

TÍTULO DE LA INVENCION:

COMPUESTO DE PIRIDAZINONA O SU SAL Y HERBICIDA QUE LO CONTIENE

CAMPO TÉCNICO

10 La presente invención se refiere al compuesto de piridazinona o su sal. Más específicamente, se refiere a un compuesto novedoso de piridazinona o su sal útil como principio activo de un herbicida, y un herbicida que lo contiene.

ANTECEDENTE DE LA TÉCNICA

15 El documento de patente 1 revela un compuesto de piridazinona que tiene una estructura química específica. El compuesto tiene un grupo -O-A en la posición 4 de un anillo de benceno sustituido en el anillo de piridazinona y tiene una estructura química diferente de la del compuesto de la presente invención.

20 El documento de patente 2 revela un compuesto heteroaromático que tiene una estructura química específica. EL compuesto no tiene ningún anillo de piridazinona como sustituyente en las posiciones m (sustituyentes R3 y R4 en el documento de patente 2) de un anillo de fenilo unido al anillo de piridina a través de L1 y se distingue del compuesto de la presente invención.

25 El documento de patente 3 revela un compuesto de piridazinona que tiene una estructura química específica. El compuesto tiene un grupo fenilo o grupo heteroaromático directamente unido a un sustituyente G (anillo de benceno) en el anillo de piridazinona y tiene una estructura química diferente de la del compuesto de la presente invención.

30 El documento de patente 4 revela un compuesto de piridazinona que tiene una estructura química específica. El compuesto tiene un sustituyente (sustituyente R¹ en el documentos de patente 4) que corresponde al sustituyente Q en la formula (I) mencionada más adelante de la presente solicitud, la cual es un grupo NR¹⁰R¹¹ o un grupo de anillo heterocicloalquilo y tiene una estructura química diferente de la del compuesto de la presente invención.

DOCUMENTOS DEL ARTE PREVIO

DOCUMENTOS DE PATENTE

Documento de patente 1: WO2014/119770

Documento de patente 2: WO2014/207601

5 Documento de patente 3: WO2009/086041

Documento de patente 4: WO2008/013838

DIVULGACIÓN DE LA INVENCION

PROBLEMA TÉCNICO

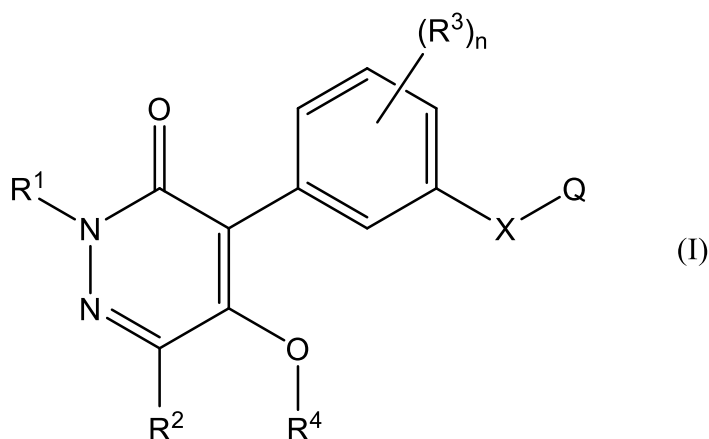
10 Es un objeto de la presente invención proporcionar un herbicida que tenga excelentes actividades herbicidas contra malezas, para ahorrar mano de obra en la operación de control de malezas y para mejorar la productividad de las plantas agrícolas y hortícolas.

15 SOLUCIÓN AL PROBLEMA

Los presentes inventores han llevado a cabo amplios estudios para alcanzar el objeto antes mencionado y, como resultado, encontraron que un compuesto de piridazinona que tiene una estructura química específica tiene altos efectos herbicidas contra una amplia variedad de malezas con una dosis baja, y lograron la presente

20 invención.

Es decir, la presente invención se refiere a un compuesto de piridazinona representado por la fórmula (I) o su sal:



25 en donde X es -O-, -S-, -SO-, -SO₂- o -N (Y) -;

Q es arilo monocíclico que puede estar sustituido por Z, heteroarilo monocíclico que puede estar sustituido por Z, arilo bicíclico que puede estar sustituido por Z, o heteroarilo bicíclico que puede estar sustituido por Z;

Y es un átomo de hidrógeno o alquilo;

30 R¹ es alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, haloalquilo, arilo monocíclico que puede estar sustituido por Z, arilalquilo monocíclico que puede estar sustituido por Z, alquiltioalquilo, alquilsulfinilalquilo, alquilsulfonilalquilo,

5 dialquilaminoalquilo, alcoxialquilo, amino, nitro, alquilcarbonilalquilo, alcoxycarbonilalquilo o hidroxycarbonilalquilo;

R^2 es un átomo de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, halógeno, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo o ciano;

10 R^3 es halógeno, hidroxilo, alquilo, haloalquilo, alqueno, haloalqueno, alquino, haloalquino, alcoxi, haloalcoxi, nitro, amino, alquilcarbonilo o cicloalquilo;

R^4 es un átomo de hidrógeno, alquilo, $-C(O)R^6$, $-C(S)R^6$, $-SR^7$, $-SOR^7$, $-SO_2R^7$, arilalquilo monocíclico que puede estar sustituido por Z, alcoxialquilo, $-CH(J^1)OCOOJ^2$, alquilcarbonilalquilo, arilo monocíclico que puede estar sustituido por Z, arilcarbonilalquilo monocíclico que puede estar sustituido por Z, alqueno, 15 alcoxialcoxialquilo, alcoxycarbonilalquilo, alquino, cianoalquilo, haloalcoxialquilo o dialquilaminoalquilo;

R^6 es alquilo, alcoxi, morfolino, dialquilamino, (arilo monocíclico que puede estar sustituido por Z)(alquilo)amino, cicloalquilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, haloalquilo, alquiltio, alqueno, alquino, alcoxycarbonilalquilo, cicloalquilalquilo, cianoalquilo, 20 alcoxialcoxialquilo, arilo monocíclico que puede estar sustituido por Z, heteroarilo monocíclico que puede estar sustituido por Z, arilalquilo monocíclico que puede estar sustituido por Z, ariloxi monocíclico que puede estar sustituido por Z, ariltio monocíclico que puede estar sustituido por Z, ariloxialquilo monocíclico que puede estar sustituido por Z, ariltioalquilo monocíclico que puede estar sustituido por Z, alcoxycarbonilo, 25 alcoxialcoxi, haloalcoxi, haloalcoxiyalcoxi, alquiltioalcoxi, cycloalcoxiyalcoxi, arilalcoxi monocíclico que puede estar sustituido por Z, ariloxialcoxi monocíclico que puede estar sustituido por Z, heteroariloxialcoxi monocíclico que puede estar sustituido por Z, alquenoiloxialcoxi, alcoxialcoxialcoxi, alquinoiloxi, alquenoiloxi, haloalqueno, dialquilaminoalquilo, alquiltioalcoxialcoxi, cicloalquilalcoxi, cicloalquilalcoxialcoxi, 30 arilalcoxialcoxi monocíclico que puede estar sustituido por Z, heteroarilalcoxialcoxi monocíclico que puede estar sustituido por Z o cicloalcoxi que puede estar sustituido por Z;

R^7 es alquilo, haloalquilo, cicloalquilo o arilo monocíclico que puede estar sustituido por Z;

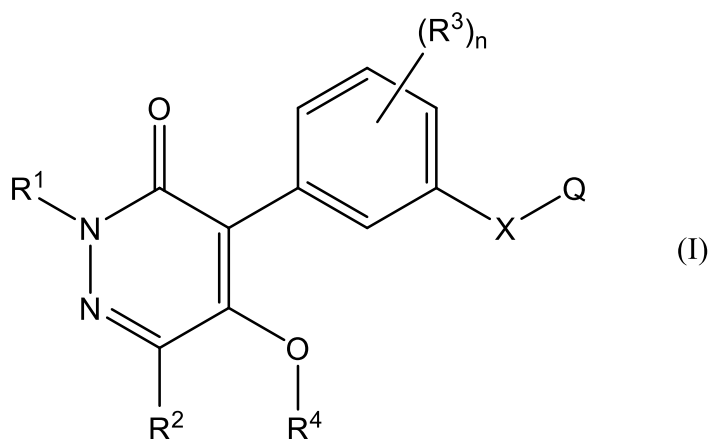
35 Z es halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, cicloalquilo, ciano, nitro, $-C(O)OR^5$, formilo, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, $-CH=NOJ^3$ o dialquilaminocarbonilo;

R^5 es un átomo de hidrógeno o alquilo;

J^1 es un átomo de hidrógeno o alquilo;

- 5 J^2 es alquilo o cicloalquilo;
 J^3 es un átomo de hidrógeno, alquilcarbonilo o alcoxialquilo; y
 n es un entero de 0 a 4.

Preferiblemente, la presente invención se refiere a un compuesto de piridazinona representado por la fórmula (I) o su sal:



- 10 en donde X es -O-, -S-, -SO-, -SO₂- o -N(Y)-;

Q es arilo monocíclico que puede estar sustituido por Z, heteroarilo monocíclico que puede estar sustituido por Z, arilo bicíclico que puede estar sustituido por Z o heteroarilo bicíclico que puede estar sustituido por Z;

Y es un átomo de hidrógeno o alquilo;

- 15 Z es halógeno, alquilo, haloalquilo, ciano, nitro o -C(O)OR⁵;

R¹ es alquilo, alquenilo, alquinilo o cicloalquilo;

R² es un átomo de hidrógeno, alquilo, haloalquilo o cicloalquilo;

R³ es halógeno, alquilo, haloalquilo, alquenilo, haloalquenilo, alquinilo, haloalquinilo, alcoxi, haloalcoxi o cicloalquilo;

- 20 R⁴ es un átomo de hidrógeno, alquilo, -C(O)R⁶ o -SO₂R⁷;

R⁵ es un átomo de hidrógeno o alquilo;

R⁶ es alquilo, alcoxi o morfolino;

R⁷ es alquilo; y

n es un entero de 1 a 4.

- 25 La presente invención se refiere además a un compuesto de piridazinona de la fórmula (I) o su sal, un herbicida que lo contiene como principio activo, y un método para el control de plantas no deseadas o para la inhibición de sus crecimiento, el cual comprende aplicar la cantidad herbicidamente efectiva del compuesto de piridazinona o su sal a las plantas no deseadas o a un lugar en el que estas crecen.

