,47 (6H,s)

<Ejemplo de referencia 2>

Producción de 3-cloro-5-etil-5-metil-2-isoxazolina

Se agregaron gradualmente 61,9 g (463,4 mmoles) de N-clorosuccinimida, a 60° C, a una solución de 20,6 g (231,7 mmoles) de aldoxima de ácido glioxílico disueltos en 500 ml de 1,2-dimetoxietano. Después de la adición, la mezcla se mantuvo a reflujo durante 10 minutos con calentamiento. A esto se agregaron, con enfriamiento con hielo, 50 ml (463,4 mmoles) de 2-metil-1-buteno, 98,9 g (1,622 mmoles) de hidrogenocarbonato de potasio y 10 ml de agua. La mezcla resultante se agitó durante 12 horas para provocar una reacción. La mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con n-hexano. La capa orgánica resultante se lavó con agua y solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 13,9 g (rendimiento: 40,6 %) de 3-cloro-5-etil-5-metil-2-isoxazolina como un líquido viscoso de color amarillo.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

2,91 (2H, ABq, J = 17,0, $\triangle \nu$ =46,1 Hz), 1,73 (2H,q), 1,42 (3H,s), 0,96 (3H,t)

<Ejemplo de referencia 3>

Producción de 3-benciltio-5,5-dimetil-2-isoxazolina

Se agregaron 3,2 g (23,2 mmoles) de carbonato de potasio anhidro y 3,0 g (22,5 mmoles) de 3-cloro-5,5-dimetil-2-isoxazolina, en una atmósfera de nitrógeno, a una solución de 2,8 g (22,5 mmoles) de bencilmercaptano disueltos en 50 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó a 100° C durante 2 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 3,1 g (rendimiento: 62,0 %) de 3-benciltio-5,5-dimetil-2-isoxazolina como una sustancia oleosa amarilla (n_D^{20} = 1,5521).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,24-7,39 (5H,m), 4,26 (2H,s), 2,77 (2H,s), 1,40 (6H,s)

<Ejemplo de referencia 4>

Producción de 3-(2,6-difluorobencilsulfinil)-5-etil-5-metil-2-isoxazolina

Se agregaron 4,6 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 18,8 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 4,1 g (15,0 mmoles) de 3-(2,6-difluorobenciltio)-5-etil-5-metil-2-isoxazolina disueltos en 50 ml de cloroformo. La mezcla se agitó durante 1 hora y después a temperatura ambiente durante 12 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción. la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio, agua y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 1,5 g (rendimiento: 34,8 %) de 3-(2,6-

difluorobencilsulfinil)-5-etil-5-metil-2-isoxazolina como un polvo blanco (punto de fusión: 30° C o menos).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,39-7,28 (1H,m), 7,03-6,94 (2H,m), 4,38 (2H,s), 3,04 (1H, ABq, J = 17,2, $\triangle \nu$ =85,7 Hz), 3,12 (1H,s), 1,75 (2H,m), 1,44 (3H,S)+1,41 (3H,s), 0,97 (3H,m)

<Ejemplo de referencia 5>

Producción de 3-(2,6-difluorobencilsulfonil)-5-etil-5-metil-2-isoxazolina

Se agregó 1,0 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 4,1 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 0,8 g (2,8 mmoles) de 3-(2,6-difluorobencilsulfinil)-5-etil-5-metil-2-isoxazolina disueltos en 50 ml de cloroformo. La mezcla se agitó durante 1 hora y después a temperatura ambiente durante 12 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio, agua y una solución acuosa de cloruro de

sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 0,6 g (rendimiento: 75,0 %) de 3-(2,6-difluorobencilsulfonil)-5-etil-5-metil-2-isoxazolina como un polvo blanco (punto de fusión: 64 a 65° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,36-7,46 (1H,m), 6,98-7,04 (2H,m), 4,73 (2H,s), 3,04 (2H, ABq, J = 17,2, $\triangle \nu$ =51,1 Hz), 1,77 (2H,q), 1,46 (3H,s), 0,97 (3H,t)

<Ejemplo de referencia 6>

Producción de 5,5-dimetil-3-metilsulfonil-2-isoxazolina

Se agregó por goteo 1,0 kg de una solución acuosa de metantiolato de sodio (contenido: 15 %, 2,14 mmoles), con enfriamiento con hielo, a una solución de 143,0 g (1,07 moles) de 3-cloro-5,5-dimetil-2-isoxazolina disueltos en 500 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas para provocar una reacción. Luego

de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 115,0 g (rendimiento: 74,1 %) de 5,5-dimetil-3-metiltio-2-isoxazolina. Este residuo (741,2 mmoles) se disolvió en 1 litro de cloroformo. A esto se agregaron, con enfriamiento con hielo, 392,0 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 1,59 moles). La mezcla resultante se agitó durante 1 hora y después a temperatura ambiente durante 12 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, el ácido m-cloroperbenzoico separado se eliminó por filtración. El filtrado resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, agua, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se lavó con éter diisopropílico para obtener 77,6 g (rendimiento: 59,1 %) de 5,5-dimetil-3-metilsulfonil-2-isoxazolina como un polvo blanco (punto de fusión: 82 a 84° C).

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

3,26 (3H,s), 3,12 (2H,s), 1,51 (6H,s)

<Ejemplo de referencia 7>

Producción de 5,5-dimetil-3-etiltio-2-isoxazolina

Se agregaron 1,500 ml de una solución acuosa que contenía 560,0 g (9,0 moles) de etilmercaptano y 360,0 g (9,0 moles) de hidróxido de sodio a una solución que contenía 3-cloro-5,5-dimetil-2-isoxazolina. La mezcla se agitó de 60 a 70° C durante 16 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 270,0 g de 5,5-dimetil-3-etiltio-2-isoxazolina cruda como una sustancia oleosa de color rojo oscuro.

<Ejemplo de referencia 8>

Producción de 5,5-dimetil-3-etilsulfonil-2-isoxazolina

Se disolvieron 270,0 g (1,7 moles) de 5,5-dimetil-3-etiltio-2-isoxazolina oleosa cruda en 1,0 litro de cloroformo. A esto se agregaron, con enfriamiento con hielo, 1,050 g de ácido m-cloroperbenzoico (pureza: 70 %, 6,1 moles). La mezcla resultante se agitó durante 1 hora y después a temperatura ambiente durante 12 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, se eliminó el ácido m-cloroperbenzoico separado por filtración. El filtrado resultante se lavó con una solución acuosa de sulfito de hidrógeno sódico, una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio, agua y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se lavó con n-hexano para obtener 133,6 g (rendimiento: 65,4 %) de 5,5-dimetil-3-etilsulfonil-2-isoxazolina como un polvo blanco.

<Ejemplo de referencia 9>

Producción de 1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-ol

Se agregaron 20 g (184,9 mmoles) de fenilhidrazina y 4 ml de ácido clorhídrico concentrado se agregaron a una solución de 34,1 g (184,9 mmoles) de trifluoroacetoacetato de etilo disueltos en 500 ml de etanol. La

mezcla se mantuvo a reflujo durante 1 hora con calentamiento, para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se sometió a destilación al vacío para eliminar la mayor parte del solvente allí contenido. El residuo se mezcló con agua para precipitar los cristales. Los cristales se recogieron por filtración, se lavaron con agua hasta que el filtrado se volvió neutro, y se secaron para obtener 37,1 g (rendimiento: 87,9 %) de 1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-ol como cristales ocrosos.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,68-7,41 (5H,m), 5,86 (1H,s), 3,71 (1H,s)

<Ejemplo de referencia 10>

Producción de 5-cloro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-carboaldehído

Se agregaron 33,6 g (219,1 mmoles) de oxicloruro de fósforo a 7,7 g (105,2 mmoles) de N,N-dimetilformamida con enfriamiento con hielo. A esto se agregaron, a temperatura ambiente, 20 g (87,7 mmoles) de 1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-ol. La mezcla resultante se mantuvo a reflujo durante 1 hora con calentamiento, para provocar una reacción. Luego de

completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua con enfriamiento con hielo, seguida por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 19,1 g (rendimiento: 79,1 %) de 5-cloro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-carboaldehído como cristales blancos.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

10,06 (1H,s), 7,57 (5H,s)

<Ejemplo de referencia 11>

Producción de (5-cloro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-il)-metanol

Una solución de 0,21 g (5,5 mmoles) de hidruro alumínico de litio disueltos en 70 ml de TF se enfrió a -30° C. A esto se agregó gradualmente una solución de 3 g (10,9 mmoles) de 5-cloro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-

pirazol-4-carboaldehído disueltos en 30 ml de tetrahidrofurano. La mezcla resultante se agitó a -30° C durante 30 minutos para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, se agregó acetato de etilo, seguido por agitación. Luego se agregó agua, seguido por agitación por unos instantes. La mezcla de reacción se filtró al vacío. El filtrado se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 3,0 g (rendimiento: 99,9 %) de (5-cloro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-il)-metanol como cristales blancos.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,54-7,51 (5H,m), 4,71 (2H,d) 1,79 (1H,b)

<Ejemplo de referencia 12>

Producción de 4-bromometil-5-cloro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol

Una solución de 3,0 g (10,9 mmoles) de (5-cloro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-il)-metanol disueltos en 60 ml de éter dietílico

se enfrió a -10° C. A esto se agregó 1,0 g (3,8 mmoles) de tribromuro de fósforo. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 3,6 g (rendimiento: 95,8 %) de 4-bromometil-5-cloro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol como cristales blancos.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,58-7,48 (5H,m), 4,48 (2H,s)

<Ejemplo de referencia 13>

Producción de 5-fluoro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-carboaldehído

Se agregaron 10,5 g (180,2 mmoles) de fluoruro de potasio a una solución de 33,0 g (120,1 mmoles) de 5-cloro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-carboaldehído disueltos en 500 ml de dimetilsulfóxido. La mezcla se agitó a 100° C durante 2 horas para provocar una reacción. Luego de

completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 26,5 g (rendimiento: 85,0 %) de 5-fluoro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-carboaldehído.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

9,96 (1H,s), 7,68-7,51 (5H,m)

<Ejemplo de referencia 14>

Producción de (5-fluoro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-il)-metanol

A una solución de 1,6 g (41,0 mmoles) de borhidruro de sodio disueltos en 300 ml de metanol se agregó, con enfriamiento con hielo, una solución de 26,5 g (102,5 mmoles) de 5-fluoro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-carboaldehído disueltos en 200 ml de metanol. La mezcla resultante se agitó a 0° C durante 30 minutos para provocar una reacción.

Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 28,5 g (rendimiento: 100 %) de (5-fluoro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-il)-metanol.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,65-7,41 (5H,m), 4,68 (2H,d), 1,73 (1H,t)

<Ejemplo de referencia 15>

Producción de 4-bromometil-5-fluoro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol

Una solución de 27,5 g (105,7 mmoles) de (5-fluoro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-il)-metanol disueltos en 300 ml de éter dietílico se enfrió a 0° C. A esto se agregaron 10,0 g (37,0 mmoles) de tribromuro de fósforo. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con éter dietílico. La

capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 30,3 g (rendimiento: 88,8 %) de 4-bromometil-5-fluoro-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,66-7,42 (5H,m), 4,44 (2H,s)

<Ejemplo de referencia 16>

Producción de 1-ter-butil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-ol

Se agregaron 373,8 g (3,0 moles) de clorhidrato de ter-butilhidrazina y 50 ml de ácido clorhídrico concentrado a una solución de 552,3 g (3,0 moles) de trifluoroacetoacetato de etilo disueltos en 1,500 ml de etanol. La mezcla se mantuvo a reflujo durante 2 días con calentamiento, para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se sometió a destilación al vacío para eliminar la mayor parte del solvente allí contenido. El residuo se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y

solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se lavó con n-hexano para obtener 369,0 g (rendimiento: 59,1 %) de 1-ter-butil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-ol como un polvo blanco.

<Ejemplo de referencia 17>

Producción de 1-ter-butil-5-cloro-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-carboaldehído

Se agregaron 462,0 g (3,0 moles) de oxicloruro de fósforo a 87,7 g (1,2 moles) de N,N-dimetilformamida con enfriamiento con hielo. A esto se agregaron, a temperatura ambiente, 208,2 g (1,0 moles) de 1-ter-butil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-ol. La mezcla resultante se mantuvo a reflujo durante 10 horas con calentamiento, para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con agua, una solución acuosa de hidróxido de sodio al 5 % y agua en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente

de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 131,5 g (rendimiento: 21,7 %) de 1-ter-butil-5-cloro-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-carboaldehído como cristales blancos.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

9,97 (1H,d), 1,76 (9H,s)

<Ejemplo de referencia 18>

Producción de (1-ter-butil-5-cloro-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-il)-metanol

Una solución de 39,9 g (156,9 mmoles) de (1-ter-butil-5-cloro-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-carboaldehído disueltos en 300 ml de metanol se enfrió a 0° C. A esto se agregaron gradualmente 6,5 g (172,6 mmoles) de borhidruro de sodio. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el

solvente allí contenido, a fin de obtener 37,7 g (rendimiento: 93,6 %) de (1-ter-butil-5-cloro-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-il)-metanol.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,60 (2H,d), 1,72 (9H,s), 1,58 (1H,t)

<Ejemplo de referencia 19>

Producción de 4-bromometil-1-ter-butil-5-cloro-3-trifluorometil-1H-pirazol

Una solución de 9,2 g (35,7 mmoles) de (1-ter-butil-5-cloro-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-il)-metanol disueltos en 100 ml de éter dietílico se enfrió a -10° C. A esto se agregaron 11,6 g (42,9 mmoles) de tribromuro de fósforo. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con éter dietílico. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 10,0 g (rendimiento: 87,3 %) de 4-bromometil-1-ter-butil-5-cloro-3-trifluorometil-1H-pirazol.