5 EFECTOS VENTAJOS DE LA INVENCION

El compuesto de piridazinona de la fórmula (I) o su sal de la presente invención, realiza una mejora extraordinaria en las actividades herbicidas contra las plantas no deseadas (maleza) en comparación con los compuestos similares convencionales.

10 DESCRIPCIÓN DE LAS MODALIDADES

El átomo de halógeno o átomo de halógeno como sustituyente en la fórmula (I) puede ser un átomo de flúor, cloro, bromo o yodo. El número de átomos de halógeno como sustituyentes puede ser 1 o al menos 2 y en el caso de al menos 2, los átomos de halógeno respectivos pueden ser iguales o diferentes entre sí. Además, las
15 posiciones de sustitución de tales átomos de halógeno pueden ser cualquier posición.

El alquilo o fracción alquilo en la fórmula (I) puede ser, por ejemplo, un grupo C₁-C₁₂ lineal o ramificado, tal como metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, tert-butilo, n-pentilo, neopentilo, n-hexilo, n-heptilo, n-octilo, n-nonilo, n-decilo, n-undecilo n-dodecilo.

20 El alcoxi o fracción alcoxi en la fórmula (I) puede ser, por ejemplo, un grupo C₁-C₁₂ lineal o ramificado, tal como metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, butoxi, pentiloxi, hexiloxi, heptiloxi, octiloxi, noniloxi, deciloxi, undeciloxi o dodeciloxi.

El alquenilo o la fracción alquenilo en la fórmula (I) puede ser, por ejemplo, un grupo C₂-C₆ lineal o ramificado, tal como vinilo, 1-propenilo, 2-propenilo, isopropenilo, 2-metil-1-propenilo, 1- metil-1-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 1-
25 butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-hexenilo o 2,3-dimetil-2-butenilo.

El alquinilo o la fracción alquinilo en la fórmula (I) puede ser, por ejemplo, un grupo C₂-C₆ lineal o ramificado, tal como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-
30 butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinil, 2-metil-3-butinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo o 5-hexinilo.

El cicloalquilo o fracción cicloalquilo en la fórmula (I) puede ser, por ejemplo, un grupo C₃-C₇, tal como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo o cicloheptilo.

El cicloalquiloxi o fracción cicloalquiloxi en la fórmula (I) puede ser, por ejemplo,
35 un grupo C₃-C₇, tal como ciclopropiloxi, ciclobutiloxi, ciclopentiloxi, ciclohexiloxi o cicloheptiloxi.

El arilo monocíclico en la fórmula (I) puede ser, por ejemplo, fenilo. Además, el heteroarilo monocíclico puede ser, por ejemplo, un heteroarilo de 3 a 6 miembros que contiene de uno a cuatro O, S o N, específicamente, tienilo, furilo, pirrolilo, oxazolilo,

isoxazolilo, isoxazolinilo, tiazolilo, isotiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,2,4-triazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,3,4-tetrazolilo, piridilo, pirimidilo, pirazinilo, piridazinilo, 1,3,5-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, imidazolinilo, imidazolidinilo, pirazolinilo o pirazolidinilo.

El arilo bicíclico en la fórmula (I) puede ser, por ejemplo, naftilo o indenilo.

Además, el heteroarilo bicíclico puede ser, por ejemplo, un heteroarilo condensado de un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros que contiene uno o dos O, S o N, y un anillo de benceno, específicamente, benzotienilo, benzofurilo, indolilo, benzotiazolilo, benzoimidazolilo, benzoisoxazolilo, benzoisotiazolilo, indazolilo, benzoxazolilo, quinolilo, isoquinolilo, quinoxalinilo, ftalazinilo, cinolinilo, quinazolinilo, naftiridinilo, piridopirimidilo, piridopirazinilo, imidazolopiridilo, tiazolopiridilo, pirazolopirimidilo, imidazolopirazinilo, imidazolopiridazinilo, triazolopiridilo, pirazinopirazinilo, pirazinopiridazinilo, pirimidopiridazinilo, pirimidopirimidilo, piridopiridazinilo, pirrolopiridilo, tienopiridilo, oxazolopiridilo, pirazolopiridilo, isoxazolopiridilo, isotiazolopiridilo, pirrolopirimidilo, tienopirimidilo, imidazolopirimidilo, oxazolopirimidilo, tiazolopirimidilo, isoxazolopirimidilo, isotiazolopirimidilo, pirrolopirazinilo, tienopirazinilo, oxazolopirazinilo, tiazolopirazinilo, pirazolopirazinilo, isoxazolopirazinilo, isotiazolopirazinilo, pirrolopiridazinilo, tienopiridazinilo, oxazolopiridazinilo, tiazolopiridazinilo, pirazolopiridazinilo, isoxazolopiridazinilo, isotiazolopiridazinilo, purinilo o pteridinilo.

En la fórmula (I), "que puede estar sustituido por Z" significa que cuando cada grupo está sustituido por Z, el número de sustituyentes Z puede ser uno o más, y en el caso en el que el número de sustituyentes pueda ser dos o más, tales sustituyentes pueden ser iguales o diferentes. La(s) posición(es) de sustitución de tal(es) sustituyente(s) puede(n) ser cualquier posición(es).

La sal del compuesto de piridazinona de la fórmula (I) incluye todo tipo de sales siempre que sean aceptables en la agricultura, y, por ejemplo, se pueden mencionar: sales de metales alcalinos tales como una sal de sodio y una sal de potasio; sales de metales alcalinotérreos tales como una sal de magnesio y una sal de calcio; sales de aminas tales como una sal de dimetilamina y una sal de trietilamina; sales de ácidos inorgánicos tales como un clorhidrato, un perclorato, un sulfato y un nitrato; y sales de ácidos orgánicos tales como un acetato y un metanosulfonato.

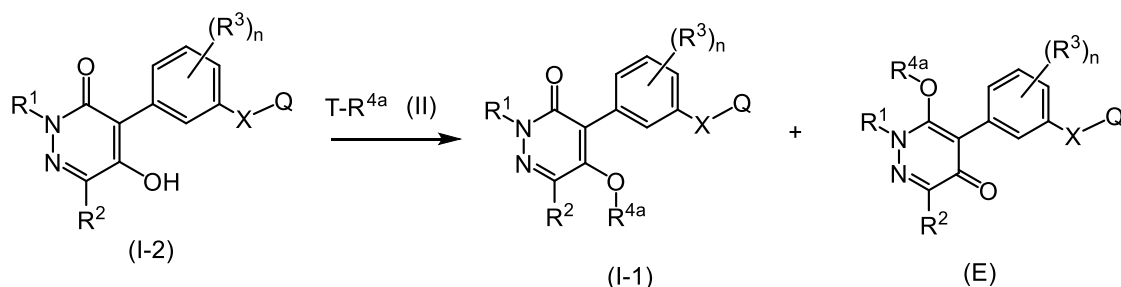
Los isómeros tales como los isómeros diastereo y los isómeros ópticos a veces

pueden estar presentes como los compuestos de piridazinona de la fórmula (I), y la presente invención incluye los respectivos isómeros y mezclas de isómeros. En la presente memoria descriptiva, los isómeros se describen como una mezcla a menos que se especifique lo contrario. Además, en la presente invención, diversos isómeros distintos de los isómeros mencionados anteriormente se incluyen dentro de un rango de conocimiento común en este campo técnico. Además, dependiendo del tipo de isómero, se puede presentar una estructura química diferente de la fórmula (I) anterior, pero para los expertos en la técnica, es suficientemente reconocible que dicha estructura química está en relación de un isómero a la fórmula (I) y dicho isómero evidentemente se encuentra dentro del alcance de la presente invención.

El compuesto de piridazinona de fórmula (I) o su sal (en adelante denominado como: el compuesto de la presente invención) se puede producir mediante el siguiente proceso de producción o de acuerdo con un método habitual para producir una sal o los Ejemplos de Preparación mencionados a continuación. Sin embargo, el método para obtener el compuesto de la presente invención no está limitado a esto.

[Proceso de producción 1]

Un compuesto de la fórmula (I-1) el cual es un compuesto de la presente invención se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (I-2) y un compuesto representado por la fórmula (II) en presencia de una base.



En las fórmulas, T es un átomo de cloro, bromo o yodo, R^{4a} es alquilo, -C(O)R⁶, -C(S)R⁶, -SR⁷, -SOR⁷, -SO₂R⁷, arilalquilo monocíclico que puede estar sustituido por Z, alcoxialquilo, -CH(J¹)OCOOJ², alquilcarbonilalquilo, arilo monocíclico que puede estar sustituido por Z, arilcarbonilalquilo monocíclico que puede ser sustituido por Z, alquenilo, alcoxialcoxialquilo, alcoxicarbonilalquilo, alquinilo, cianoalquilo, haloalcoxialquilo o dialquilaminoalquilo, y X, Q, R¹, R², R³, R⁶, R⁷, Z, J¹, J² y n son como se han definido anteriormente.

La base utilizada en esta reacción puede ser, por ejemplo, una base orgánica tal como trietilamina o piridina. La cantidad de la base es usualmente de 0,5 a 10 equivalentes molares, preferiblemente de 1 a 5 equivalentes molares del compuesto de

5 la fórmula (I-2).

Esta reacción se lleva a cabo usualmente en presencia de un disolvente. El disolvente no está particularmente limitado siempre que sea inerte a la reacción y puede ser, por ejemplo, un éter tal como dietil éter, dioxano, tetrahidrofurano (THF) o dimetoxietano o una mezcla de disolventes de estos.

10 La cantidad del compuesto de fórmula (II) usada en esta reacción es usualmente de 0,5 a 10 equivalentes molares, preferiblemente de 1 a 3 equivalentes molares al compuesto de fórmula (I-2).