<Ejemplo de referencia 20>

Producción de (1-ter-butil-5-cloro-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-il)-metantiol

Se agregaron 43,5 g (136,1 mmoles) de 4-bromometil-1-ter-butil-5-cloro-3-trifluorometil-1H-pirazol a una solución de 21,8 g de hidrosulfuro de sodio hidratado (pureza: 70 %, 272,2 mmoles) disueltos en 300 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con éter dietílico. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 32,3 g (rendimiento: 87,0 %) de (1-ter-butil-5-cloro-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-il)-metantiol.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

3,65 (2H,d), 1,90 (1H,t), 1,70 (9H,s)

<Ejemplo de referencia 21>

Producción de 1-ter-butil-5-metoxi-3-trifluorometil-1H-pirazol

Se agregaron 15,0 g (108,4 mmoles) de carbonato de potasio anhidro y 19,3 g (135,5 mmoles) de yoduro de metilo, a temperatura ambiente, a una solución de 18,8 g (90,3 mmoles) de 1-ter-butil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-ol disueltos en 100 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó durante 15 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con éter dietílico. La capa orgánica resultante se lavó con agua y solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 20,0 g (rendimiento: 99,8 %) de 1-ter-butil-5-metoxi-3-trifluorometil-1H-pirazol.

<Ejemplo de referencia 22>

Producción de 1-ter-butil-4-clorometil-5-metoxi-3-trifluorometil-1H-pirazol

Se agregaron 5,4 g de paraformaldehído (180,2 mmoles en términos de formaldehído) y 20 ml de ácido clorhídrico concentrado a una solución de 20,0 g (90,1 mmoles) de 1-ter-butil-5-metoxi-3-trifluorometil-1H-pirazol disueltos en 90 ml de ácido acético. La mezcla se agitó a 60° C durante 30 minutos para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con éter diisopropílico. La capa orgánica resultante se lavó con agua y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 21,7 g (rendimiento: 89,0 %) de 1-ter-butil-4-clorometil-5-metoxi-3-trifluorometil-1H-pirazol.

<Ejemplo de referencia 23>

Producción de 3-metoxi-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol

Se agregaron 10,0 g (72,3 mmoles) de carbonato de potasio anhidro y 12,8 g (90,3 mmoles) de yoduro de metilo, a temperatura ambiente, a una solución de 10,0 g (60,2 mmoles) de 3-hidroxi-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol disueltos en 50 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó durante 15 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción

con éter dietílico. La capa orgánica resultante se lavó con agua y solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 9,8 g (rendimiento: 90,7 %) de 3-metoxi-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol.

<Ejemplo de referencia 24>

Producción de 4-clorometil-3-metoxi-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol

Se agregaron 0,45 g de paraformaldehído (15,0 mmoles en términos de formaldehído) y 5 ml de ácido clorhídrico concentrado a una solución de 1,00 g (5,6 mmoles) de 3-metoxi-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol disuelto en 25 ml de ácido acético. La mezcla se agitó a 80° C durante 2 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua y se neutralizó con carbonato de potasio, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 0,83 g (rendimiento: 65,0 %) de 4-

clorometil-3-metoxi-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol.

<Ejemplo de referencia 25>

Producción de 5-fluoro-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-carboaldehído

Se agregaron 42,0 g (711,9 mmoles) de fluoruro de potasio a una solución de 60,4 g (282,7 mmoles) de 5-cloro-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-carboaldehído disueltos en 700 ml de dimetilsulfóxido. La mezcla se agitó de 120 a 140° C durante 5 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 36,8 g (rendimiento: 66,0 %) de 5-fluoro-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-carboaldehído.

<Ejemplo de referencia 26>

Producción de (5-fluoro-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-il)-metanol

A una solución de 3,9 g (102,6 mmoles) de borhidruro de sodio disueltos en 500 ml de metanol se agregó, con enfriamiento con hielo, una solución de 36,8 g (187,6 mmoles) de 5-fluoro-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-carboaldehído disueltos en 200 ml de metanol. La mezcla resultante se agitó a 0° C durante 30 minutos para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 35,4 g (rendimiento: 95,4 %) de (5-fluoro-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-il)-metanol.

<Ejemplo de referencia 27>

Producción de 4-bromometil-5-fluoro-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol

Una solución de 35,4 g (178,7 mmoles) de 5-fluoro-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-metanol disueltos en 500 ml de éter dietílico se

enfrió a -30° C. A esto se agregaron 54,0 g (199,5 mmoles) de tribromuro de fósforo. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con éter dietílico. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 31,4 g (rendimiento: 80,8 %) de 4-bromometil-5-fluoro-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol.

<Ejemplo de referencia 28>

Producción de (etoxicarbonil)malondialdehído

Se lavaron varias veces por decantación 12,6 g de hidruro de sodio (pureza: 60 %, 525,0 mmoles) con éter dietílico y después se convirtieron en una solución en 500 ml de éter dietílico. A esto se agregaron, en una corriente de nitrógeno de 0 a 10° C, 194 g (2,6 moles) de formato de etilo y 50 g (262,0 mmoles) de 3,3-dietoxi-propionato de etilo. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 15 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la

mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por un lavado con éter dietílico. La capa acuosa resultante obtuvo un pH de 1 con ácido clorhídrico, seguido por extracción con diclorometano. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 37,6 g (rendimiento: 100 %) de (etoxicarbonil)malondialdehído crudo como una sustancia oleosa de color rojo oscuro.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

9,09 (2H,s), 5,26 (1H,s), 4,27 (2H,q), 1,28 (3H,t)

<Ejemplo de referencia 29>

Producción de 1H-pirazol-4-carboxilato de etilo

Se agregaron 6,2 g (193 mmoles) de hidrazina, con enfriamiento con hielo, a una solución de 27,6 g (192 mmoles) de (etoxicarbonil)malondialdehído disueltos en 150 ml de etanol. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 17 horas para provocar una reacción. La mezcla de reacción se sometió a destilación al vacío para eliminar el

etanol allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mexito de diclorometano-acetato de etilo) para obtener 19,4 g (72,4 %) de 1H-pirazol-4-carboxilato de etilo como cristales de color amarillo.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

8,08 (2H,s), 5,30 (1H,s), 4,31 (2H,q), 1,36 (3H,t)

<Ejemplo de referencia 30>

Producción de 1-etil-1H-pirazol-4-carboxilato de etilo

Se agregaron 3,7 g (26,8 mmoles) de carbonato de potasio anhidro y 4,2 g (26,6 mmoles) de yoduro de etilo a una solución de 1,5 g (10,7 mmoles) de 1H-pirazol-4-carboxilato de etilo disueltos en 50 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 20 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a

destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 1,6 g (rendimiento: 88,9 %) de 1-etil-1H-pirazol-4-carboxilato de etilo como una sustancia oleosa amarilla.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

7,90 (2H,s), 4,28 (2H,q), 4,18 (2H,q), 1,51 (3H,t), 1,35 (3H,t)

<Ejemplo de referencia 31>

Producción de 3,5-dicloro-1-etil-1H-pirazol-4-carboxilato de etilo

En un tubo sellado de vidrio se colocaron 1,6 g (9,5 mmoles) de 1-etil-1H-pirazol-4-carboxilato de etilo y 5,1 g (38,3 mmoles) de N-clorosuccinimida. Se hizo reaccionar a 160° C durante 6 horas. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, se lavó con tetracloruro de carbono y cloroformo, y se filtró al vacío. El filtrado resultante (capa orgánica) se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para

eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 1,0 g (rendimiento: 44,2 %) de 3,5-dicloro-1-etil-1H-pirazol-4-carboxilato de etilo como una sustancia oleosa amarilla.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,36 (2H,q), 4,21 (2H,q), 1,44 (3H,t), 1,38 (3H,t)

<Ejemplo de referencia 32>

Producción de (3,5-dicloro-1-etil-1H-pirazol-4-il)metanol

Una solución de 0,16 g (4,2 mmoles) de hidruro alumínico de litio disueltos en 70 ml de tetrahidrofurano se enfrió a -50° C. A esto se agregó gradualmente por goteo una solución de 1,0 g (4,2 mmoles) de 3,5-dicloro-1-etil-1H-pirazol-4-carboxilato de etilo disuelto en 30 ml de tetrahidrofurano. La mezcla se agitó a -50° C durante 3 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, se agregó acetato de etilo, seguido por agitación por unos instantes. Se agregó agua, seguido por agitación por unos instantes. La mezcla resultante se

filtró al vacío. El filtrado se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 0,82 g (rendimiento: 100 %) de (3,5-dicloro-1-etil-1H-pirazol-4-il)metanol como una sustancia oleosa de color marrón.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,52 (2H,s), 4,16 (2H,q), 1,43 (3H,t)

<Ejemplo de referencia 33>

Producción de 4-bromometil-3,5-dicloro-1-etil-1H-pirazol

Una solución de 0,82 g (4,2 mmoles) de (3,5-dicloro-1-etil-1H-pirazol-4-il)metanol disueltos en 50 ml de éter dietílico se enfrió a -30° C. A esto se agregaron 1,3 g (4,8 mmoles) de tribromuro de fósforo. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro

de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 0,9 g (rendimiento: 81,8 %) de 4-bromometil-3,5-dicloro-1-etil-1H-pirazol como una sustancia oleosa amarilla.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,33 (2H,s), 4,13 (2H,q), 1,43 (3H,t)

<Ejemplo de referencia 34>

Producción de 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-5-ol

Se agregaron 8,3 g (180,6 mmoles) de metilhidrazina y 5 ml de ácido clorhídrico concentrado a una solución de 30,0 g (180,6 mmoles) de difluoroacetoacetato de etilo disueltos en 200 ml de etanol. La mezcla se mantuvo a reflujo durante 2 días con calentamiento, para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se sometió a destilación al vacío para eliminar la mayor parte del solvente allí contenido. El residuo se vertió en agua. La mezcla obtuvo un pH de 4 utilizando ácido cítrico y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y solución acuosa de cloruro de sodio en este

orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 8,9 g (rendimiento: 33,3 %) de 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-5-ol.

<Ejemplo de referencia 35>

Producción de 5-cloro-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboaldehído

Se agregaron 41,6 g (270,1 mmoles) de oxicloruro de fósforo, con enfriamiento con hielo, a 7,9 g (108,0 mmoles) de N,N-dimetilformamida. A esto se agregaron, a temperatura ambiente, 8,0 g (54,0 mmoles) de 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-5-ol. La mezcla se mantuvo a reflujo durante 4 horas con calentamiento, para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con agua, una solución acuosa de hidróxido de sodio al 5 % y agua en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente

de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 7,7 g (rendimiento: 73,3 %) de 5-cloro-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboaldehído como cristales blancos.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

9,96 (1H,s), 6,90 (1H,t, J = 53,6 Hz), 3,93 (3H,s)

<Ejemplo de referencia 36>

Producción de (5-cloro-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-il)-metanol

Una solución de 7,2 g (37,0 mmoles) de 5-cloro-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboaldehído disueltos en 100 ml de metanol se enfrió a 0° C. A esto se agregaron gradualmente 2,1 g (55,5 mmoles) de borhidruro de sodio. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 3,8 g (rendimiento: 52,1 %) de (5-

cloro-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-il)-metanol.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

6,70 (1H,t, J = 40,8 Hz), 4,63 (2H,s), 3,86 (3H,s), 1,79 (1H,br)

<Ejemplo de referencia 37>

Producción de 4-bromometil-5-cloro-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol

Una solución de 2,0 g (10,0 mmoles) de (5-cloro-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-il)-metanol disueltos en 50 ml de éter dietílico se enfrió a -10° C. A esto se agregó 1,0 g (3,5 mmoles) de tribromuro de fósforo. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua helada, seguido por extracción con éter dietílico. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 2,6 g (rendimiento: 100,0 %) de 4-bromometil-5-cloro-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol.

<Ejemplo de referencia 38>

Producción de oximeterato de trifluoroacetaldehído

Se agregaron 24,1 g (347,0 mmoles) de clorhidrato de hidroxilamina y 160 ml de agua a una solución de 50,0 g (347,0 mmoles) de hemietilacetal de trifluoroacetaldehído disueltos en 80 ml de metanol. A esto se agregaron por goteo, con enfriamiento con hielo, 80,0 g de una solución acuosa de hidróxido de sodio al 50 % (1,7 moles). Después de completar la adición por goteo, la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 6 horas para provocar una reacción. Luego de terminar la reacción, se agregó ácido clorhídrico al 10 % para regular el pH a 6. La mezcla resultante se extrajo con éter dietílico. El extracto se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se sometió a destilación para obtener 24,7 g (rendimiento: 38,0 %) de oximeterato de trifluoroacetaldehído.

<Ejemplo de referencia 39>

Producción de trifluoroacetohidroximoilo bromuro eterato

Una solución de 38,8 g (218,0 mmoles) de N-bromosuccinimida

disueltos en 125 ml de N,N-dimetilformamida se agregó, con enfriamiento con hielo, a una solución de 24,7 g (131,7 mmoles) de trifluoroacetaldehído de oximeterato disueltos en 50 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con éter dietílico. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se sometió a destilación para obtener 33,3 g (rendimiento: 95,0 %) de trifluoroacetohidroximoilo bromuro eterato como una sustancia oleosa de color marrón.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

9,30 (1H,s)

<Ejemplo de referencia 40>

Producción de 4-etoxicarbonil-5-metil-3-trifluorometilisoxazol

Se agregaron 2,8 g (51,3 mmoles) de metóxido de sodio a una

solución de 6,7 g (51,3 mmoles) de acetoacetato de etilo disueltos en 80 ml de metanol. A esto se agregó, con enfriamiento con hielo, una solución de 5,0 g (18,8 mmoles) de trifluorohidroximoilo bromuro eterato disueltos en 20 ml de metanol. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. Se agregó agua al residuo, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 2,9 g (rendimiento: 69,0 %) de 4-etoxicarbonil-5-metil-3-trifluorometilisoxazol como una sustancia oleosa incolora.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,36 (2H,q), 2,77 (3H,s), 1,37 (3H,t)

<Ejemplo de referencia 41>

Producción de (5-metil-3-trifluorometilisoxazol-4-il)-metanol

Una solución de 0,16 g (4,2 mmoles) de hidruro alumínico de litio disueltos en 15 ml de TF se enfrió a 0° C. A esto se agregó gradualmente una solución de 0,93 g (4,2 mmoles) de 4-etoxicarbonil-5-metil-3-trifluorometilisoxazol disueltos en 15 ml de TF. La mezcla se agitó a 0° C durante 1 hora para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, se agregó acetato de etilo, seguido por agitación por unos instantes. Se adicionó agua, seguido por agitación por unos instantes. La mezcla de reacción se filtró al vacío. El filtrado se extrajo con éter dietílico. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 0,5 g (rendimiento: 60,0 %) de (5-metil-3-trifluorometilisoxazol-4-il)-metanol.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,60 (2H,d), 2,54 (3H,s), 1,66 (1H, br)

<Ejemplo de referencia 42>

Producción de 4-bromometil-5-metil-3-trifluorometilisoxazol

Una solución de 0,45 g (2,5 mmoles) de (5-metil-3-trifluorometilisoxazol-4-il)-metanol disueltos en 10 ml de éter dietílico se enfrió a 0° C. A esto se agregaron 0,2 g (8,9 mmoles) de tribromuro de fósforo. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con éter dietílico. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 0,5 g (rendimiento: 74,0 %) de 4-bromometil-5-metil-3-trifluorometilisoxazol.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,31 (2H,d), 2,51 (3H,s)

<Ejemplo de referencia 43>

Producción de (5-cloro-3-metil-isotiazol-4-il)-metanol

Una solución de 2,06 g (10,0 mmoles) de 5-cloro-3-metil-isotiazol-4-carboxilato de etilo disueltos en 10 ml de TF se agregó por goteo, a -30° C, a una solución de 0,42 g (11,0 mmoles) de hidruro alumínico de litio disuelta en 10 ml de TF. La mezcla se agitó a la misma temperatura durante 1 hora para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, se agregó acetato de etilo a la mezcla de reacción. La mezcla resultante se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 1,50 g (rendimiento: 91,5 %) de (5-cloro-3-metil-isotiazol-4-il)-metanol.

<Ejemplo de referencia 44>

Producción de 4-clorometil-5-cloro-3-metilisotiazol

Se agregaron 3,26 g (27,44 mmoles) de cloruro de tionilo, a temperatura ambiente, a una solución de 1,50 g (9,15 mmoles) de (5-cloro-3-metil-isotiazol-4-il)-metanol disuelta en 10 ml de cloroformo. La mezcla se agitó durante 3 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar

que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 1,67 g (rendimiento: cuantitativo) de 4-clorometil-5-cloro-3-metilisotiazol.

<Ejemplo de referencia 45>

Producción de metil 4-trifluorometilnicotinato

Se agregaron 6,7 g (48,6 mmoles) de carbonato de potasio anhidro y 6,9 g (48,6 mmoles) de yoduro de metilo a una solución de 4,6 g (24,1 mmoles) de ácido 4-trifluorometilnicotínico disueltos en 70 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 2,77 g (rendimiento: 56,1 %) de 4-trifluorometilnicotinato de metilo como una sustancia oleosa amarilla.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

9,11 (1H,s), 8,92 (1H,d), 7,64 (1H,d), 3,99 (3H,s)

<Ejemplo de referencia 46>

Producción de (4-trifluorometilpiridin-3-il)-metanol

Una solución de 0,37 g (9,7 mmoles) de hidruro alumínico de litio disueltos en 100 ml de TF se enfrió a -50° C. A esto se agregó gradualmente por goteo una solución de 2,0 g (9,8 mmoles) de 4-trifluorometilnicotinato de metilo disuelta en 30 ml de TF. La mezcla se agitó a -50° C durante 3 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, se agregó acetato de etilo, seguido por agitación por unos instantes. Se agregó agua, seguido por agitación por unos instantes. La mezcla de reacción se filtró al vacío. El filtrado se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de

desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 0,6 g (rendimiento: 35,3 %) de (4-trifluorometilpiridin-3-il)-metanol como una sustancia oleosa amarilla.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

9,00 (1H,s), 8,73 (1H,d), 7,51 (1H,d), 4,95 (2H,s)

<Ejemplo de referencia 47>

Producción de 3-bromometil-4-trifluorometilpiridina

Una solución de 0,6 g (3,4 mmoles) de (4-trifluorometilpiridin-3-il)-metanol disueltos en 50 ml de éter dietílico se enfrió a -30° C. A esto se agregaron 1,4 g (5,2 mmoles) de tribromuro de fósforo. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 0,61 g (rendimiento: 75,3 %) de 3-bromometil-

4-trifluorometilpiridina como una sustancia oleosa amarilla.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

8,88 (1H,s), 8,73 (1H,d), 7,54 (1H,d), 4,63 (2H,s)

<Ejemplo de referencia 48>

Producción de 5-bromo-4-hidroxi-6-trifluorometilpirimidina

Se agregaron 77,5 g (945,0 mmoles) de acetato de sodio anhidro, a temperatura ambiente, a una solución de 49,2 g (300,0 mmoles) de 4-hidroxi-6-trifluorometilpirimidina disueltos en 600 ml de ácido acético. A esto se agregaron gradualmente 50,3 g (315 mmoles) de bromo a 45° C. La mezcla resultante se agitó a la misma temperatura durante 3 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se

lavó con n-hexano para obtener 38,9 g (rendimiento: 53,4 %) de 5-bromo-4-hidroxi-6-trifluorometilpirimidina.

<Ejemplo de referencia 49>

Producción de 5-bromo-4-cloro-6-trifluorometilpirimidina

Se suspendieron 24,3 g (100,0 mmoles) de 5-bromo-4-hidroxi-6-trifluorometilpirimidina en 18,5 g (120,0 mmoles) de oxicloruro de fósforo. La mezcla se agitó a 100° C durante 2 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua en forma gradual, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 21,5 g (rendimiento: 82,4 %) de 5-bromo-4-cloro-6-trifluorometilpirimidina.

<Ejemplo de referencia 50>

Producción de 5-bromo-4-metoxi-6-trifluorometilpirimidina

Se agregaron 16,7 ml de metóxido de sodio (una solución de metano al 28 %, 86,4 mmoles), a temperatura ambiente, a una solución de 21,5 g (82,2 mmoles) de 5-bromo-4-cloro-6-trifluorometilpirimidina disueltos en 100 ml de metanol. La mezcla se agitó para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se lavó con n-hexano para obtener 19,2 g (rendimiento: 91,0 %) de 5-bromo-4-metoxi-6-trifluorometilpirimidina.

<Ejemplo de referencia 51)

Producción de 5-bromo-4-etoxi-6-trifluorometilpirimidina

Se agregaron 0,94 g (13,77 mmoles) de etóxido de sodio, a temperatura ambiente, a una solución de 3,00 g (11,48 mmoles) de 5-bromo-4-cloro-6-trifluorometilpirimidina disueltos en 50 ml de etanol. La

mezcla se agitó para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se vertió en agua, seguido por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 2,44 g (rendimiento: 82,9 %) de 5-bromo-4-etoxi-6-trifluorometilpirimidina.

<Ejemplo de referencia 52>

Producción de 4-metoxi-6-trifluorometilpirimidina-5-carboaldehído

Se agregaron gradualmente 30,0 ml de n-butillitio (a 1,6 moles/litro de solución de n-hexano, 48,0 mmoles), de -65 a -60° C, a una solución de 10,3 g (40,0 mmoles) de 5-bromo-4-metoxi-6-trifluorometilpirimidina disueltos en 100 ml de tetrahidrofurano. La mezcla se agitó durante 30 minutos. A esto se agregaron 3,6 g (48,0 mmoles) de formato de etilo a la misma temperatura. La mezcla resultante se agitó a la misma temperatura durante 3 horas para provocar una reacción. La mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa

orgánica resultante se lavó con agua y solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 1,3 g (rendimiento: 15,8 %) de 4-metoxi-6-trifluorometilpirimidina-5-carboaldehído.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

10,41 (1H,q), 8,91 (1H,s), 4,18 (3H,s)

<Ejemplo de referencia 53>

Producción de 4-etoxi-6-trifluorometilpirimidina-5-carboaldehído

Una solución de 5,76 g (21,3 mmoles) de 5-bromo-4-etoxi-6-trifluorometilpirimidina disueltos en 250 ml de TF se enfrió a -78° C. A esto se agregaron por goteo 22,6 ml de n-butillitio (a 1,6 moles/litro de una solución n-hexano, 36,1 mmoles). La mezcla se agitó durante 40 minutos. A esto se agregaron 2,7 g (45,1 mmoles) de formato de metilo. La mezcla resultante se agitó durante 1,5 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, se agregó una solución acuosa de cloruro de amonio.

La mezcla se extrajo con éter dietílico. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de desarrollo: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 3,82 g (rendimiento: 81,6 %) de 4-etoxi-6-trifluorometilpirimidina-5-carboaldehído.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

10,41 (1H,s), 8,95 (1H,s), 4,63 (2H,q), 1,48 (3H,t)

<Ejemplo de referencia 54>

Producción de (4-metoxi-6-trifluorometilpirimidin-5-il)-metanol

Se agregaron gradualmente 0,24 g (6,3 mmoles) de borhidruro de sodio, a temperatura ambiente, a una solución de 1,3 g (6,3 mmoles) de 4-metoxi-6-trifluorometilpirimidina-5-carboaldehído disuelta en 30 ml de metanol. La mezcla se agitó durante 3 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa

orgánica resultante se lavó con agua y solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,42 g (rendimiento: 32,1 %) de (4-metoxi-6-trifluorometilpirimidin-5-il)-metanol.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

8,93 (1H,s), 4,81 (2H,s), 4,13 (3H,s), 2,26 (1H,br)

<Ejemplo de referencia 55>

Producción de (4-etoxi-6-trifluorometilpirimidin-5-il)-metanol

Se agregó una solución de 3,82 g (17,2 mmoles) de 4-etoxi-6-trifluorometilpirimidina-5-carboaldehído disuelta en 50 ml de metanol, con enfriamiento con hielo, a una solución de 1,7 g (45,7 mmoles) de borhidruro de sodio disueltos en 50 ml de metanol. La mezcla se agitó a 0° C durante 1 hora para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con una solución

acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 3,77 g (rendimiento: 97,8 %) de (4-etoxi-6-trifluorometilpirimidin-5-il)-metanol.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

8,80 (1H,s), 4,81 (2H,s), 4,59 (2H,q), 2,28 (1H,b), 1,48 (3H,t)

<Ejemplo de referencia 56>

Producción de 5-clorometil-4-metoxi-6-trifluorometilpirimidina

Se agregaron 1,19 g (10,1 mmoles) de cloruro de tionilo, a temperatura ambiente, a una solución de 0,42 g (2,02 mmoles) de (4-metoxi-6-trifluorometilpirimidin-5-il)-metanol. La mezcla se agitó durante 3 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 0,45 g (rendimiento: cuantitativo) de 5-clorometil-4-metoxi-6-trifluorometilpirimidina.