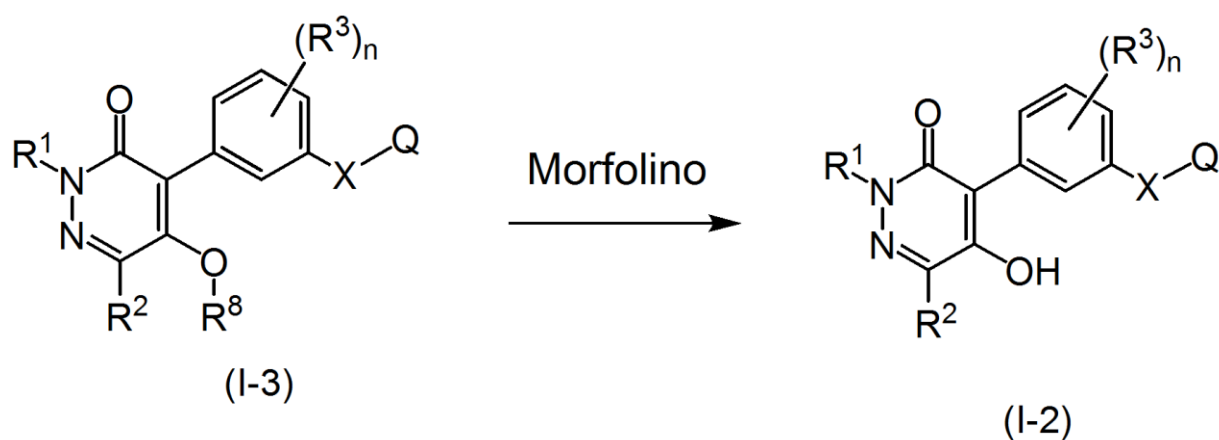
La temperatura de reacción de esta reacción es usualmente de -30 a 180°C, preferiblemente de -10 a 80°C. El tiempo de reacción de esta reacción es usualmente
15 de 10 minutos a 30 horas.

Mediante esta reacción, se forma una mezcla del compuesto de fórmula (I-1) y su isómero, es decir, un compuesto representado por la fórmula (E). La mezcla de reacción obtenida mediante esta reacción se mezcla, por ejemplo, con agua y se extrae con un disolvente orgánico, la capa orgánica obtenida se seca, se concentra, se
20 purifica mediante cromatografía en columna de gel de sílice, y similares, por medio de lo cual el compuesto de la fórmula (I-1) puede ser aislado.

El compuesto de fórmula (II) es un compuesto conocido o se puede producir mediante un método reconocido de un compuesto conocido.

[Proceso de producción 2]

25 El compuesto de fórmula (I-2) que es un compuesto de la presente invención se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (I-3) y morfolino.



En las fórmulas, R⁸ es alquilo o arilalquilo monocíclico que puede estar sustituido
30 por Z, tal como alquilo C₁₋₃ o bencilo, y X, Q, R¹, R², R³, Z y n son como se definieron anteriormente.

La cantidad de morfolina utilizada en esta reacción es usualmente de 1 a 20 equivalentes molares respecto al compuesto de fórmula (I-3).

La temperatura de reacción de esta reacción es usualmente de 30 a 180 °C, preferiblemente de 50 a 130 °C. El tiempo de reacción de esta reacción es usualmente de 10 minutos a 30 horas.

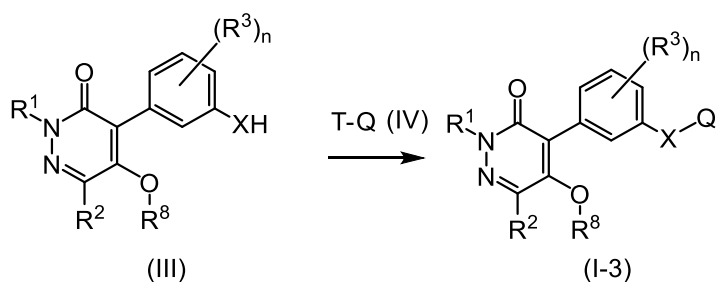
Además, esta reacción puede realizarse bajo irradiación con microondas, por lo que la reacción puede promoverse en algunos casos.

Después de completar esta reacción, por ejemplo, la mezcla de reacción se mezcla con agua, se acidifica con un ácido y se extrae con un disolvente orgánico y la capa orgánica obtenida se seca, se concentra, se purifica mediante cromatografía en columna de gel de sílice y similares, por lo que el compuesto de la fórmula (I-2) se puede aislar.

Además, el compuesto de fórmula (I-2) se puede producir, por ejemplo, de acuerdo con el método descrito en Heterocycles, vol. 26, páginas 1 a 4 (1987) o un método de acuerdo con esto.

[Proceso de producción 3]

El compuesto de la fórmula (I-3) el cual es un compuesto de la presente invención se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (III) y un compuesto representado por la fórmula (IV) en presencia de una base o un catalizador.



En las fórmulas, X, Q, R¹, R², R³, R⁸, T y n son como se definieron anteriormente.

La base utilizada en esta reacción puede ser, por ejemplo, un alcóxido metálico tal como terc-butóxido de potasio; o una base inorgánica tal como carbonato de potasio, carbonato de cesio o hidruro de sodio. La cantidad de la base es usualmente de 1 a 10 equivalentes molares, preferiblemente de 1 a 3 equivalentes molares al compuesto de la fórmula (III).

El catalizador utilizado en esta reacción puede ser, por ejemplo, un catalizador de paladio tal como acetato de paladio (II), tetrakis (trifenilfosfina) paladio, tris

5 (dibencilidenacetona) dipaladio o dicloruro de [1,1'-bis (difenilfosfino) ferroceno] paladio; o un catalizador de cobre tal como cloruro de cobre o yoduro de cobre. La cantidad de catalizador es por lo general de 0,001 a 0,5 equivalentes molares, preferiblemente de 0,01 a 0,2 equivalentes molares al compuesto de fórmula (IV).

10 Esta reacción se lleva a cabo usualmente en presencia de un disolvente. El disolvente no está particularmente limitado siempre que sea inerte a la reacción y puede ser, por ejemplo, un hidrocarburo aromático tal como el benceno, tolueno o xileno; un éter tal como el dietil éter, dioxano, THF o dimetoxietano; una amida tal como la dimetilformamida (DMF); un sulfóxido tal como dimetilsulfóxido (DMSO); un nitrilo tal como el acetonitrilo; una cetona tal como la acetona; o una mezcla de disolventes de
15 estos.

La cantidad del compuesto de fórmula (IV) utilizada en esta reacción usualmente es de 0,5 a 3 equivalentes molares, preferiblemente de 1 a 2 equivalentes molares al compuesto de fórmula (III).

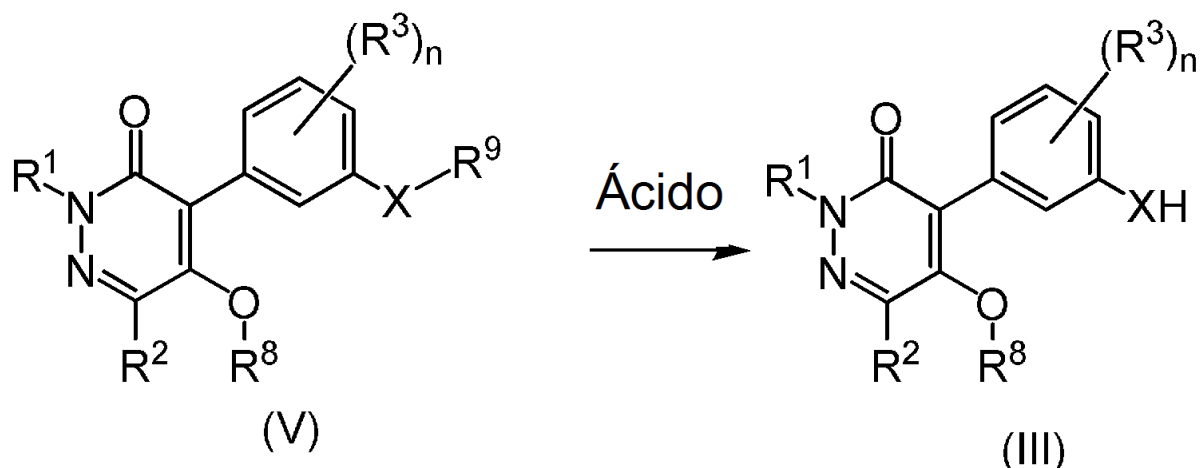
20 La temperatura de reacción de esta reacción es usualmente de 0 a 200 °C, preferiblemente de 20 a 100 °C. El tiempo de reacción de esta reacción es usualmente de 10 minutos a 30 horas.

Después de completar esta reacción, por ejemplo, la mezcla de reacción se neutraliza con un ácido, se mezcla con agua y se extrae con un disolvente orgánico, y la capa orgánica obtenida se seca, se concentra, se purifica mediante cromatografía en
25 columna de gel de sílice y similares, por lo que el compuesto de la fórmula (I-3) se puede aislar.

El compuesto de fórmula (IV) es un compuesto conocido o se puede producir mediante un método reconocido de un compuesto conocido.

[Proceso de producción 4]

30 El compuesto de la formula (III) mencionada se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (V) y un ácido.



5

En las fórmulas, R^9 es un arilalquilo monocíclico que puede ser sustituido por Z, tal como el bencilo o 4-metoxibencilo, y X, R^1 , R^2 , R^3 , R^8 , Z y n son como se definieron anteriormente.

El ácido usado en esta reacción puede ser, por ejemplo, ácido trifluoroacético.

10 La cantidad de ácido es usualmente de 1 a 20 equivalentes molares al compuesto de fórmula (V).

Esta reacción se lleva a cabo en presencia de un disolvente según lo requiera el caso. El disolvente no está particularmente limitado siempre que sea inerte a la reacción y puede ser, por ejemplo, un ácido orgánico tal como ácido acético o ácido propiónico, agua o una mezcla de disolventes de los mismos.

15

La temperatura de reacción de esta reacción es usualmente de 30 a 180 °C, preferiblemente de 50 a 130 °C. El tiempo de reacción de esta reacción es usualmente de 10 minutos a 30 horas.