<Ejemplo de referencia 57>

Producción de 5-bromometil-4-etoxi-6-trifluorometilpirimidina

Una solución de 3,77 g (17,0 mmoles) de (4-etoxi-6-trifluorometilpirimidin-5-il)-metanol disuelta en 50 ml de éter dietílico se enfrió a 0° C. A esto se agregaron 2,0 g (7,2 mmoles) de tribromuro de fósforo. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. La sal resultante se disolvió usando metanol. La mezcla resultante se agitó durante 1 hora para provocar una reacción. La mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con éter dietílico. La capa orgánica resultante se lavó con una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 5-bromometil-4-etoxi-6-trifluorometilpirimidina cruda.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

8,79 (1H,s), 4,61 (2H,q), 4,55 (2H,s), 1,49 (3H,t)

<Ejemplo de referencia 58>

Producción de (2-cloro-4-metilpiridin-3-il)metanol

Una solución de 1,9 g (10,0 mmoles) de 2-cloro-4-metilnicotinato de metilo disueltos en 5,0 ml de TF se agregó gradualmente, de -65 a -60° C, a una suspensión de 0,4 g (10,0 mmoles) de hidruro alumínico de litio en 30 ml de tetrahidrofurano. La mezcla se agitó durante 30 minutos y a -20° C durante 1 hora para provocar una reacción. La mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,6 g (rendimiento: 38,2 %) de (2-cloro-4-metilpiridin-3-il)metanol.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

8,19 (1H,d), 7,08 (1h,d), 4,85 (2H,s), 2,49 (3H,s)

<Ejemplo de referencia 59>

Producción de 3-acetil-4-clorometil-2,5-diclorotiofeno

Se agregaron por goteo 33 ml de tetracloruro de titanio (a 2 moles/litro de una solución de diclorometano, 66,0 mmoles), a 10° C con enfriamiento con hielo, a una solución de 5,0 g (32,4 mmoles) de 3-acetil-2,5-diclorotiofeno disueltos en 26 ml (323,0 mmoles) de clorometilmetiléter. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas para provocar una reacción. Luego de completar la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua helada, seguida por extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con bicarbonato de sodio, agua y una solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de producción: hexano/acetato de etilo = 9/1) para obtener 2,6 g (rendimiento: 39,7 %) de 3-acetil-4-clorometil-2,5-diclorotiofeno como cristales de color amarillo.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

4,70 (2H,s), 2,56 (3H,s), 2,54 (3H,s), 2,39 (3H,s)

<Ejemplo de referencia 60>

Producción de 3-bromo-2-bromometilbenzofurano

Se agregaron 2,7 g (15,3 mmoles) de N-bromosuccinimida y 0,4 g (2,7 mmoles) de azobisisobutironitrilo a una solución de 2,8 g (13,3 mmoles) de 3-bromo-2-metilbenzofurano disueltos en 30 ml de monoclorobenceno. La mezcla se agitó a 80° C durante 30 minutos para provocar una reacción. Tras confirmar la desaparición de los materiales crudos, la mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente. Las sustancias insolubles se eliminaron por filtración. El filtrado se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y solución acuosa de cloruro de sodio en este orden y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido, a fin de obtener 3,0 g (rendimiento: 79,0 %) de 3-bromo-2-bromometilbenzofurano.

<Ejemplo de referencia 61>

Producción de 1-difluorometil-1H-pirazol-4-carboxilato de etilo

Se agregaron 6,0 g (43,5 mmoles) de carbonato de potasio anhidro a una solución de 3,0 g (21,4 mmoles) de 1H-pirazol-4-carboxilato de etilo disueltos en 100 ml de N,N-dimetilformamida. Allí se insufló clorodifluorometano. La mezcla resultante se agitó de 130 a 140° C durante 3 horas para provocar una reacción. Luego de confirmar que la reacción había terminado, la mezcla de reacción se vertió en agua, seguido por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con agua y una solución acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La solución resultante se sometió a destilación al vacío para eliminar el solvente allí contenido. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (solvente de producción: solvente mixto de hexano-acetato de etilo) para obtener 1,67 g (rendimiento: 41,0 %) de 1-difluorometil-1H-pirazol-4-carboxilato de etilo como una sustancia oleosa transparente incolora.

^{1}H-NMR [$CDCl_3$/TMS, δ (ppm)]:

8,32 (1H,s), 8,04 (1H,s), 7,20 (1H,t), 4,32 (2H,q), 1,37 (3H,t)

El herbicida de la presente invención contiene, como ingrediente activo, un derivado de isoxazolina representado por la fórmula general [I] o una sal del mismo.

Al utilizar el compuesto de la presente invención como herbicida, el presente compuesto puede usarse por sí mismo. También puede emplearse en forma de polvo, un polvo humectable, un concentrado emulsionable, una pasta líquida, gránulos finos, gránulos, etc. mezclándolos con un portador, un surfactante, un dispersante, un adyuvante, etc., todos usados generalmente en una formulación.

Como portadores usados en la formulación pueden mencionarse, por ejemplo, portadores sólidos como talco, bentonita, greda, caolín, tierra de diatomeas, carbón blanco, vermiculita, carbonato de calcio, cal muerta, arena silícea, sulfato de amonio, urea y similares; y portadores líquidos como alcohol isopropílico, xileno, ciclohexano, metilnaftaleno y similares.

Como surfactantes y dispersantes pueden mencionarse, por ejemplo, sales metálicas de ácidos alquilbencensulfónicos, sales metálicas de ácido dinaftilmetandisulfónico, sales de sulfatos de alcohol, sales de ácido alquilarilsulfónico, sales de ácido ligninsulfónico, éter de polioxietilenglicol, éteres de polioxietilenalquilarilo, monoalquilatos de polioxietilensorbitano y similares. Como adyuvantes pueden mencionarse, por ejemplo, carboximetilcelulosa, polietilenglicol y goma arábiga. Al usar el presente herbicida, se diluye hasta una concentración apropiada y se

pulveriza o se aplica en forma directa.

El herbicida de la presente invención puede usarse por pulverización en el follaje, aplicación en la tierra, aplicación en la superficie del agua, etc. La cantidad de ingrediente activo usado se determina apropiadamente para lograr la finalidad de aplicación. El contenido de ingrediente activo se determina apropiadamente de acuerdo con la finalidad. Cuando el presente compuesto se formula como un polvo o como gránulos, el contenido oscila en un rango del 0,01 % al 10 % en peso, preferentemente del 0,05 % al 5 % en peso. Cuando el presente compuesto se convierte en un concentrado emulsionable o un polvo humectable, la cantidad se determina apropiadamente en un rango del 1 al 50 % en peso, del 5 al 30 % en peso. Cuando el presente compuesto se convierte en una pasta líquida, la cantidad se determina apropiadamente en un rango que oscila entre el 1 y el 40 % en peso, preferentemente el 5 y el 30 % en peso.

La cantidad del presente herbicida usado varía según el tipo de compuesto utilizado, la maleza objeto, la tendencia de la emergencia de las malezas, las condiciones ambientales, el tipo de herbicida usado, etc. Cuando el presente herbicida se usa per se como en el caso de un polvo o de gránulos, la cantidad se selecciona apropiadamente en un rango que

oscila entre 1 g a 50 kg, preferentemente de 10 g a 10 kg por hectárea en términos de ingrediente activo. Cuando el presente herbicida se usa en una forma líquida como en el caso de un concentrado emulsionable, un polvo humectable o una pasta líquida, la cantidad se selecciona apropiadamente en un rango que oscila entre 0,1 y 50.000 ppm, preferentemente entre 10 y 10.000 ppm.

El compuesto de la presente invención puede mezclarse, de ser necesario, con un insecticida, un fungicida, otro herbicida, un agente de regulación del crecimiento de plantas, un fertilizante, etc.

A continuación, la formulación del presente compuesto se describe en forma específica, mostrando ejemplos típicos de formulación. Los tipos de compuestos y aditivos y sus relaciones de composición no están limitados a los que se indican más abajo y pueden variar ampliamente. En la siguiente descripción, las "partes" se refieren a las partes en peso.

<Formulación 1> Polvo humectable

Se mezclaron 10 partes de un compuesto (3-0006) con 0,5 parte de polioxietilenoctilfeniléter, 0,5 parte de una sal sódica de un condensado de ácido β-naftalensulfónico-formalina, 20 partes de tierra de diatomeas y 69

partes de arcilla. La mezcla se mezcló y se pulverizó para obtener un polvo humectable.

<Formulación 2> Pasta líquida

Se dispersaron 20 partes de un compuesto molido grueso (3-0006) en 69 partes de agua. A esto se agregaron 4 partes de un sulfato de polioxietilenestirilfeniléter, 7 partes de etilenglicol y 200 ppm, respecto del herbicida producido, de Silicone AF-118N (un producto de Asahi Chemical Industry, Co. Ltd.). La mezcla resultante se agitó durante 30 minutos utilizando un agitador de alta velocidad y después se trituró utilizando un triturador húmedo para obtener una pasta líquida.

<Formulación 3> Emulsión

A 30 partes de un compuesto (3-0006) se agregaron 60 partes de un volumen igual de mezcla de xileno e isoforona y 10 partes de una mezcla de surfactante de un polioxietilensorbitanalquilato, un polímero de polioxietilenalquilarilo y un alquilarilsulfonato. La mezcla resultante se agitó en forma suficiente para obtener un concentrado emulsionable.

<Formulación 4> Gránulos

Se mezclaron 10 partes de un compuesto (3-0006), 80 partes de un diluyente que era una mezcla 1 : 3 de talco y bentonita, 5 partes de carbón blanco y 5 partes de una mezcla de surfactantes de un polioxietilensorbitanalquilato, un polímero de polioxietilenalquilarilo y un alquilarilsulfonato. A la mezcla se agregaron 10 partes de agua. La mezcla resultante se amasó en forma suficiente para formar una pasta. La pasta se extrusionó a través de la trama (diámetro: 0,7 mm) de un tamiz. El extrudado se secó y se cortó en una longitud de 0,5 a 1 mm para obtener gránulos.

A continuación, se describen los ejemplos de aplicación del presente compuesto para mostrar el efecto del presente compuesto.

<Ejemplo de aplicación 1> Ensayo para el efecto herbicida por tratamiento de un arrozal

Una tierra sembrada de arroz se colocó en una maceta de plástico 100 cm^2 y se sometió a pudelaje. Luego se sembraron semillas de Echinochloa oryzicola Vasing y Monochoria vaginalis (Murm. f.) Presl var. plantaginea (Roxb.) Solms-Laub y se vertió agua hasta una profundidad de 3 cm. Al día siguiente, se diluyeron en agua unos polvos humectables

obtenidos de acuerdo con la formulación 1 y se vertieron por goteo en la superficie del agua. La cantidad de aplicación de cada polvo humectable era de 1.000 g por hectárea en términos de ingrediente activo. Luego se dejó crecer en un vivero, se examinó el efecto herbicida de cada polvo humectable el día 21 a partir del tratamiento, de acuerdo con el estándar indicado en la tabla 21. Los resultados se indican en la tabla 22.

Tabla 21

Índice	Efecto herbicida (extensión de la inhibición del crecimiento) o fitotoxicidad
5	Un efecto herbicida o fitotoxicidad del 90 %
4	Un efecto herbicida o fitotoxicidad del 70 % a menos del 90 %
3	Un efecto herbicida o fitotoxicidad del 50 % a menos del 70 %
2	Un efecto herbicida o fitotoxicidad del 30 % a menos del 50 %
1	Un efecto herbicida o fitotoxicidad del 10 % a menos del 30 %
0	Un efecto herbicida o fitotoxicidad del 0 % a menos del 10 %

Tabla 22

Compuesto N°	Ingrediente activo (g/ha)	Echinochloa oryzicola Vasing	Monochoria vaginalis (Burm.F.) Presl var. plantaginea (Roxb.) Solms-Laub.
1-0001	1000	5	5
1-0002	1000	5	5
1-0003	1000	5	5
1-0004	1000	5	5
1-0005	1000	5	5
2-0001	1000	5	5
2-0003	1000	5	5
2-0004	1000	5	5
2-0005	1000	5	5
2-0006	1000	5	5
2-0008	1000	5	5
2-0011	1000	5	5
2-0012	1000	5	5
3-0002	1000	5	5
3-0004	1000	5	5
3-0009	1000	5	5
3-0013	1000	5	5
3-0014	1000	5	5
3-0015	1000	5	5
3-0016	1000	5	5

3-0034	1000	5	5
3-0035	1000	5	5
3-0037	1000	5	5
3-0038	1000	5	5
3-0039	1000	5	5
3-0040	1000	5	5
3-0041	1000	5	5
3-0044	1000	5	5
3-0047	1000	5	5
3-0049	1000	5	5
3-0051	1000	5	5
3-0054	1000	5	5
3-0059	1000	5	5
3-0060	1000	5	5
3-0061	1000	5	5
3-0070	1000	5	5
3-0072	1000	5	5
3-0073	1000	5	5
3-0074	1000	5	5
3-0081	1000	5	5
3-0082	1000	5	5
3-0083	1000	5	5
3-0084	1000	5	5
3-0085	1000	5	5
3-0086	1000	5	5

3-0087	1000	5	5
3-0088	1000	5	5
3-0089	1000	5	5
3-0090	1000	5	5
3-0091	1000	5	5
3-0100	1000	5	5
3-0101	1000	5	5
3-0102	1000	5	5
3-0103	1000	5	5
3-0114	1000	5	5
3-0115	1000	5	5
3-0117	1000	5	5
3-0118	1000	5	5
3-0119	1000	5	5
3-0120	1000	5	5
3-0121	1000	5	5
3-0124	1000	5	5
3-0125	1000	5	5
3-0126	1000	5	5
3-0127	1000	5	5
3-0128	1000	5	5
3-0129	1000	5	5
3-0130	1000	5	5
3-0131	1000	5	5
3-0134	1000	5	5

3-0135	1000	5	5
3-0137	1000	5	5
3-0139	1000	5	5
3-0144	1000	5	5
3-0153	1000	5	5
3-0156	1000	5	5
3-0160	1000	5	5
3-0173	1000	5	5
3-0174	1000	5	5
3-0176	1000	5	5
3-0177	1000	5	5
3-0178	1000	5	5
3-0180	1000	5	5
4-0001	1000	5	5
4-0002	1000	5	5
4-0005	1000	5	5
4-0007	1000	5	5
4-0008	1000	5	5
5-0001	1000	5	5
5-0002	1000	5	5
5-0003	1000	5	5
5-0005	1000	5	5
5-0006	1000	5	5
5-0007	1000	5	5
6-0003	1000	5	5

6-0004	1000	5	5
7-0004	1000	5	5
7-0006	1000	5	5
7-0008	1000	5	5
7-0009	1000	5	5
8-0001	1000	5	5
8-0012	1000	5	5
9-0001	1000	5	5
9-0003	1000	5	5
9-0005	1000	5	5
9-0006	1000	5	5
9-0008	1000	5	5
10-0002	1000	5	4
10-0003	1000	5	5
10-0004	1000	5	5
10-0005	1000	5	5
10-0006	1000	5	5
10-0008	1000	5	5
10-0009	1000	5	5
10-0011	1000	5	5
10-0012	1000	5	5
10-0013	1000	5	5
10-0014	1000	5	5
10-0015	1000	5	5
10-0016	1000	5	5

10-0017	1000	5	5
10-0018	1000	5	5

<Ejemplo de aplicación 2> Ensayo del efecto herbicida por tratamiento del suelo en tierras altas

Se colocó un suelo de tierras altas en una maceta de plástico de 80 cm^2. Se sembraron semillas de Echinochloa crus-galli (L.) Beauv. var. crus-galli y Setaria viridis (L.) Beauv., luego se cubrieron con ese mismo suelo. Se diluyeron con agua polvos humectables obtenidos de acuerdo con la formulación 1 y se pulverizaron uniformemente en la superficie del suelo, utilizando un pequeño aerosol, en una cantidad de 1.000 litros por hectárea, de modo que la cantidad de cada ingrediente activo fue de 1.000 g por hectárea. Luego se dejó crecer en un vivero, y se examinó el efecto herbicida de cada polvo humectable el día 21 a partir del tratamiento de acuerdo con el estándar indicado en la tabla 21. Los resultados se indican en la tabla 23.

Tabla 23

Compuesto N°	Ingrediente activo (g/ha)	Echinochloa curs-galli (L.) Beauv. Var. crus-galli	Setaria viridis (L.) Beauv.
1-0001	1000	5	5
1-0002	1000	5	5
1-0003	1000	5	5
1-0004	1000	5	5
1-0005	1000	5	5
1-0006	1000	5	4
2-0001	1000	5	5
2-0003	1000	5	5
2-0004	1000	5	5
2-0005	1000	5	5
2-0006	1000	5	4
2-0007	1000	4	4
2-0008	1000	5	5
2-0011	1000	5	4
2-0012	1000	5	5
3-0002	1000	5	5
3-0004	1000	5	5
3-0006	1000	4	4
3-0008	1000	5	5
3-0009	1000	5	5
3-0012	1000	5	5

3-0013	1000	5	5
3-0015	1000	5	5
3-0016	1000	5	5
3-0017	1000	5	5
3-0018	1000	5	5
3-0019	1000	5	5
3-0020	1000	5	5
3-0034	1000	5	5
3-0035	1000	5	5
3-0036	1000	5	5
3-0037	1000	5	5
3-0038	1000	5	5
3-0039	1000	5	5
3-0040	1000	5	5
3-0041	1000	5	5
3-0043	1000	5	5
3-0044	1000	5	5
3-0047	1000	5	5
3-0048	1000	5	5
3-0049	1000	5	5
3-0050	1000	5	5
3-0053	1000	5	5
3-0054	1000	5	5
3-0054	1000	5	5
3-0056	1000	5	5

256
~~256~~

3-0059	1000	5	5
3-0060	1000	5	5
3-0063	1000	5	5
3-0070	1000	4	4
3-0072	1000	5	5
3-0073	1000	5	5
3-0074	1000	5	5
3-0081	1000	5	5
3-0082	1000	5	5
3-0083	1000	5	5
3-0084	1000	5	5
3-0085	1000	5	5
3-0086	1000	5	5
3-0087	1000	5	5
3-0088	1000	5	4
3-0091	1000	5	5
3-0114	1000	5	5
3-0115	1000	5	5
3-0117	1000	5	5
3-0118	1000	5	5
3-0119	1000	5	5
3-0120	1000	5	5
3-0121	1000	5	5
3-0124	1000	5	5
3-0125	1000	5	5

3-0126	1000	5	5
3-0127	1000	5	5
3-0128	1000	5	5
3-0129	1000	5	5
3-0130	1000	5	5
3-0131	1000	5	5
3-0134	1000	5	5
3-0135	1000	5	5
3-0136	1000	5	5
3-0137	1000	5	5
3-0138	1000	4	5
3-0139	1000	5	5
3-0142	1000	5	5
3-0143	1000	5	5
3-0144	1000	5	5
3-0153	1000	5	5
3-0156	1000	5	5
3-0173	1000	5	5
3-0174	1000	5	5
3-0180	1000	5	5
4-0001	1000	5	5
4-0001	1000	4	3
4-0002	1000	5	5
4-0005	1000	5	5
4-0006	1000	5	5

4-0007	1000	5	5
4-0008	1000	5	5
5-0001	1000	5	5
5-0002	1000	5	5
5-0003	1000	5	5
5-0005	1000	5	4
5-0006	1000	5	5
5-0007	1000	5	5
6-0001	1000	5	5
6-0003	1000	5	5
6-0004	1000	5	5
7-0002	1000	5	5
7-0004	1000	5	4
7-0006	1000	5	5
7-0007	1000	5	4
7-0008	1000	5	5
7-0009	1000	5	5
8-0001	1000	5	5
8-0004	1000	5	5
8-0005	1000	5	4
8-0007	1000	5	5
9-0001	1000	5	5
9-0005	1000	5	4
9-0006	1000	5	4
9-0007	1000	4	4

9-0008	1000	5	5
10-0003	1000	5	5
10-0004	1000	5	5
10-0005	1000	5	5
10-0006	1000	5	4
10-0009	1000	5	5
10-0012	1000	5	4
10-0013	1000	5	5
10-0014	1000	5	5
10-0015	1000	5	5
10-0016	1000	5	4
10-0017	1000	5	5
10-0018	1000	5	5

<Ejemplo de aplicación 3> Ensayo del efecto herbicida por tratamiento del follaje de tierras altas

Se colocó arena en una maceta de plástico de 80 cm^2. Se sembraron semillas de Echinochloa crus-galli (L.) Beauv. var. crus-galli y Setaria viridis (L.) Beauv. El crecimiento se produjo en un vivero durante 2 semanas. Se diluyeron los polvos humectables obtenidos de acuerdo con la formulación 1 y se pulverizaron sobre todo el follaje de las plantas desde arriba, utilizando un pequeño aerosol en una cantidad de 1.000 litros por hectárea, de modo que la cantidad de cada ingrediente activo fue de 1.000 g

por hectárea. Luego se dejó crecer en el vivero, y se examinó el efecto herbicida de cada polvo humectable el día 14 a partir del tratamiento de acuerdo con el estándar indicado en la tabla 21. Los resultados se indican en la tabla 24.

Tabla 24

Compuesto N°	Ingrediente activo (g/ha)	Echinochloa curs-galli (L.) Beauv. Var. crus-galli	Setaria viridis (L.) Beauv.
1-0001	1000	5	4
1-0004	1000	5	4
2-0001	1000	5	4
2-0003	1000	5	4
2-0004	1000	5	4
2-0008	1000	5	5
2-0011	1000	5	4
3-0008	1000	4	4
3-0010	1000	5	4
3-0011	1000	5	4
3-0013	1000	5	5
3-0015	1000	5	4
3-0035	1000	4	4
3-0036	1000	4	4
3-0037	1000	5	4
3-0038	1000	5	5
3-0039	1000	5	5
3-0044	1000	5	4
3-0049	1000	4	4
3-0073	1000	5	4

3-0074	1000	5	4
3-0076	1000	5	4
3-0077	1000	5	4
3-0081	1000	4	4
3-0082	1000	4	4
3-0083	1000	4	4
3-0084	1000	4	4
3-0085	1000	4	4
3-0086	1000	4	4
3-0092	1000	4	4
3-0104	1000	5	4
3-0105	1000	5	4
3-0106	1000	5	4
3-0107	1000	5	5
3-0115	1000	5	4
3-0118	1000	5	4
3-0119	1000	5	4
3-0120	1000	5	5
3-0144	1000	5	5
4-0002	1000	5	4
4-0005	1000	5	4
5-0001	1000	5	4
5-0002	1000	5	5
5-0003	1000	5	4
5-0007	1000	5	5

6-0004	1000	5	4
7-0008	1000	5	5
7-0009	1000	4	4
8-0001	1000	5	4
9-0001	1000	4	4
9-0005	1000	4	4
9-0008	1000	4	4

Aplicabilidad industrial

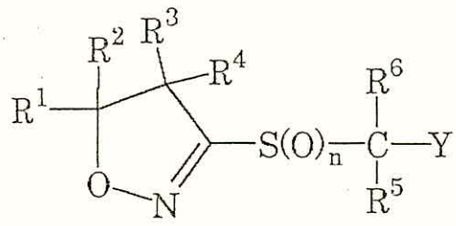
El compuesto representado por la fórmula general [I] de acuerdo con la presente invención presenta un excelente efecto herbicida durante un largo período desde antes de la germinación hasta el crecimiento, en varias malezas, causando problemas en tierras altas, por ejemplo, en malezas de hojas anchas [por ejemplo Polygonum lapathifolium L. subsp. nodosum (Pers.) Kitam., Amaranthus viridis L., Chenopodium album L., Stellaria media (L.) Villars, Abutilon theophrasti Medik., Sida spinosa, Sesbaria exaltata, ipomoea spp. y Xanthium strumarium L.], malezas ciperáceas perennes o anuales [por ejemplo Cyperus rotundus L., Cyperus esculentus, Kyllinga brevifolia Rottb. subsp. leiolepis (Fraxch. et Savat.) T. Koyama, Cyperus microiria Steud., y Cyperus iria L.], y malezas de gramíneas [por ejemplo Echinochloa crus-galli (L.) Beauv. var. crus-galli, Digitaria ciliaris (Retz.) Koeler, Setaria viridis (L.) Beauv., Poa annua L., Sorghum

halepense (L.) Pers., Alopecurus aequalis Sobol. var. amurensis (Komar.) Ohwi, y Avena fatua L.]. Además, el presente compuesto muestra un efecto herbicida en las malezas que emergen en arrozales, es decir, malezas anuales [por ejemplo Echinochloa oryzicola Vasing., Cyperus difformis L., Monochoria vaginalis (Burm. f.) Presl. var. plantaginea (Roxb.) Solms-Laub., y Lindernia procumbens] y malezas perennes [por ejemplo Sagittaria trifolia L., Sagittaria pygmaea Miq., Cyperus serotinus Rottb., Eleocharis kuroguwai Ohwi, y Scirpus juncoides Roxb. subsp. hotarui (Ohwi) T. Koyama, Alisma canaliculatum].

El herbicida de la presente invención presenta gran seguridad para cereales, en particular, arroz, trigo, cebada, maíz, sorgo, poroto de soja, algodón, remolacha, etc.