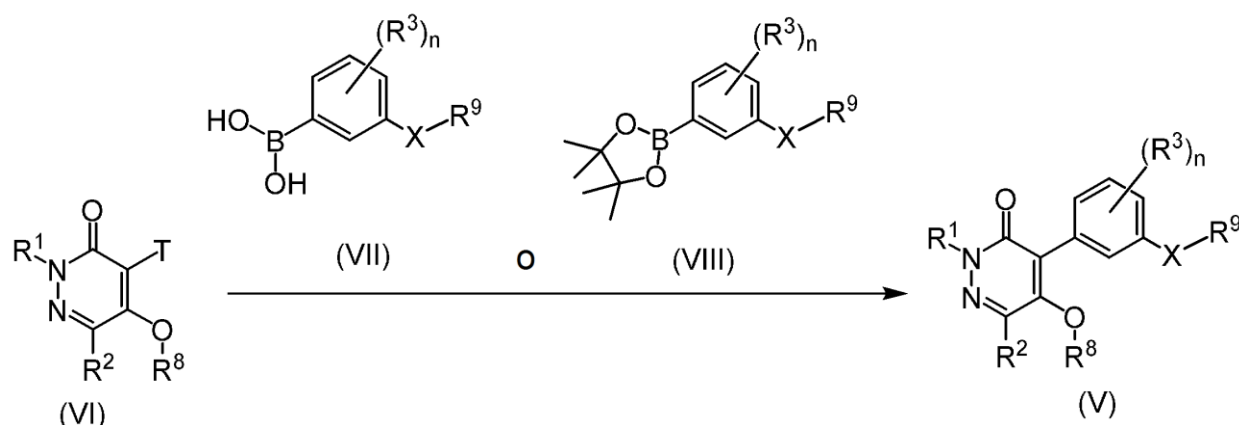
Después de completar esta reacción, por ejemplo, la mezcla de reacción se mezcla con agua y se extrae con un disolvente orgánico, y la capa orgánica obtenida se seca, se concentra, se purifica mediante cromatografía en columna de gel de sílice y similares, por lo que el compuesto de la fórmula (III) puede ser aislado.

20

[Proceso de producción 5]

El compuesto de fórmula (V) puede producirse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (VI) y un compuesto representado por la fórmula (VII) o (VIII) en presencia de una base y un catalizador.

25



En las fórmulas, X, R¹, R², R³, R⁸, R⁹, T y n son como se definieron anteriormente.

La base utilizada en esta reacción puede ser, por ejemplo, una base inorgánica tal como el carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio, carbonato de cesio o fosfato de potasio. La cantidad de la base es usualmente de 1 a 10 equivalentes molares, preferiblemente de 1 a 5 equivalentes molares al compuesto de la fórmula (VI).

El catalizador utilizado en esta reacción puede ser, por ejemplo, un catalizador de paladio tal como el acetato de paladio (II), tetrakis (trifenilfosfina) paladio, tris (dibencilidenacetona) dipaladio o dicloruro de [1,1'-bis (difenilfosfino) ferroceno] paladio. La cantidad de catalizador es por lo general de 0,001 a 0,5 equivalentes molares, preferiblemente de 0,01 a 0,2 equivalentes molares al compuesto de fórmula (VI). Además, como catalizador, se puede utilizar un catalizador de transferencia de fase. El catalizador de transferencia de fase usado en esta reacción puede ser, por ejemplo, una sal de alquilamonio cuaternaria tal como bromuro de tetrabutilamonio o cloruro de tetrabutilamonio. La cantidad del catalizador de transferencia de fase usualmente es de 0,001 a 1,0 equivalente molar, preferiblemente de 0,01 a 0,7 equivalente molar al compuesto de fórmula (VI).

Esta reacción se lleva a cabo usualmente en presencia de un disolvente. El disolvente no está particularmente limitado siempre que sea inerte a la reacción y puede ser, por ejemplo, un hidrocarburo aromático tal como el benceno o tolueno; un alcohol tal como el metanol, etanol o propanol; un éter tal como dietiléter, dioxano, THF o dimetoxietano; una cetona tal como la acetona o metil etil cetona; una amida tal como DMF; un sulfóxido tal como DMSO; agua; o una mezcla de disolventes de los estos.

En esta reacción, según lo requiera el caso, se puede utilizar un ligando. El ligando puede ser, por ejemplo, 2-diciclohexilfosfino-2',6'-dimetoxibifenilo. La cantidad del ligando usualmente es de 0,002 a 1 equivalente molar, preferiblemente de 0,02 a

5 0,4 equivalente molar al compuesto de la fórmula (VI).

La cantidad del compuesto de fórmula (VII) o (VIII) utilizada en esta reacción usualmente es de 0,5 a 2 equivalentes molares, preferiblemente de 1 a 1,5 equivalentes molares al compuesto de fórmula (VI).

La temperatura de reacción de esta reacción es usualmente de 0 a 180 °C, preferiblemente de 30 a 150 °C. El tiempo de reacción de esta reacción es usualmente de 10 minutos a 100 horas.

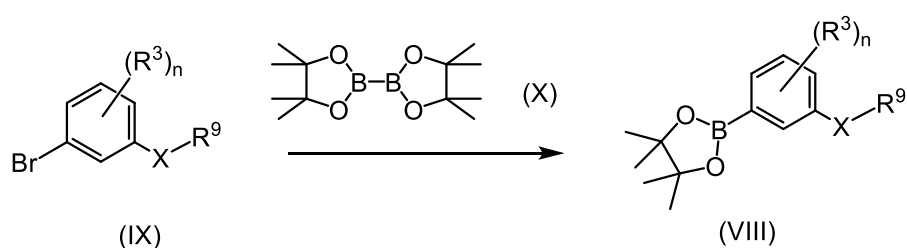
Después de completar esta reacción, por ejemplo, la mezcla de reacción se mezcla con agua y se extrae con un disolvente orgánico, y la capa orgánica obtenida se seca, se concentra, se purifica mediante cromatografía en columna de gel de sílice y similares, por lo que el compuesto de la fórmula (V) puede ser aislado.

El compuesto de fórmula (VII) es un compuesto conocido o se puede producir mediante un método reconocido de un compuesto conocido.

El compuesto de fórmula (VI) es un compuesto conocido o se puede producir mediante un método reconocido de un compuesto conocido. Por ejemplo, el compuesto de fórmula (VI) se puede producir de acuerdo con el método descrito en el Journal of Heterocyclic Chemistry, vol. 33, páginas 1579 a 1582 (1996) o un método de acuerdo con esto.

[Proceso de producción 6]

El compuesto de fórmula (VIII) puede producirse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (IX) y un compuesto representado por la fórmula (X) en presencia de una base y un catalizador.



En las fórmulas, X, R³, R⁹ y n son como se definieron anteriormente.

La base utilizada en esta reacción puede ser, por ejemplo, una base inorgánica tal como el carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio, carbonato de cesio, fosfato de potasio o acetato de potasio. La cantidad de la base usualmente es de 1 a 10 equivalentes molares, preferiblemente de 1 a 5 equivalentes molares al compuesto de la fórmula (IX).

El catalizador utilizado en esta reacción puede ser, por ejemplo, un catalizador de paladio tal como el acetato de paladio (II), tetrakis (trifenilfosfina) paladio, o

5 tris(dibencilidenacetona) dipaladio. La cantidad de catalizador es por lo general de 0,001 a 0,5 equivalentes molares, preferiblemente de 0,01 a 0,2 equivalentes molares al compuesto de fórmula (IX).

Esta reacción se lleva a cabo usualmente en presencia de un disolvente. El disolvente no está particularmente limitado siempre que sea inerte a la reacción y
 10 puede ser, por ejemplo, un hidrocarburo aromático tal como el benceno o tolueno; un alcohol tal como el metanol, etanol o propanol; un éter tal como dietiléter, dioxano, THF o dimetoxietano; una cetona tal como la acetona o metil etil cetona; una amida tal como DMF; un sulfóxido tal como DMSO; agua; o una mezcla de disolventes de los estos.

En esta reacción, según lo requiera el caso, se puede utilizar un ligando. El
 15 ligando puede ser, por ejemplo, triciclohexilfosfina o 2-diciclohexilfosfino-2',6'-dimetoxibifenilo. La cantidad del ligando usualmente es de 0,002 a 1 equivalente molar, preferiblemente de 0,02 a 0,4 equivalente molar al compuesto de la fórmula (IX).

La cantidad del compuesto de fórmula (X) utilizada en esta reacción usualmente es de 0,5 a 2 equivalentes molares, preferiblemente de 1 a 1,5 equivalentes molares al
 20 compuesto de fórmula (IX).

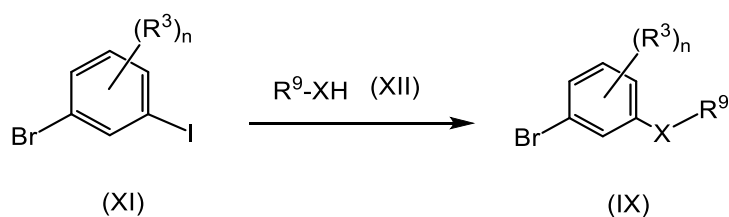
La temperatura de reacción de esta reacción es usualmente de 0 a 180 °C, preferiblemente de 30 a 150 °C. El tiempo de reacción de esta reacción es usualmente de 10 minutos a 100 horas.

Además, esta reacción puede realizarse bajo irradiación con microondas, por lo
 25 que la reacción puede promoverse en algunos casos.

Después de completar esta reacción, por ejemplo, la mezcla de reacción se mezcla con agua y se extrae con un disolvente orgánico, y la capa orgánica obtenida se seca, se concentra, se purifica mediante cromatografía en columna de gel de sílice y similares, por lo que el compuesto de la fórmula (VIII) puede ser aislado.

30 [Proceso de producción 7]

El compuesto de fórmula (IX) puede producirse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (XI) y un compuesto representado por la fórmula (XII) en presencia de una base y un catalizador.



En las fórmulas, X, R³, R⁹ y n son como se definieron anteriormente.

35 La base utilizada en esta reacción puede ser, por ejemplo, una base inorgánica

5 tal como el carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio, carbonato de cesio o fosfato de potasio; o una base orgánica tal como la trietilamina o diisopropiletilamina. La cantidad de la base usualmente es de 1 a 10 equivalentes molares, preferiblemente de 1 a 5 equivalentes molares al compuesto de la fórmula (XI).

10 El catalizador utilizado en esta reacción puede ser, por ejemplo, un catalizador de paladio tal como el acetato de paladio (II), tetrakis (trifenilfosfina) paladio o tris(dibencilidenacetona) dipaladio. La cantidad de catalizador es por lo general de 0,001 a 0,5 equivalentes molares, preferiblemente de 0,01 a 0,2 equivalentes molares al compuesto de fórmula (XI).