Reivindicaciones

1. Un derivado de isoxazolina representado por la siguiente fórmula general [I] o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo:



[I]

donde R^1 y R^2 pueden ser iguales o diferentes y cada uno es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1 a C10, un grupo cicloalquilo C3 a C8 o un grupo cicloalquil C3 a C8 alquilo C1 a C3 ; o R^1 y R^2 pueden estar unidos entre sí para formar un anillo espiro C3 a C7 junto con los átomos de carbono a los que están unidos;

R^3 y R^4 pueden ser iguales o diferentes y cada uno es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1 a C10 o un grupo cicloalquilo C3 a C8; o R^3 y R^4 pueden estar unidos entre sí para formar un anillo espiro C3 a C7 junto con los átomos de carbono a los que están unidos; o R^1, R^2, R^3 y R^4 pueden formar un anillo de 5 a 8 miembros junto con los átomos de carbono a los que están unidos;

R^5 y R^6 pueden ser iguales o diferentes y cada uno es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1 a C10;

Y es un grupo heterocíclico aromático de 5 a 6 miembros o un grupo heterocíclico aromático condensado que tiene uno o más heteroátomos seleccionados de un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre; el grupo heterocíclico puede estar sustituido con 0 a 6 grupos iguales o diferentes seleccionados del siguiente grupo sustituyente α; cuando el grupo heterocíclico está sustituido en las dos posiciones adyacentes con dos grupos alquilo, dos grupos alcoxi, un grupo alquilo y un grupo alcoxi, un grupo alquilo y un grupo alquiltio, un grupo alquilo y un grupo alquilsulfonilo, un grupo alquilo y un grupo monoalquilamino, o un grupo alquilo y un grupo dialquilamino, todos seleccionados del grupo sustituyente α, los dos grupos pueden formar, junto con los átomos a los que están unidos, un anillo de 5 a 8 miembros que puede estar sustituido con 1 a 4 átomos de halógeno; el heteroátomo del grupo heterocíclico, cuando es un átomo de nitrógeno, puede oxidarse para ser un N-óxido;

n es un número entero de 0 a 2.

[Grupo sustituyente α]

Grupo hidroxilo; grupo tiol; átomos de halógeno; grupos alquilo C1 a C10; grupos alquilo C1 a C10 cada uno monosustituido con un grupo seleccionado del siguiente grupo sustituyente β, grupos haloalquilo C1 a C4; grupos cicloalquilo C3 a C8; grupos alcoxi C1 a C10; grupos alcoxi C1 a C10 cada uno monosustituido con un grupo seleccionado del siguiente grupo sustituyente γ; grupos haloalcoxi C1 a C4; grupos cicloalquiloxi C3 a C8; grupos cicloalquil C3 a C8 alquiloxi C1 a C3; grupos alquiltio C1 a C10; grupos alquiltio C1 a C10 cada uno monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente γ; grupos haloalquiltio C1 a C4; grupos alquenilo C2 a C6; grupos alqueniloxi C2 a C6; grupos alquinilo C2 a C6; grupos alquiniloxi C2 a C6; grupos alquilsulfinilo C1 a C10; grupos alquilsulfinilo C1 a C10 cada uno monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente γ; grupos alquilsulfonilo C1 a C10; grupos alquilsulfonilo C1 a C10 cada uno monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente γ; grupos haloalquilsulfinilo C1 a C4; grupos alquilsulfoniloxi C1 a C10 cada uno monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente γ; grupos haloalquilsulfonilo C1 a C4; grupos alquilsulfoniloxi C1 a C10; grupos haloalquilsulfoniloxi C1 a C4; grupo fenilo opcionalmente sustituido; grupo fenoxi opcionalmente sustituido; grupo feniltio opcionalmente sustituido; grupos heterocíclicos aromáticos opcionalmente sustituidos; grupos oxi heterocíclicos aromáticos

opcionalmente sustituidos; grupos tio heterocíclicos aromáticos opcionalmente sustituidos; grupos fenilsulfinilo opcionalmente sustituidos; grupos fenilsulfonilo opcionalmente sustituidos; grupos sulfonilo heterocíclicos aromáticos opcionalmente sustituidos; grupos fenilsulfoniloxi opcionalmente sustituidos; grupos acilo; grupos haloalquilcarbonilo C1 a C4; grupo bencilcarbonilo opcionalmente sustituido; grupo benzoilo opcionalmente sustituido; grupo carboxilo; grupos alcoxicarbonilo C1 a C10; grupos benciloxicarbonilo opcionalmente sustituidos; grupo fenoxicarbonilo opcionalmente sustituido; grupo ciano; grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos iguales o diferentes seleccionados de grupos alquilo C1 a C10 y grupo fenilo opcionalmente sustituido); grupos aciloxi C1 a C6; grupos haloalquilcarboniloxi C1 a C4; grupo bencilcarboniloxi opcionalmente sustituido; grupo benzoiloxi opcionalmente sustituido; grupo nitro; y grupo amino (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos iguales o diferentes seleccionados de grupos alquilo C1 a C10, grupo fenilo opcionalmente sustituido, grupo acilo C1 a C6, grupos haloalquilcarbonilo C1 a C4, grupo bencilcarbonilo opcionalmente sustituido, grupo benzoilo opcionalmente sustituido, grupo alquilsulfonilo C1 a C10, grupos haloalquilsulfonilo C1 a C4, grupo bencilsulfonilo opcionalmente sustituido, y grupo fenilsulfonilo opcionalmente sustituido).

[Grupo sustituyente β]

Grupo hidroxilo; grupos cicloalquilo C3 a C8 (que pueden estar sustituidos con un átomo de halógeno o un grupo alquilo); grupos alcoxi C1 a C10; grupos alquiltio C1 a C10; grupos alquilsulfonilo C1 a C10; grupos alcoxicarbonilo C1 a C10; grupos haloalquenilo C2 a C6; grupo amino (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos iguales o diferentes seleccionados de grupos alquilo C1 a C10, grupo acilo C1 a C6; grupos haloalquilcarbonilo C1 a C4, grupos alquilsulfonilo C1 a C10 y grupos haloalquilsulfonilo C1 a C4); grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos alquilo C1 a C10 iguales o diferentes); grupo acilo C1 a C6; grupos haloalquilcarbonilo C1 a C4; grupos alcoxiimino C1 a C10; grupo ciano; grupo fenilo opcionalmente sustituido; y grupo fenoxi opcionalmente sustituido.

[Grupo sustituyente γ]

Grupos alcoxicarbonilo C1 a C10; grupo fenilo opcionalmente sustituido; grupos heterocíclicos aromáticos opcionalmente sustituidos; grupo ciano; y grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos alquilo C1 a C10 iguales o diferentes).

2. Un derivado de isoxazolina de acuerdo con la reivindicación 1, donde el grupo sustituyente α en el heterociclo que puede estar sustituido con 0 a 6 grupos iguales o diferentes, incluye un grupo hidroxilo; átomos de halógeno; grupos alquilo C1 a C10; grupos alquilo C1 a C10 cada uno monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente β, grupos haloalquilo C1 a C4; grupos cicloalquilo C3 a C8; grupos alcoxi C1 a C10; grupos alcoxi C1 a C10 cada uno monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente γ; grupos haloalcoxi C1 a C4; grupos cicloalquiloxi C3 a C8; grupos cicloalquil C3 a C8 alquiloxi C1 a C3; grupos alquiltio C1 a C10; grupos alquiltio C1 a C10 cada uno monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente γ; grupos haloalquiltio C1 a C4; grupos alquenilo C2 a C6; grupos alqueniloxi C2 a C6; grupos alquinilo C2 a C6; grupos alquiniloxi C2 a C6; grupos alquilsulfonilo C1 a C10; grupos haloalquilsulfonilo C1 a C4; grupo fenilo opcionalmente sustituido; grupo fenoxi opcionalmente sustituido; grupo feniltio opcionalmente sustituido; grupos heterocíclicos aromáticos opcionalmente sustituidos; grupos oxi heterocíclicos aromáticos opcionalmente sustituidos; grupos tio heterocíclicos aromáticos opcionalmente sustituidos; grupos fenilsulfonilo opcionalmente sustituidos; grupos sulfonilo heterocíclicos aromáticos opcionalmente sustituidos; grupo acilo C1 a C6; grupos haloalquilcarbonilo C1 a C4; grupo bencilcarbonilo opcionalmente sustituido; grupo benzoilo opcionalmente

sustituido; grupo carboxilo; grupos alcoxicarbonilo C1 a C10; grupo ciano; grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos iguales o diferentes seleccionados de grupos alquilo C1 a C10 y grupo fenilo opcionalmente sustituido); grupo nitro; y grupo amino (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos iguales o diferentes seleccionados de grupos alquilo C1 a C10, grupo fenilo opcionalmente sustituido, grupo acilo C1 a C6, grupos haloalquilcarbonilo C1 a C4, grupo bencilcarbonilo opcionalmente sustituido, grupo benzoilo opcionalmente sustituido, grupos alquilsulfonilo C1 a C10, grupos haloalquilsulfonilo C1 a C4, grupo bencilsulfonilo opcionalmente sustituido, y grupo fenilsulfonilo opcionalmente sustituido); cuando el grupo heterocíclico está sustituido en las dos posiciones adyacentes con dos grupos alquilo, dos grupos alcoxi, un grupo alquilo y un grupo alcoxi, un grupo alquilo y un grupo alquiltio, un grupo alquilo y un grupo alquilsulfonilo, un grupo alquilo y un grupo monoalquilamino, o un grupo alquilo y un grupo dialquilamino, todos seleccionados del grupo sustituyente α, los dos grupos pueden formar, junto con los átomos a los que están unidos, un anillo de 5 a 8 miembros que puede estar sustituido con 1 a 4 átomos de halógeno.

3. Un derivado de isoxazolina de acuerdo con la reivindicación 2, donde el grupo sustituyente α en el heterociclo que puede estar sustituido con 0 a 6 grupos iguales o diferentes, incluye átomos de halógeno; grupos

alquilo C1 a C10; grupos haloalquilo C1 a C4; grupos alcoxi C1 a C10 alquilo C1 a C3; grupos cicloalquilo C3 a C8 (que pueden estar sustituidos con un átomo de halógeno o un grupo alquilo); grupos alcoxi C1 a C10; grupos haloalcoxi C1 a C4; grupos cicloalquil C3 a C8 alquiloxi C1 a C3; grupo fenoxi opcionalmente sustituido; grupos alquiltio C1 a C10; grupos alquilsulfonilo C1 a C10; grupos acilo; grupos haloalquilcarbonilo C1 a C4; grupos alcoxicarbonilo C1 a C10; grupo ciano y grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos alquilo C1 a C10 iguales o diferentes).

4. Un derivado de isoxazolina de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1, 2 ó 3, donde R^1 y R^2 pueden ser iguales o diferentes y cada uno es un grupo metilo o un grupo etilo; y R^3, R^4, R^5 y R^6 son, cada uno, un átomo de hidrógeno.

5. Un derivado de isoxazolina de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 3 ó 4, donde Y es un grupo heterocíclico aromático de 5 ó 6 miembros que tiene un heteroátomo seleccionado de un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre.

6. Un derivado de isoxazolina de acuerdo con la reivindicación 5, donde Y es un grupo tienilo, un grupo pirazolilo, un grupo isoxazolilo, un

grupo isotiazolilo, un grupo piridilo o un grupo pirimidinilo.

7. Un derivado de isoxazolina de acuerdo con la reivindicación 6, donde Y es un grupo tiofen-3-ilo, un grupo pirazol-4-ilo, un grupo pirazol-5-ilo, un grupo isoxazol-4-ilo, un grupo isotiazol-4-ilo, un grupo piridin-3-ilo o un grupo pirimidin-5-ilo.

8. Un derivado de isoxazolina de acuerdo con la reivindicación 7, donde Y es un grupo tiofen-3-ilo y el anillo tiofeno está sustituido con el grupo sustituyente α en las posiciones 2 y 4.

9. Un derivado de isoxazolina de acuerdo con la reivindicación 7, donde Y es un grupo pirazol-4-ilo y el anillo pirazol está sustituido en las posiciones 3 y 5 con el grupo sustituyente α y en la posición 1 con un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1 a C10, un grupo alquilo C1 a C10 monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente β, un grupo haloalquilo C1 a C4, un grupo cicloalquilo C3 a C8, un grupo alquenilo C2 a C6, un grupo alquinilo C2 a C6, un grupo alquilsulfinilo C1 a C10, un grupo alquilsulfonilo C1 a C10, un grupo alquilsulfonilo C1 a C10 monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente γ, un grupo haloalquilsulfonilo C1 a C4, un grupo fenilo opcionalmente sustituido, un grupo heterocíclico aromático opcionalmente sustituido, un

grupo fenilsulfonilo opcionalmente sustituido, un grupo sulfonilo heterocíclico aromático opcionalmente sustituido, un grupo acilo, un grupo haloalquilcarbonilo C1 a C4, un grupo bencilcarbonilo opcionalmente sustituido, un grupo benzoilo opcionalmente sustituido, un grupo alcoxicarbonilo C1 a C10, un grupo benciloxicarbonilo opcionalmente sustituido, un grupo fenoxicarbonilo opcionalmente sustituido, un grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos iguales o diferentes seleccionados de grupos alquilo C1 a C10 y grupo fenilo opcionalmente sustituido), o un grupo amino (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos iguales o diferentes seleccionados de grupos alquilo C1 a C10, grupo fenilo opcionalmente sustituido, grupos acilo, grupos haloalquilcarbonilo C1 a C4, grupo bencilcarbonilo opcionalmente sustituido, grupo benzoilo opcionalmente sustituido, grupos alquilsulfonilo C1 a C10, grupos haloalquilsulfonilo C1 a C4, grupo bencilsulfonilo opcionalmente sustituido y grupo fenilsulfonilo opcionalmente sustituido).

10. Un derivado de isoxazolina de acuerdo con la reivindicación 7, donde Y es un grupo pirazol-5-ilo y el anillo pirazol está sustituido en la posición 4 con el grupo sustituyente α y en la posición 1 con un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1 a C10, un grupo alquilo C1 a C10 monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente β, un

grupo haloalquilo C1 a C4, un grupo cicloalquilo C3 a C8, un grupo alquenilo C2 a C6, un grupo alquinilo C2 a C6, un grupo alquilsulfinilo C1 a C10, un grupo alquilsulfonilo C1 a C10, un grupo alquilsulfonilo C1 a C10 monosustituido con un grupo seleccionado del grupo sustituyente γ, un grupo haloalquilsulfonilo C1 a C4, un grupo fenilo opcionalmente sustituido, un grupo heterocíclico aromático opcionalmente sustituido, un grupo fenilsulfonilo opcionalmente sustituido, un grupo sulfonilo heterocíclico aromático opcionalmente sustituido, un grupo acilo, un grupo haloalquilcarbonilo C1 a C4, un grupo bencilcarbonilo opcionalmente sustituido, un grupo benzoilo opcionalmente sustituido, un grupo alcoxicarbonilo C1 a C10, un grupo benciloxicarbonilo opcionalmente sustituido, un grupo fenoxicarbonilo opcionalmente sustituido, un grupo carbamoilo (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos iguales o diferentes seleccionados de grupos alquilo C1 a C10 y grupo fenilo opcionalmente sustituido), o un grupo amino (su átomo de nitrógeno puede estar sustituido con grupos iguales o diferentes seleccionados de grupos alquilo C1 a C10, grupo fenilo opcionalmente sustituido, grupos acilo, grupos haloalquilcarbonilo C1 a C4, grupo bencilcarbonilo opcionalmente sustituido, grupo benzoilo opcionalmente sustituido, grupos alquilsulfonilo C1 a C10, grupos haloalquilsulfonilo C1 a C4, grupo bencilsulfonilo opcionalmente sustituido y grupo fenilsulfonilo opcionalmente sustituido).

11. Un derivado de isoxazolina de acuerdo con la reivindicación 7, donde Y es un grupo isoxazol-4-ilo y el anillo isoxazol está sustituido con el grupo sustituyente α en las posiciones 3 y 5.

12. Un derivado de isoxazolina de acuerdo con la reivindicación 7, donde Y es un grupo isotiazol-4-ilo y el anillo isotiazol está sustituido con el grupo sustituyente α en las posiciones 3 y 5.

13. Un derivado de isoxazolina de acuerdo con la reivindicación 7, donde Y es un grupo piridin-3-ilo y el anillo piridina está sustituido con el grupo sustituyente α en las posiciones 2 y 4.

14. Un derivado de isoxazolina de acuerdo con la reivindicación 7, donde Y es un grupo pirimidin-5-ilo y el anillo pirimidina está sustituido con el grupo sustituyente α en las posiciones 4 y 6.

15. Un derivado de isoxazolina de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14, donde n es un número entero de 2.

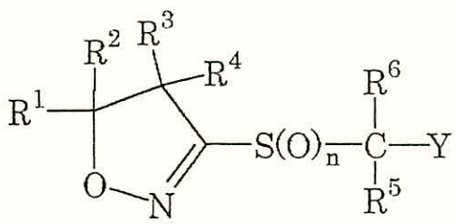
16. Un derivado de isoxazolina de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14, donde n es un número entero de 1.

17. Un derivado de isoxazolina de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14, donde n es un número entero de 0.

18. Un herbicida que contiene, como ingrediente activo, un derivado de isoxazolina expuesto en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 17, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

Resumen de la invención

Un derivado de isoxazolina representado por la siguiente fórmula general [I]:



[I]

donde R^1 y R^2 pueden ser iguales o diferentes y cada uno es un grupo alquilo;

R^3, R^4, R^5 y R^6 son, cada uno, un átomo de hidrógeno;

Y es un grupo heterocíclico aromático opcionalmente sustituido de 5 a 6 miembros o un grupo heterocíclico aromático fusionado que tiene un heteroátomo seleccionado de un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre; y

n es un número entero de 0 a 2.

El derivado de isoxazolina tiene un excelente efecto herbicida y una

excelente selectividad entre el cereal y la maleza.

5984768
6506768

CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA

TOKIO-JAPON

El suscrito, Encargado de las Funciones Consulares en Tokio, vistos los siguientes documentos:

1) Certificados de registro mercantil de las compañias;
2) Certificados auténticos sobre autorización para otorgar el poder;

C E R T I F I C A :

Que las compañías, KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD. e IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD. son sociedades constituidas de acuerdo con las leyes del Japón y cumple su objeto social conforme a las mismas.
QUE el señor NOBUHIKO MOCHIZUKI en su carácter de "PRESIDENTE" de las citadas compañías, está autorizado para conferir el poder adjunto.
Que el señor TAKEO SAITO, quien autentica los mencionados documentos, es funcionario autorizado de la División Consular del Ministerio de Relaciones Exteriores del Japón, y su firma coincide con la registrada en este Consulado.
El Encargado de las Funciones Consulares no asume responsabilidad alguna por el contenido del documento adjunto.

Tokio, 14 de mayo de 1996

CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA TOKIO

Luis A. Hernández S.
Segundo Secretario
Encargado de
las Funciones Consulares

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
-6 AGO 2003
JUAN MANUEL ESTEVEZ MEDINA
NOTARIO

Número: 63
Derechos: US$106(Resolución 2570, Sep.30/92)
(Ciento seis dólares)

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE

96606.

ANA MARIA SALVETTI
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
INGLES - ITALIANO - ESPAÑOL
RES. No. 158 MINJUSTICIA

CONSULADO GENERAL

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, RAGO CONSTA QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA

- 5 AGO 2003

JUAN MANUEL SOTERO MESNA
NOTARIO

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES

RESPONSABILIDAD DEL TEXTO
NO SE ASUME

96 MAY 27

CAVELIER
ABOGADOS
EDIFICIO SISKI
CARRERA 4ª Nº 72-35
BOGOTA, 8 - COLOMBIA

KM-81-CO-X
(代表Fo#1)
Leg. 5

269
269

For patents, utility models, industrial designs, trademarks, commercial names, trade emblems, slogans.

Para patentes, modelos de utilidad, diseños industriales, marcas de fábrica, nombres comerciales, enseñas, lemas comerciales.

REPRESENTACION Y PODER

REPRESENTATION AND POWER OF ATTORNEY

I (we), the undersigned/Yo (nosotros), abajo firmado (s)
Kumiai Chemical Industry Co., Ltd. and Ihara Chemical Industry Co., Ltd.

of/domiciliado (s) en
4-26, Ikenohata 1-chome, Taitoh-ku, Tokyo, Japan and - ditto -

por el presente nombramos a GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciliados en la Carrera 4ª Nº 72-35, Bogotá, Colombia, en obedecimiento a lo dispuesto en el parágrafo 1º del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como mis (nuestros) representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero; y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplentes, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

Además, confiero (conferimos) poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial, así como los tribunales de arbitramento, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, y diseños industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas, de servicio, lemas comerciales, nombres comerciales, enseñas, variedades vegetales y denominaciones de origen; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de competencia desleal, protección del consumidor, oposiciones u observaciones, cancelación administrativa y judicial, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias, la tutela, la protección de secretos industriales, y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos; acciones y procesos que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del proceso, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de agentes oficiosos.

in due compliance with the terms of paragraph 1st. of article 543 of the Commercial Code, do hereby appoint GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; and LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciled at Carrera 4ª Nº 72-35, Bogotá, Colombia, the first as principal and the others as alternates, in the order of their appointment, as our representatives for all industrial property matters with faculty to receive notifications and to appoint attorneys in and out of Court. The first alternate shall replace the principal in case of his absence or of temporal or definitive impediment. The same rule will apply when the second alternate representative is to replace the first one, or when the third is to replace the first or second alternates in their turn, or both of them, second. In such cases, the principal representative, or the first or second alternates in their turn, or both of them, shall state their intention not to act as representatives through a declaration given before a Notary Public in Colombia, or before a Notary or another Public Official or a Colombian Consul abroad; and in case of impediment, the appropriate certificate shall suffice. If any of the appointees were to be definitely absent, the following alternate shall take his place. When the absence or impediment of the principal representative, or of the first or second alternate in their turn ceases, the representation can be taken again in their sequence, by the principal, the first or second alternate depending on case, and the mere fact or its exercise will suffice. The exercise of the representation by the first, second or third alternates in their turn shall end at such time.

In addition, we grant a Power of Attorney in favor of the above-named attorneys-at-law so that they may obtain the protection of my (our) industrial property and against the unfair competition, for which purpose I (we) authorize the said attorneys to represent me (us) before any authorities or persons, with or without jurisdiction, specially those administrative, administrative contentious and judicial, as well as before Arbitration Court, in all matters concerning the following: a) Obtainment of patents, utility models and industrial designs; the registration of trademarks, collective, defensive and service marks, slogans, commercial names, trade emblems, vegetal varieties and denominations of origin; its renewal, assignment, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses of use of the above rights; b) Actions of unfair competition, protection to the consumer, oppositions or observations, administrative or Court cancellation, nullity, infringement, granting of licenses, the action for writ mandamus, the protection of trade secrets, and in general the civil, penal, and administrative suits relating to those rights; actions and suits instituted by me (us) or against me (us). And that in all the above matters they may substitute this Power of Attorney, compromise, conciliate, admit the facts of the case, desist, cancel, receive, resign, and ratify acts done by representatives without a power of attorney.

- 5 AGO 2003
JUAN MANUEL ROJAS MEDINA
NOTARIO

Given and signed this/Dado y firmado hoy
26th day of April, 1996
in/en Japan

Nobuhiko Mochizuki
Firma Nobuhiko Mochizuki, Signature
President of
Kumiai Chemical Industry Co., Ltd.

© CAVELIER ABOGADOS
WPPODERE-1 (MINUTA Nº 12.1.1.2.6)

96606

ANA MARIA SALVETTI
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
INGLES - ITALIANO - ESPAÑOL
RES. No. 158 MINJUSTICIA

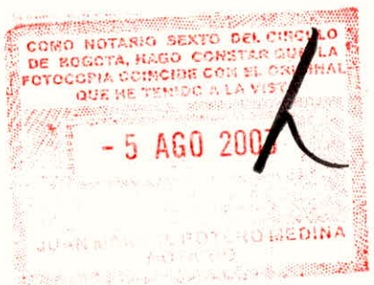
Nobuhiko Mochizuki
Nobuhiko Mochizuki,
President of
Ihara Chemical Industry Co., Ltd.

LEGALIZACION

El Señor Cónsul de Colombia debe expedir un *certificado consular* sobre (1) la existencia legal de la compañía que otorga el poder, (2) que ésta ejerce su objeto social, y (3) que las personas que otorgan el poder están autorizadas para darlo. A este efecto les solicitamos que muestren al Señor Cónsul las pruebas que acreditan esos hechos (1), (2) y (3).

LEGALIZATION

The Colombia Consul must issue a *consular certificate*, on (1) the legal existence of the company which grants the Power-of-Attorney, (2) that it is in actual exercise of its company purposes, and (3) that the persons who execute the Power of Attorney is autorized to do so. To this effect, please show the Consul the evidence to prove the above facts (1), (2) and (3).



NOTA PARA EL SEÑOR CONSUL DE COLOMBIA: Según los artículos 65 del C. de P.C. y 480 del C. de Co., si el poderdante es una sociedad, el Señor Cónsul debe certificar que tuvo a la vista las pruebas de su existencia, que ejerce su objeto social y que quien confiere el poder es su representante.

KM-81-10-X 270
(Leg)
(Power) 270

NOTARY CERTIFICATE

I, the undersigned, Notary do hereby certify that Yorihiro Sekiguchi, an agent of Mr. Nobuhiko Mochizuki, President of Kumiai Chemical Industry Co., Ltd. and Mr. Nobuhiko Mochizuki, President of Ihara Chemical Industry Co., Ltd. being leagly constituted and existing in accordance with the Laws of Japan and located at 4-26, Ikenohata 1-chome, Taitoh-ku, Tokyo 110, Japan and - ditto -, who have been autorized to sign the attached document, has stated in my very presence that said Mr. Nobuhiko Mochizuki acknowledged himself to have signed the attached document and that his signature is true and genuine.