15 Esta reacción se lleva a cabo usualmente en presencia de un disolvente. El disolvente no está particularmente limitado siempre que sea inerte a la reacción y puede ser, por ejemplo, un hidrocarburo aromático tal como el benceno o tolueno; un alcohol tal como el metanol, etanol o propanol; un éter tal como dietiléter, dioxano, THF o dimetoxietano; una cetona tal como la acetona o metil etil cetona; una amida tal como
20 DMF; un sulfóxido tal como DMSO; agua; o una mezcla de disolventes de los estos.

En esta reacción, según lo requiera el caso, se puede utilizar un ligando. El ligando puede ser, por ejemplo, triciclohexilfosfina, 2-diciclohexilfosfino-2', 6'-dimetoxibifenilo o 4,5-bis(difenilfosfino)-9,9-dimetilxanteno. La cantidad del ligando usualmente es de 0,002 a 1 equivalente molar, preferiblemente de 0,02 a 0,4
25 equivalente molar al compuesto de la fórmula (XI).

La cantidad del compuesto de fórmula (XII) utilizada en esta reacción usualmente es de 0,5 a 2 equivalentes molares, preferiblemente de 1 a 1,5 equivalentes molares al compuesto de fórmula (XI).

La temperatura de reacción de esta reacción es usualmente de 0 a 180 °C, preferiblemente de 30 a 150 °C. El tiempo de reacción de esta reacción es usualmente
30 de 10 minutos a 100 horas.

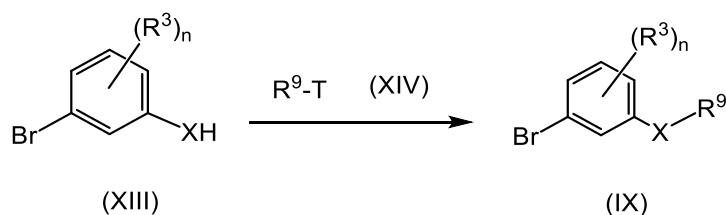
Después de completar esta reacción, por ejemplo, la mezcla de reacción se mezcla con agua y se extrae con un disolvente orgánico, y la capa orgánica obtenida se seca, se concentra, se purifica mediante cromatografía en columna de gel de sílice y
35 similares, por lo que el compuesto de la fórmula (X) puede ser aislado.

El compuesto de fórmula (XI) es un compuesto conocido o se puede producir mediante un método reconocido de un compuesto conocido.

El compuesto de la fórmula (XII) es un compuesto conocido.

[Proceso de producción 8]

5 El compuesto de fórmula (IX) puede producirse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (XIII) y un compuesto representado por la fórmula (XIV) en presencia de una base.



En las fórmulas, X, R³, R⁹, T y n son como se definieron anteriormente.

10 La base utilizada en esta reacción puede ser, por ejemplo, un alcóxido metálico tal como terc-butóxido de potasio; o una base inorgánica tal como carbonato de potasio, carbonato de cesio o hidruro de sodio. La cantidad de la base usualmente es de 1 a 10 equivalentes molares, preferiblemente de 1 a 3 equivalentes molares al compuesto de la fórmula (XIII).

15 Esta reacción se lleva a cabo usualmente en presencia de un disolvente. El disolvente no está particularmente limitado siempre que sea inerte a la reacción y puede ser, por ejemplo, un hidrocarburo aromático tal como el benceno, tolueno o xileno; un éter tal como el dietil éter, dioxano, THF o dimetoxietano; una amida tal como la DMF; un sulfóxido tal como DMSO; un nitrilo tal como el acetonitrilo; una cetona tal como la acetona; o una mezcla de disolventes de estos.

20 La cantidad del compuesto de fórmula (XIV) utilizada en esta reacción usualmente es de 0,5 a 3 equivalentes molares, preferiblemente de 1 a 2 equivalentes molares al compuesto de fórmula (XIII).

25 La temperatura de reacción de esta reacción es usualmente de 0 a 200 °C, preferiblemente de 20 a 100 °C. El tiempo de reacción de esta reacción es usualmente de 10 minutos a 30 horas.

30 Después de completar esta reacción, por ejemplo, la mezcla de reacción se neutraliza con un ácido, se mezcla con agua y se extrae con un disolvente orgánico, y la capa orgánica obtenida se seca, se concentra, se purifica mediante cromatografía en columna de gel de sílice y similares, por lo que el compuesto de la fórmula (IX) se puede aislar.

El compuesto de fórmula (XIII) es un compuesto conocido o se puede producir mediante un método reconocido de un compuesto conocido.

35 El proceso de producción de los intermedios que se utilizarán en la producción de compuestos de la presente invención no están limitados a los procesos de producción anteriormente ejemplificados; se puede emplear cualquier proceso de

5 producción. Además, la materia prima diversa tampoco está limitada a los compuestos ejemplificados anteriormente, y se puede utilizar cualquier compuesto siempre que sean compuestos capaces de producir los compuestos de la presente invención.

Los compuestos de la presente invención pueden controlar una amplia gama de malezas indeseadas tales como las malezas anuales y las malezas perennes,
 10 específicamente diferentes malezas nocivas, por ejemplo, gramíneas tales como: pasto dentado (*Echinochloa crus-galli* L., *Echinochloa oryzicola* Vasing.) pasto cangrejo (*Digitaria sanguinalis* L., *Digitaria ischaemum* Muhl., *Digitaria adscendens* Henr., *Digitaria microbachne* Henr., *Digitaria horizontalis* Willd.), almorejo (*Setaria viridis* L.), cola de zorro gigante (*Setaria faberi* Herrm), cola de zorro (o gusanillo) *Setaria*
 15 *lutescens* Hubb, pata de ganso (*Eleusine indica* L.), avena fatua (*Avena fatua* L.) sorgo de Alepo (*Sorghum halepense* L.), grama de europa (*Agropyron repens* L.), pasto braquipará (*Brachiaria plantaginea*), pasto guinea (*Panicum maximum*), pasto para (*Panicum purpurascens*), gramalote de agua (*Panicum dichotomiflorum*), “sprangletop” (*Leptochloa chinensis*), “sprangletop” rojo (*Leptochloa panicea*), pasto azul anual (*Poa*
 20 *annua* L.), alopecuro de los campos (*Alopecurus myosuroides* Huds., *Alopecurus aequalis* Sobol.), “cholorado bluestem” (*Agropyron tsukushiense* (Honda) Ohwi), Gambutera (*Brachiaria platyphylla* Nash), zacate cadillo (*Cenchrus echinatus* L), raigrás italiano (*Lolium multiflorum* Lam.), raigrás rígido (*Lolium rigidum* Gaud.), bromo veloso (*Bromus tectorum* L.) y pasto Argentina (*Cynodon dactylon* Pers); las Cyperaceae tales
 25 como: el “rice flatsedge” (*Cyperus iria* L.), cortadera (*Cyperus rotundus* L.), conquito (*Cyperus esculentus* L.), “bulsush” japonés (*Scirpus juncoides*), “flatsedge” (*Cyperus serotinus*), juncia de agua (*Cyperus difformis*) junco de espiga (*Eleocharis acicularis*) y “water chesnut” (*Eleocharis kuroquwai*); las alismatáceas tales como: “ribbon waparo” japonés (*Sagittaria pygmaea*), “arrow-head” (*Sagittaria trifolia*), y plátano de agua
 30 canalizado (*Alisma canaliculatum*); las pontederiáceas tales como: monocoria (*Monochoria vaginalis*), y la especie de monocoria (*Monochoria korsakowii*); las linderniaseas tales como: pimpinela falsa (*Lindernia pyxidaria*); las plantagináceas tales como: “abunome” (*Dopatrium junceum*); las Lythraceae tal como: “toothcup” (*Rotala indica*) y tallo rojo (*Ammannia multiflora*); elatinacea tal como: “long stem waterwort”
 35 (*Elatine triandra* Schkuhr); las malváceas, tal como: hoja terciopelo (*Abutilon theophrasti* MEDIC) y popotalagua o quesillo (*Sida spinosa* L.); las asteráceas, tal como: bardana común (*Xanthium strumarium* L.), altamisa (*Ambrosia elatior* L.), “thistle” (*Breia setosa* (BIEB.) KITAM.), colminillo blanco (*Galinsoga ciliata* Blake), manzanilla de castilla (*Matricaria chamomilla* L.), ortiga mansa (*Lamium amplexicaule* L.), diente

5 de león (*Taraxacum officinale weber*), erigero del Canadá (*Erigeron canadensis L.*); la solanáceas, tal como: hierba mora (*Solanum nigrum L.*) y estramonio (*Datura stramonium*); Amaranthaceae, tal como: amaranto verde (*Amaranthus viridis L.*), abrebujó (*Amaranthus retroflexus L.*), cenizo (*Chenopodium album L.*), albahaca larga (*Kochia scoparia Schrad*); Polygonaceae, tal como: "pale smartweed" (*Polygonum lapathifolium L.*), persicaria manchada (*Polygonum persicaria L.*), polígono trepador (*Polygonum convolvulus L.*) y ciennudos (*Polygonum aviculare L.*); las crucíferas, tales como: "bittercress" (*Cardamine flexuosa WITH.*), bolsa de pastor (*Capsella bursapastoris Medik*), mostaza de la India (*Brassica juncea Czern*); Convolvulaceae, tales como: gloria de la mañana (*Ipomoea purpurea L.*), correhuela (*Commelina communis L.*) y gloria de la mañana de hoja de hiedra (*Ipomoea hederacea Jacq.*); 10 Portulacaceae, tal como la verdolaga (*Portulaca oleracea L.*); fabácea, tal como la bichomacho (*Cassia obtusifolia L.*); Caryophyllaceae, tal como la hierba pajarera (*Stellaria media L.*); rubiácea, tal como la "catchweed" (*Galium spurium L.*); Euphorbiaceae, tal como la "threeseeded copperleaf" (*Acalypha australis L.*); 15 Comelinácea tal como la babosilla (*Commelina communis L.*). Por lo tanto el compuesto de la presente invención se puede utilizar efectivamente para controlar de manera selectiva o no selectiva las malezas nocivas en el cultivo de cultivos útiles tales como: maíz (*Zea mays L.*), soja (*Glycine max Merr.*), algodón (*Gossypium spp.*), trigo (*Triticum aestivum L.*), arroz (*Oryza sativa L.*), cebada (*Hordeum vulgare L.*), 20 centeno (*Secale cereale L.*), avena (*Avena sativa L.*), sorgo (*Sorghum bicolor Moench*), colza (*Brassica napus L.*), girasol (*Helianthus annuus L.*), remolacha azucarera (*Beta vulgaris L.*), caña de azúcar (*Saccharum officinarum L.*), césped japonés (*Zoysia japonica stend*), maní (*Arachis hypogaea L.*), lino (*Linum usitatissimum L.*), tabaco (*Nicotiana tabacum L.*) y café (*Coffea spp.*).