Dated: on this 9 th day of MAY , 1996

Sigeru Sato

Sigeru Sato NOTARY

7-5, 1-CHOME KAJICHO CHIYODAKU TOKYO JAPAN
ATTACHED TO
TOKYO LEGAL AFFAIRS BUREAU

NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
- 5 AGO 2003
JOAN MAR... MEDINA

96606

ANA MARIA SALVETTI
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
INGLES - ITALIANO - ESPAÑOL
RES. No. 158 MINJUSTICIA

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA

- 5 AGO 2003

JUAN MANUEL GUTIERREZ MEDINA
NOTARIO

平成 8 年登簿第 97 号

認　　証

添付の書類に於ける署名者クミアイ化学工業株式会社代表取締役望月信彦及びイハラケミカル工業株式会社代表取締役望月信彦の代理人関口順弘は本職の面前において各本人は自己の署名を自認した旨陳述した

よつて、これを認証する。

平成 8 年 5 月 9 日、本公証人役場において

東京都千代田区鍛冶町1丁目7番5号

東京法務局所属

公証人 佐藤 榮

総公証 No. 026271 号

証　　明

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

平成 8 年 5 月 9 日

東京法務局長 平本喜祿

MINISTRY OF FOREIGN AFFAIRS · JAPAN · 日本国外務省

96606

ANA MARIA SALVETTI
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
INGLES - ITALIANO - ESPAÑOL
RES. No. 153 MINJUSTICIA

CERTIFICATE

This is to certify that the signature affixed above has been provided by Notary, duly authorized by the Tokyo Legal Affairs Bureau and that the Official Seal appearing on the same is genuine.

Date MAY. - 9. 1996

Nobuyoshi HIRAMOTO

Director of the Tokyo Legal Affairs Bureau

For legalization by the foreign consul in Japan
this is to certify that the Seal affixed hereto
is genuine.
Tokyo, MAY 10 1996

Official
Ministry of Foreign Affairs
(Consular and Migration Policy Division)

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, NADO CONSTA QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA

- 5 AGO 2003

272

TRADUCCION OFICIAL No.96606 de un documento escrito en inglés, el cual para su identificación se sella con el sello del Traductor al mismo tiempo que la presente. Esta Traducción ha sido preparada por Ana María Salvetti, Traductora Oficial debidamente reconocida por el Ministerio de Relaciones Exteriores y aprobada por el Ministerio de Justicia colombiano mediante Resolución No.158 de 1991.

(Se traducen sellos y legalizaciones que aparecen a continuación de un documento de poder escrito en inglés y español, otorgado por las sociedades **Kumiai Chemical Industry Co., Ltd. e Ihara Chemical Industry Co.**, a favor de Germán CAVELIER, Gonzalo PERDOMO, Emilio FERRERO, y Luz Clemencia de PAEZ.)

Dado y firmado el 26 de abril de 1996, en Japón, Por (Firmado), Nobuhiko Mochizuki, Presidente de Kumiai Chemical Industry Co., Ltd. Por (Firmado), Nobuhiko Mochizuki, Presidente de Ihara Chemical Industry Co., Ltd.

CERTIFICADO NOTARIAL

Yo, el suscrito Notario, por medio del presente certifico que Yorihiro Sekiguchi, agente del Sr. Nobuhiko Mochizuki, Presidente de Kumiai Chemical Industry Co., Ltd. y el Sr. Nobuhiko Mochizuki, Presidente de Ihara Chemical Industry Co., Ltd., legalmente constituidas y existentes de acuerdo con las leyes de Japón y situadas en 4-26, Ikenohata 1-chome, Taitoh-ku, Tokio 110, Japón e - ídem -, quienes han sido autorizados para firmar el documento adjunto, ha declarado en mi presencia que dicho Nobuhiko Mochizuki reconoció él mismo

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA ES FIEL Y CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
- 5 AGO 2003
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

273
273

haberlo firmado y que su firma es fiel y auténtica. Fechado: hoy 9 de mayo de 1996. (Firmado), Sigeru Sato NOTARIO. Sello en tinta: 7-5, 1-Chome Kajicho Chiyodaku Tokio Japón Adscrita a la Oficina de Asuntos Legales de Tokio. Sello rectangular en tinta roja.

No.026271

CERTIFICADO

Por el presente se certifica que la firma arriba estampada ha sido expedida por Notario, debidamente autorizado por la Oficina de Asuntos Legales de Tokio, y que el Sello Oficial que allí aparece es auténtico. Fecha 9 de mayo de 1996. Sello en tinta: Nobuyoshi HIRAMOTO, Director de la Oficina de Asuntos Legales de Tokio.

Sello en tinta: Para legalización por el Cónsul extranjero en Japón, por el presente se certifica que el Sello estampado al presente es auténtico. Tokio, 10 de mayo de 1996. (Firmado), ilegible, Funcionario, Ministerio de Asuntos Exteriores (División de Política Migratoria y Consular). Sello circular en tinta del Ministerio de Asuntos Extranjeros.

(en español): **Certificación No.63** del 14 de mayo de 1996 de la firma que antecede y sobre la existencia y representación de las sociedades mencionadas por el Consulado de Colombia en Tokio. Pagados impuesto de timbre y derechos de fondo rotatorio. (Firmado), Luis A. Hernández S., Cónsul. Sello consular en tinta. **Certificación No.159161** del 27 de mayo de 1996 de la firma que antecede por el Ministerio de Relaciones

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA ANTERIOR ES FIEL Y EXACTA DE LA QUE SE TUVO A LA VISTA
- 9 ABR 2003
JUAN MANUEL GUTIERREZ MEDINA
NOTARIO

ANA MARIA SALVETTI
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
INGLES - ITALIANO - ESPAÑOL
RES. No. 158 MINJUSTICIA

274
274

Exteriores. (Firmado), Jefe Legalizaciones.

Es traducción fiel y completa de la cual se deja copia en los archivos de esta oficina para su confrontación y a la cual me remito.

Santa fe de Bogotá, 5 de junio de 1996

COLO-5984-801-002-7

ams/25

ANA MARIA SALVETTI
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
INGLES - ITALIANO - ESPAÑOL
RES. No. 158 MINJUSTICIA

COMO NOTARIO SEXTO DE SANTAFE DE BOGOTA
HE CONSTAR QUE LA FIRMA DE Ana Maria Salvetti
C. C.
COINCIDE CON LA REGISTRADA POR EL (ELLOS)
EN ESTA NOTARIA. 07 JUN. 1996

SANTAFE DE BOGOTA, D. C.

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES
ESTA FIRMA RECONOCIDA
JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

MOISE ASSUME
RESPONSABILIDAD EN TEXTO
1996 JUN -6 P 4:23

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA PRESENTE FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
- 5 AGO 2003
JUAN MANUEL ROTERO MEDINA
NOTARIO

CAVELIER
ABOGADOS

TELEFAX (57) (1) 2358850
TELEX: 45479 CAVE CO
(231)740 7375 CAVE UC

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4ª, No. 72-35
BOGOTA 8, COLOMBIA

CORREO ELECTRONICO MUNDIAL: CAVE
TELEFONO (57) (1) 2120100
CABLES: CAVELEYES

Señor Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

Poderdante: KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD. AND
IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.

Poder conferido el: 26-04-96

Yo, GERMAN CAVELIER, obrando en mi calidad de apoderado principal del poderdante arriba mencionado, atentamente manifiesto a Usted que sustituyo el poder que me ha sido conferido en la persona del doctor EMILIO FERRERO, Abogado con Tarjeta Profesional No. 31.929, con todas las facultades que me fueron conferidas.

Hago la anterior sustitución conforme al artículo 66 del Código de Procedimiento Civil ya que los otros sustitutos faltan en este momento.

Señor Jefe,

GERMAN CAVELIER
T.P.A. No. 832
C.C. No. 2.877.924 de Bogotá

Acepto:

EMILIO FERRERO
T.P.A. Nº 31.929
C.C. No. 438.019 de Usaquén

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA CONCUERDA CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
- 5 AGO 2003
JUAN MANUEL [illegible] MEDINA

2e-780-2

NOTARIA SEXTA DE BOGOTA

RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL

Santafé de Bogotá D. C. 27 MAYO 1998

Ante Mí JUAN MANUEL BOTERO MEDINA

NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA

Compareció(eron) personalmente, [illegible]

quien(es) exhibió(eron) la(s) C. C. 2877924
4380179

y la(s) Libreta(s) Militar(es): DAU = 852
DAU = 31429

[illegible] en Bogotá, y declaró(aron) que la(s) firma(s) que aparece(n) en el presente documento es(son) la(s) suya(s) y que el contenido del mismo es cierto.

En consecuencia se firma esta diligencia..

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA

- 5 AGO 2003

JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

REPUBLICA DE COLOMBIA
Juan Manuel Botero Medina
Notaría Sexta
SANTAFE DE BOGOTA D. C.

Se saco folio 276 correspondiente al Acta final.

Sep. 16/03.

276 ~~277~~ 277

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 03067453 00000000 Folios: 277
Fecha (AMD): 2003-08-06 17:04:23
Tramite : 011 PCT-PATENT 3/9 FASE NACI 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA . 19 - 50,621
FECHA : JULIO 21 DE 2003

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

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
DAVALIER ASESORES	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	8873192	21/07/2003	33,074,480.00

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

CANT.	SERVICIO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	51X5-01-01 SOLICITUDES	7 TRAMITES DE SOL. DE DISENOS INDUS	400,000.00
		TOTAL : $	400,000.00

SON: CUATROCIENTOS MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Ciclo 13863-841-001-7

278

277

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 03067453 00000000 Folios: 277
Fecha (AMD): 2003-08-06 17:04:23
Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL TRAMITE

	USUARIO	RADICADOR
PATENTE DE INVENCIÓN MODELO DE UTILIDAD	( )	( )
- Indicación de que se solicita la concesión de una patente.	( )	( )
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud.	( )	( )
- Descripción de la invención.	( )	( )
- Dibujos de ser estos pertinentes.	( )	( )
- Comprobante de Pago de las tasas establecidas.		
COMPLETA ( ) INCOMPLETA	( )	( )
DISEÑO INDUSTRIAL ( )		
- Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial	( )	( )
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta	( )	( )
- la solicitud.		
- Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del Material que incorpora el diseño.	( )	( )
Comprobante de pago de las tasas establecidas	( )	( )
COMPLETA ( ) INCOMPLETA	( )	( )
ESQUEMA DE TRAZADO ( )		
- Indicación de que solicita el registro de un Esquema de trazado.	( )	( )
- Datos de Identificación del solcitante 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:

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

278

2020
Bogotá, D.C.,

Doctor:
EMILIO FERRERO
Apoderado
Kumiai Chemical Industry CO., LTD e Ihara Chemical Industry CO., LTD.

Oficio N° 08434

ASUNTO:

Radicación N°	03-067453
Solicitud internacional	PCT/JP02/01015
Fecha inicio fase nacional	08/09/2003
Trámite	011
Evento	379
Actuación	430
Folios	001

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

- La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante. (Art. 26-k) Decisión 486).

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

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001.

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones.

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha, 10 OCT. 2008.

202054

279

CAVELIER
ABOGADOS

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72 - 35
BOGOTA 8, COLOMBIA

WEB SITE: www.cavelier.com
E-MAIL: cavelier@cavelier.com

SUPERINTENDENCIA I COMERCIO
Radicación : 03067453 [illegible] Folios: 2
Fecha (AMD): 2003-12-09 17:24:01
Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE MACT 467 SOLICITUD
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Señora Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

Trámite :011
Evento :379
Actuación:467

Referencia : Expediente No. **03.067.453**

Asunto : Solicitud de patente para **"ISOXAZOLINE DERIVATIVE AND HERBICIDE COMPRISING THE SAME AS ACTIVE INGREDIENT"**

Solicitante : **KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD. AND IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.**

Fecha de Solicitud : 6 DE AGOSTO DE 2003

1. Yo, Emilio FERRERO, como apoderado del solicitante, en el asunto antes identificado, atentamente solicito a Usted se sirva concederme un plazo de dos (2) meses, para atender el oficio No. 08434 notificado por fijación en lista del 10 de octubre de 2003.

2. Presento con este memorial, el recibo No. 03-75,094 expedido por el Fondo Especial de la Superintendencia de Industria y Comercio, en donde consta el pago hecho por valor de $ 60.000 en conformidad con lo dispuesto en la Resolución No. 41687 del 24 de diciembre de 2002.

Bogotá, 09 DIC. 2003
Señora Jefe,

EMILIO FERRERO
T.P.A. No. 31.929

COLO 13863-841-001-7
MRE/DLM/ID-000004/WPC13863

280

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 0306/433 00000002 Folios: 2
Fecha (AMD): 2003-12-09 17:24:01
Tramite : 011 PCT-PATENT 379 PRR: NACL 46/ SOLICITUD
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 03 - 81,648
FECHA : NOVIEMBRE 10 DE 2003

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

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	19923924	10/11/2003	40,001,000.00

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

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-08 PRORROGA DE TERMINOS	31 PRORROGA DE TERMINOS	60,000.00
		TOTAL : $	60,000.00

SON: SESENTA MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No._____

Cdo 13863-841-001-7