30 El compuesto de la presente invención se puede mezclar de varios aditivos agrícolas y aplicar en forma de varias formulaciones tales como polvos, gránulos, gránulos dispersables en agua, polvos humectables, comprimidos, capsulas (incluyendo una formulación empacada medianet una lámina soluble en agua), suspensiones a base de agua, suspensiones a base de aceite, micro emulsiones, 35 suspoemulsiones, polvos solubles en agua, concentrados emulsionables, concentrados o pastas solubles. Puede formarse en cualquier formulación que se utilice comúnmente en este campo, siempre que se cumpla con el objeto de la presente invención.

Los aditivos que se utilizarán para la formulación incluyen, por ejemplo, un

5 portador sólido tal como tierra de diatomeas, cal muerta, carbonato de calcio, talco, carbono blanco, caolín, bentonita, caolinita, sericita, arcilla, carbonato de sodio, bicarbonato de sodio, mirabilita, zeolita o almidón; un disolvente tal como agua, tolueno, xileno, disolvente nafta, dioxano, acetona, isoforona, metil isobutil cetona, clorobenceno, ciclohexano, dimetilsulfóxido, N, N-dimetilformamida, dimetilacetamida,

10 N-metil-2-pirrolidona o un alcohol; un tensioactivo aniónico o un esparcidor tal como una sal de ácido graso, un benzoato, un alquilsulfosuccinato, un dialquilsulfosuccinato, un policarboxilato, una sal de éster de ácido alquilsulfúrico, un sulfato de alquilo, un sulfato de alquilarilo, un sulfato de éter de alquil diglicol, una sal del **sal de éster de ácido sulfúrico anhidro**, alquilsulfanato, un sulfonato de alquilarilo, un sulfonato de

15 arilo, un sulfanato de lignina, un disulfonato de alquildifenil éter, un sulfonato de poliestireno, una sal de éster de ácido alquilsulfúrico, un fosfato de alquilarilo, un fosfato de estirilarilo, una sal de éster de ácido sulfúrico de éter *alquil polioxietileno*, un polioxietilenalquil aril éter sulfato, una sal de ácido sulfúrico de ésterpolioxietilenalquilaril éter, un polioxietilen alquil éter fosfato, una sal de éster de

20 ácido fosfórico de polioxietilen alquilaril, una sal de ester de ácido fosfórico polioxietilenaril éter, un naftaleno sulfonato condensado con formaldehído o un alquilnaftaleno sulfonato condensado con formaldehído; un tensioactivo no iónico o un esparcidor tal como un éster de ácido graso de sorbitano, un éster de ácido graso de glicerina, un poliglicérido de ácido graso, un alcohol de ácido graso poliglicol éter,

25 acetilenglicol, alcohol de acetileno, un polímero de bloque de oxialquilen, un éter alquil de polioxietileno, un éter alquilaril de polioxietileno, un éter alquilaril de polioxietileno, un éter estitilaril de polioxietileno, un éter glicolalquil de polioxietileno, polietilen glicol, un éster de ácido graso de polioxietileno, un éster de ácido graso polioxietileno sorbitán, un éster de ácido graso de polioxietilen glicerina, un aceite de ricinode

30 polioxietileno hidrogenado o un éster de ácido graso de polioxipropileno; y un aceite vegetal o mineral como aceite de oliva, aceite de cabra, aceite de ricino, aceite de palma, aceite de camelia, aceite de coco, aceite de sésamo, aceite de maíz, aceite de salvado de arroz, aceite de cacahuete, aceite de semilla de algodón, aceite de soja, aceite de colza, aceite de linaza, aceite de tung o parafinas líquidas. Estos aditivos se

35 pueden seleccionar de forma adecuada para uso solo o en combinación como una mezcla de dos o más de ellos, siempre que se cumpla el objeto de la presente invención. Además, se pueden usar varios aditivos usados comúnmente, tales como una recarga, un espesante, un agente anti sedimentación, un agente anti congelante, un estabilizador de dispersión, un protector, un agente anti moho, un agente de

5 burbujas, un desintegrador y un aglutinante. La relación de mezcla en peso del compuesto de la presente invención con dichos diversos aditivos puede ser de 0,1: 99,9 a 95: 5, preferiblemente de 0,2: 99,8 a 85:15 en proporción en peso. El método para mezclar el compuesto de la presente invención y diversos aditivos no está particularmente limitado, y se pueden mezclar adecuadamente de acuerdo con un
10 método reconocido.

La dosis del herbicida que contiene el compuesto de la presente invención (una cantidad herbicidamente eficaz del compuesto de la presente invención) generalmente no se puede definir, ya que varía dependiendo de las condiciones climáticas, las condiciones del suelo, el tipo de formulación, el tipo de las plantas indeseadas a
15 controlar, la temporada de aplicación, etc. Sin embargo, normalmente se aplica en una cantidad del compuesto de la presente invención (en lo sucesivo denominada también cantidad de principio activo) preferiblemente de 0,1 a 5,000 g, más preferiblemente de 0,5 a 3.000 g, más preferiblemente de 1 a 1.000 g, particularmente preferiblemente de 10 a 500 g por hectárea. La presente invención incluye tal método para controlar
20 plantas indeseadas mediante dichas aplicaciones del herbicida.

Además, el herbicida que contiene el compuesto de la presente invención se puede utilizar solo o como una mezcla o en combinación de otros químicos agrícolas, fertilizantes o similares. Cuando el herbicida se usa como una mezcla o en combinación, se pueden obtener efectos o funciones más excelentes en algunos
25 casos. Tales otros productos químicos agrícolas incluyen, por ejemplo, un herbicida, un fungicida, un antibiótico, una hormona vegetal y un insecticida. Especialmente, con una composición herbicida mixta que tiene un compuesto de la presente invención, mezclado con o utilizado en combinación con uno o más compuestos activos de otros herbicidas, el rango de malezas a controlar, el tiempo de aplicación de la composición, las actividades herbicidas, etc. se pueden mejorar en direcciones preferidas. El
30 compuesto de la presente invención y los compuestos activos de otros herbicidas se pueden formular por separado de manera que puedan mezclarse para utilizar al momento de la aplicación, o se puedan formular juntos. La presente invención incluye dicha composición herbicida mixta.

35 La relación de mezcla del compuesto de la presente invención con los compuestos activos de otros herbicidas generalmente no se puede definir, ya que varía dependiendo de las condiciones climáticas, las condiciones del suelo, los tipos de formulaciones, el tiempo de aplicación, el método de aplicación, etc., pero, los otros herbicidas se mezclan en una cantidad preferiblemente de 0,001 a 10,000 partes en

5 peso, más preferiblemente de 0,01 a 1,000 partes en peso por un tipo del compuesto activo, basado en 1 parte en peso del compuesto de la presente invención. Además, la dosis para la aplicación es tal que la cantidad total de los compuestos activos es de 0,1 a 10,000 g, preferiblemente de 0,2 a 5,000 g, más preferiblemente de 10 a 3,000 g, por hectárea. La presente invención incluye un método para controlar malezas indeseadas
10 mediante la aplicación de dicha composición herbicida mixta.

Otro compuesto herbicidamente activo incluye, por ejemplo, los siguientes compuestos (1) a (12) (nombres comunes que incluyen los que están bajo la solicitud de aprobación de ISO). Incluso cuando aquí no se menciona de manera específica, en un caso en el que tales compuestos tienen sales, ésteres alquílicos, etc., están, por
15 supuesto, todos incluidos.

(1) Aquellos que se cree que exhiben efectos herbicidas al alterar las actividades hormonales de las plantas, por ejemplo un compuesto fenoxi, tal como: 2,4-D, 2,4-D-butotilo, 2,4-D-butilo, 2,4-D-dimetilamonio, 2,4-D-diolamina, 2,4-D-etilo, 2,4-D-2-etilhexilo, 2,4-D-isobutilo, 2,4-D-isocilo, 2,4-D-isopropilo, 2,4-D-isopropilamonio, 2,4-D-sodio, 2,4-D-isopropanolamonio, 2,4-D-trolamina, 2,4-DB, 2,4-DB-butilo, 2,4-DB-dimetilamonio, 2,4-DB-isocilo, 2,4-DB-potasio, 2,4-DB-sodio, 2,4-D sal de colina, diclorprop, diclorprop-butotilo, diclorprop-dimetilamonio, diclorprop-isocilo, diclorprop-potasio, diclorprop-P, diclorprop-P-dimetilamonio, diclorprop-P-potasio, diclorprop-P-sodio, MCPA, MCPA-butotilo, MCPA-dimetilamonio, MCPA-2-etilhexilo, MCPA-potasio, 20 MCPA-sodio, MCPA-tioetilo, MCPB, MCPB-etilo, MCPB-sodio, mecoprop, mecoprop-butotilo, mecoprop-sodio, mecoprop-P, mecoprop-P-butotilo, mecoprop-P-dimetilamonio, mecoprop-P-2-etilhexilo, mecoprop-P-potasio, naproanilida, clomeprop, o HIA-1; un compuesto de ácido carboxílico aromático, tal como el 2,3,6-TBA, dicamba, dicamba-butotilo, dicamba-diglicolamina, dicamba-dimetilamonio, dicamba-diolamina, dicamba-isopropilamonio, dicamba-potasio, dicamba-sodio, picloram, picloram-dimetilamonio, picloram-isocilo, picloram-potasio, picloram-triisopropanolamonio, picloram-triisopropilamonio, picloram-trolamina, triclopir, triclopir-butotilo, triclopir-trietilamonio, clopiralid, clopiralid-olamina, clopiralid-potasio, clopiralid-triisopropanolamonio, aminopirialid, aminociclopiraclor, halauxifen, halauxifen-metilo o 35 DAS-534; y naptalam, naptalam-sodio, benazolina, benazolin-etilo, quinclorac, quinmerac, diflufenzopir, diflufenzopir-sodio, fluroxipir, fluroxipir-2-butoxi-1-metiletilo, fluroxipir-meptilo, clorflurenol, clorflurenol-metilo o clacifos.

(2) Aquellos que se cree que exhiben efectos herbicidas al inhibir la fotosíntesis de plantas, por ejemplo un compuesto de urea, tal como clorotolurón, diurón,

5 fluometurón, linurón, isoproturón, metobenzurón, tebutiurón, dimefurón, isourón, karbutilato, metabenzotiazurón, metoxurón, metoburomurón, monolinuron, neburon, siduron, terbumeton o trietazine; un compuesto de triazina tal como simazina, atrazina, atratona, simetrina, prometrina, dimetametrina, hexazinona, metribuzina, terbutilazina, cianazina, ametrina, cybutrina, terbutrina, propacina, metamitrón o prometón; un
 10 compuesto de uracilo tal como bromacil, bromacil-litio, lenacil o terbacilo; un compuesto de anilida tal como propanilo o cipromido; un compuesto de carbamato tal como swep, desmedifam o fenmedifam; un compuesto de hidroxibenzonitrilo tal como bromoxinilo, octanoato de bromoxinilo, heptanoato de bromoxinilo, ioxinilo, octanoato de oxinilo, ioxinil-potasio o ioxinil-sodio; y piridate, bentazone, bentazone-sodio, amicarbazone,
 15 metazole, pentanochlor o fenmedifam.

(3) Compuesto de sal de amonio cuaternario, tal como paraquat o diquat, que se cree que se convierte en radicales libres por sí mismo para formar oxígeno activo en el cuerpo de la planta y muestra una rápida eficacia herbicida.

(4) Aquellos que se cree que exhiben efectos herbicidas al inhibir la biosíntesis
 20 de clorofila de las plantas y acumular anormalmente una sustancia de peróxido fotosensibilizante en el cuerpo de la planta, tal como un compuesto difenil éter tal como nitrofenol, clorometoxifeno, bifeno, acifluorfen, acifluorfen-sodio, fomesafen, fomesafen-sodio, oxifluorfenol, lactofeno, aclonifeno, etoxifenilo, fluoroglicofen-etilo o fluoroglicofeno; un compuesto imida cíclico tal como clorftalim, flumioxazina,
 25 flumiclorac, flumiclorac-pentilo, cinidon-etilo, flutiacet-metilo o EK-5385; y oxadiargilo, oxadiazon, sulfentrazone, carfentrazone-etilo, tidiazimina, pentoxazone, azafenidina, isopropazole, piraflufen-etilo, benzfendizona, butafenacil, saflufenacil, fluazolate, profluazol, flufenpir-etilo, bencarbazone, tiafenacil, piraclonil, trifludimoxazin, HNPC-B4047, IR -6396, EK-5439, EK-5498, SYN-523, o un compuesto descrito en el
 30 documento WO2008/008763 (FMC CORPORATION).

(5) Aquellos que se cree que exhiben efectos herbicidas caracterizados por actividades de blanqueamiento inhibiendo la cromogénesis de plantas, por ejemplo, carotenoides, por ejemplo, un compuesto de piridazinona, por ejemplo, norflurazona, cloridazona o metflurazona; un compuesto de pirazol, por ejemplo, pirazolinato,
 35 pirazoxifeno, benzofenap, topamezona, piro-sulfotol o tolopralato; y amitrole, fluridone, flurtamone, diflufenican, metoxifenona, clomazone, sulcotrione, mesotrione, tembotrione, tefuryltrione, fenquintone, ciclopirimorato, isoxaflutol, difenzoquat, difenzoquat-metilsulfato, isoxachlortole, benzobiciclon, biciclopiron, picolinafen, beflubutamid, ketospiradox, ketospiradox-potasio, o un compuesto divulgado en

5 JP2012 - 2571 (Sumitomo Chemical).

(6) Aquellos que se cree que exhiben efectos herbicidas al inhibir la biosíntesis de lípidos de las plantas, como un compuesto de ácido ariloxifenoxipropiónico como el diclofop-metilo, diclofop, pirifenop-sodio, fluazifop-butilo, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-P -butilo, haloxifop-metilo, haloxifop, haloxifop-etotilo, haloxifop-P, haloxifop-P-metilo, 10 quizalofop-etilo, quizalofop-P, quizalofop-P-etilo, quizalofop-P-tefurilo, cihalofop-butilo, fenoxaprop-etilo, fenoxaprop-P, fenoxaprop-P-etilo, metamifop-propilo, metamifop, clodinafop-propargilo, clodinafop, propaquizafop, HNPC-A8169 o SYP-1924; un compuesto de ciclohexanodiona como el aloxidim-sodio, aloxidim, cletodim, setoxidim, tralkoxidim, butroxicidim, tepraloxidim, profoxicidim o cicloxicidim, y un compuesto de 15 fenilpirazolina como el pinoxaden.

(7) Aquellos que se cree que exhiben efectos herbicidas al inhibir una biosíntesis de aminoácidos de plantas, tales como un compuesto de sulfonilurea, como clorimuron-etilo, clorimurón, sulfometurón-metil, sulfometurón, primisulfurón-metil, primisulfurón, bensulfurón-metil, bensulfurón, clorsulfurón, metsulfurón-metilo, metsulfurón, 20 cinosulfurón, pirazosulfurón-etilo, pirazosulfurón, flazasulfurón, rimsulfurón, nicosulfurón, imazosulfurón, flucetosulfurón, ciclosulfamurón, prosulfurón, flupirsulfurón-metil-sodio, flupirsulfurón, triflusulfurón-metilo, triflusulfurón, halosulfurón-metilo, halosulfurón, thifensulfurón-metil, tifensulfurón, etoxisulfurón, oxasulfurón, etametsulfurón, etametsulfurón-metil, iodosulfurón, yodosulfurón-metil-sodio, 25 sulfosulfurón, triasulfurón, tribenurón-metil, tribenuró, tritosulfurón, foramsulfurón, trifloxisulfurón, trifloxisulfurón-sodio, mesosulfurón-metil, mesosulfurón, ortosulfamurón, amidosulfurón, azimsulfurón, propirissulfurón, metazo sulfurón, metiopirsulfurón, monosulfurón-metil, orsosulfurón, iofensulfurón o iofensulfurón-sodio; un compuesto de triazolopirimidinasulfonamida tal como flumetsulam, metosulam, diclosulam, 30 cloransulam-metilo, florasulam, penoxsulam o piroxsulam; un compuesto de imidazolinona tal como imazapir, imazapir-isopropilamonio, imazetapir, imazetapir-amonio, imazaquin, imazaquin-amonio, imazamox, imazamox-amonio, imazametabenz, imazametabenz-metilo o imazapic; un compuesto de ácido pirimidinilsalicílico tal como piritiobac-sodio, bispiribac-sodio, piriminobac-metilo, piribenzoxima, piriftalida, 35 pirimisulfan o triafamona; un compuesto de sulfonilaminocarboniltriaolinona tal como flucarbazone, flucarbazone-sodio, propoxycarbazone-sodio, propoxycarbazone o tiencarbazone-metil; y glifosato, glifosato-sodio, glifosato-potasio, glifosato-amonio, glifosato-diamonio, glifosato-isopropilamonio, glifosato-trimesio, glifosato-sesquisodio, glufosinato, glufosinato-amonio, glufosinato-P, glufosinato-P-amonio, glufosinato-P -

5 sodio, bilanafos, bilanafos-sodio o cinmetilin.

(8) Aquellos que se cree que exhiben efectos herbicidas al inhibir mitosis celular de plantas, tales como un compuesto de dinitroanilina tal como trifluralina, orizalina, nitalina, pendimetalina, etalfluralina, benfluralina, prodiamina, butralina o dinitramina; un compuesto de amida tal como bensulida, napropamida, napropamida-M,
 10 propizamida o pronamida; un compuesto de fósforo orgánico tal como amiprofos-metilo, butamifos, anilofos o piperofos; un compuesto de fenil carbamato tal como profam, clorprofam, barban o carbetamida; un compuesto de cumilamina como daimurón, cumilurón, bromobutide o metildimrón; y asulam, asulam-sodio, ditiopir, tiazopir, clortal-dimetilo, clortal, difenamida, flamprop-M-metilo, flamprop-M o flamprop-
 15 M-isopropilo.

(9) Aquellos que se cree que exhiben efectos herbicidas al inhibir la biosíntesis de proteínas o la biosíntesis de lípidos de las plantas, tales como un compuesto de cloroacetamida como alacloro, metazacloro, butacloro, pretilacloro, metolacloro, S-metolacloro, tenilcloro, petoxamida, acetoclor, propacloro, dimetenamida,
 20 dimetenamida-P, propisocloro o dimetacloro; un compuesto de tiocarbamato tal como molinato, dimepiperato, piributicarb, EPTC, butilato, vernolato, pebulado, cicloato, prosulfocarb, esprocarb, tiobencarb, diallato, tri-alilato u orbencarb; y etobenzanid, mefenacet, flufenacet, tridifane, cafenstrole, fentrazamida, oxaziclomefona, indanofan, benfuresate, piroxasulfone, fenoxasulfone, metiozolin, dalapón, dalapón-sodio, TCA-
 25 sodio o acid tricloroacetico.

(10) Aquellos que se cree que exhiben efectos herbicidas al inhibir una biosíntesis de celulosa de las plantas, tales como diclobenilo, triaziflam, indaziflam, flupoxam o isoxaben.

(11) MSMA, DSMA, CMA, endotal, endotal-dipotásico, endotal-sódico, endotal-
 30 mono (N, N-dimetilalquilamonio), etofumesato, clorato de sodio, ácido pelargónico, ácido nonanoico, fosamina, fosamina-amonio, ipfencarbazona, acroleína, sulfamato de amonio, bórax, ácido cloroacético, cloroacetato sódico, cianamida, ácido metilarsónico, ácido dimetilarsínico, dimetilarsinato sódico, dinoterb, dinoterb-amonio, dinoterb-diolamina, dinoterb-acetato, DNOC, sulfato ferroso, flupropanato, flupropanato-sodio,
 35 mefluidida, mefluidida-diolamina, metam, metam-amonio, metam-potasio, metam-sodio, metil isotiocianato, pentaclorofenol, pentaclorofenóxido de sodio, laurato de pentaclorofenol, quinoclamina, ácido sulfúrico, sulfato de urea, xantinosina, herbicina, unguinol, metatirosina, sarmentina, taxtomina A, mevalocidina, alfa-limoneno, piribambenz-propilo, piribambenz-isopropilo, JS-913, KHG-23844, H-9201, SIOC-0163,

5 SIOC-0171, SIOC-0172, SIOC-0285, SIOC-0426, SIOC-H- 057, ZJ-0166, ZJ-1835, ZJ-0453 , ZJ-0777, ZJ-0862, un compuesto divulgado en WO2008/096398 (Kumiai Chemical).

(12) Aquellos que se cree que exhiben efectos herbicidas al ser parásitos de las plantas, tales como *Xanthomonas campestris*, *Epicoccossirus nematosorus*,
10 *Epicoccossirus nematosperus*, *Exserohilum monoseras* o *Drechsrela monoceras*.

Uno o más compuestos se pueden seleccionar apropiadamente entre los compuestos anteriores los cuales son compuestos activos de otros herbicidas. Los compuestos activos de otros herbicidas no están limitados a los compuestos ejemplificados anteriormente.

15

EJEMPLOS:

Ahora, la presente invención se describirá con más detalle con referencia a los Ejemplos, pero debe entenderse que la presente invención no está de ninguna manera restringida a dichos Ejemplos. En primer lugar, se describirán los ejemplos de
20 preparación de los compuestos de la presente invención.

EJEMPLO DE PREPARACIÓN 1

Preparación de 4-(5-((3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il)tio)-2-metilfenil)-5-metoxi-2,6-dimetilpiridazin-3(2H)-ona (compuesto antes mencionado No. 1-32)

(1) Bajo una atmósfera de nitrógeno, se añadió diisopropiletilamina (1,2 ml) a
25 una solución mixta de 2-bromo-4-yodo-1-metilbenceno (1,0 g), (4-metoxifenil) metanotiol (520 mg), tris(dibencilidenacetona)dipaladio (80 mg), 4,5-bis(difenilfosfino)-9,9-dimetilxanteno (100 mg) y 1,4-dioxano (10 ml), seguido de reacción bajo reflujo durante 1 hora. Se enfrió la mezcla de reacción resultante, se mezcló con agua y se extrajo dos veces con acetato de etilo (30 ml). Se lavó la capa orgánica resultante con
30 salmuera y se secó sobre sulfato de sodio anhidro, el disolvente se removió por destilación a presión reducida, y el residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna (heptano: acetato de etilo = 20: 1, relación de volumen; el mismo aplica en lo sucesivo) para obtener (3-bromo-4-metilfenil) (4-metoxibencil) sulfano (1,07 g, rendimiento: 98%) en forma de un aceite marrón. Los datos del espectro de
35 resonancia magnética nuclear (por sus siglas en inglés NMR) de este producto son los siguientes.

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ ppm =2.35(3H, s), 3.79(3H, s), 4.04(2H, s), 6.83(2H, d, J = 8.7 Hz), 7.08-7.21(4H,m), 7.48(1H, d, J = 0.6 Hz)

(2) Bajo una atmósfera de nitrógeno, una solución mixta de (3-bromo-4-

5 metilfenil) (4-metoxibencil)sulfano (1,07 g), bis(pinacolato)diboro (1,26 g),
 tris(dibencilidenacetona)dipaladio (120 mg) , triciclohexilfosfina (150 mg), acetato de
 potasio (490 mg) y 1,4-dioxano (15 ml) se hizo reaccionar a 120 °C durante 7 horas.
 Se enfrió la mezcla de reacción, se separó un sólido insoluble por Celite, y la materia
 sólida se lavó con acetato de etilo. El disolvente por destilación a presión reducida, y el
 10 residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna (heptano: acetato de etilo =
 20: 1) para obtener 2-(5-((4-metoxibencil)tio)-2-metilfenilo)-4, 4,5,5-tetrametil-1,3,2-
 dioxaborolano (1,07 g, rendimiento: 87%) en forma de un sólido blanco. Los datos del
 espectro NMR de este producto purificado son los siguientes.

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ ppm =1.38(12H, s), 2.48(3H, s), 3.77(3H, s),
 15 4.03(2H, s), 6.80(2H, d, J = 8.4 Hz), 7.04(1H, d, J = 8.1 Hz), 7.17-7.27(3H,m), 7.76(1H,
 dd, J = 1.5 Hz, J = 6.6 Hz)

(3) Una solución mixta de 2-(5-((4-metoxibencil)tio)-2-metilfenil) -4,4,5,5-
 tetrametil-1,3,2-dioxaborolano (381 mg), 4-bromo-5-metoxi-2,6-dimetilpiridazin-3(2H)-
 ona (200 mg), tetrakis (trifenilfosfina) paladio (40 mg), carbonato de sodio (200 mg),
 20 bromuro de tetrabutilamonio (144 mg), 1,4-dioxano (6 ml) y agua (4 ml) se hizo
 reaccionar a 120 °C durante 45 minutos. Se enfrió la mezcla de reacción, se mezcló
 con agua y se extrajo dos veces con acetato de etilo (20 ml). Se lavó la capa orgánica
 resultante con salmuera y se secó sobre sulfato de sodio anhidro, el disolvente se
 removió por destilación a presión reducida, y el residuo obtenido se purificó por
 25 cromatografía en columna (heptano: acetato de etilo = 1: 1, para obtener 5-metoxi-4-
 (5-((4-metoxibencil)tio)-2-metilfenil)-2,6-dimetilpiridazina-3(2H)-ona (275 mg,
 rendimiento: 81%) en forma de un sólido blanco. Los datos del espectro NMR de este
 producto purificado son los siguientes.

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ ppm =2.16(3H, s), 2.27(3H, s), 3.24(3H, s),
 30 3.68(3H, s), 3.77(3H, s), 4.03(2H, s), 6.79(2H, d, J = 8.7 Hz), 7.15-7.26(5H, m)

(4) Se disolvió (4) 5-metoxi-4-(5-((4-metoxibencil)tio)-2-metilfenil)-2,6-
 dimetilpiridazin-3(2H)-ona (275 mg) en ácido trifluoroacético (2 ml)) y se hizo
 reaccionar a 60 °C durante 3 horas. Se enfrió la mezcla de reacción y el disolvente se
 removió por destilación a presión reducida para obtener 4-(5-mercapto-2-metilfenil)-5-
 35 metoxi-2,6-dimetilpiridazin-3(2H)-ona (190 mg, rendimiento: 99%) en forma de un
 sólido marrón.

(5) Una solución mixta de 4-(5-mercapto-2-metilfenil)-5-metoxi-2,6-
 dimetilpiridazin-3(2H)-ona (190 mg) obtenida en la etapa (4) anterior, 2,3-dicloro-5-
 (trifluorometil)piridina (223 mg), carbonato de cesio (336 mg) y dimetilformamida (5 ml)

se hizo reaccionar a 60 °C durante 3 horas. Se enfrió la mezcla de reacción, se mezcló con agua y se extrajo dos veces con acetato de etilo (20 ml). Se lavó la capa orgánica resultante con salmuera y se secó sobre sulfato de sodio anhidro, el disolvente se removió por destilación a presión reducida, y el residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna (heptano: acetato de etilo = 3: 2, para obtener el producto deseado (122 mg, rendimiento: 39%) en forma de un sólido blanco. Los datos del espectro NMR de este producto purificado son los siguientes.

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ ppm =2.24(3H, s), 2.30(3H, s), 3.53(3H, s), 3.73(3H, s), 7.36-7.38(2H, m), 7.48(1H, dd, J = 2.1 Hz, J = 8.4 Hz), 7.76(1H, dd, J = 0.6 Hz, J = 2.1 Hz), 8.33(1H, dd, J = 0.9 Hz, J = 1.8 Hz)

EJEMPLO DE PEPARACIÓN 2

Preparación de 4-(5-((3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il)tio)-2-metilfenil)-5-hidroxi-2,6-dimetilpiridazin-3(2H)-ona (compuesto antes mencionado No. 1-2)

Se disolvió 4-(5-((3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il)tio)-2-metilfenil)-5-metoxi-2,6-dimetilpiridazin-3(2H)-ona (122 mg) en morfolino (2 ml), se selló en un tubo y se hizo reaccionar bajo irradiación con microondas a 140 °C durante 50 minutos.

Una vez completada la reacción, el exceso de morfolino se removió por destilación, el residuo se acidificó con ácido acético y la capa acuosa se extrajo dos veces con acetato de etilo (10 ml). La capa orgánica resultante se secó sobre sulfato de sodio, el disolvente se removió por destilación a presión reducida, y el residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna (heptano: acetato de etilo = 1: 1, para obtener el producto deseado (51 mg, rendimiento: 43%) en forma de un sólido blanco. Este producto tuvo un punto de fusión de entre 99 a 102 °C y sus datos del espectro de NMR son los siguientes:

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ ppm =2.24(3H, s), 2.30(3H, s), 3.73(3H, s), 7.36-7.48 (3H, m), 7.79(1H, d, J = 1.8 Hz), 8.32(1H, dd, J = 0.9 Hz, J = 1.8 Hz)

Los ejemplos típicos de los compuestos de la presente invención se muestran en las tablas 1 a 3. Estos compuestos se pueden preparar de acuerdo con los ejemplos de preparación o procesos de producción anteriores. En las tablas 1 a 3, el No. representa el compuesto No., Me es un grupo metilo, Et un grupo etilo, Pr un grupo n-propilo, i-Pr un grupo isopropilo, n-Bu un grupo n-butilo, t-Bu grupo terc-butilo, c-Pr un grupo ciclopropilo, c-Hex un grupo ciclohexilo, Ph un grupo fenilo, y Bn un grupo bencilo, respectivamente. Además, "2,6- (Me)₂" en las Tablas significa que los grupos metilo como sustituyentes están en las posiciones 2 y 6, respectivamente, y lo mismo

5 se aplica de aquí en adelante.

Los valores numéricos descritos en la columna "propiedades físicas" en las Tablas 1 a 3 representan los puntos de fusión (°C), y de los compuestos con NMR en la columna "propiedades físicas", los datos del espectro de ¹H-NMR se muestran en la Tabla 4.

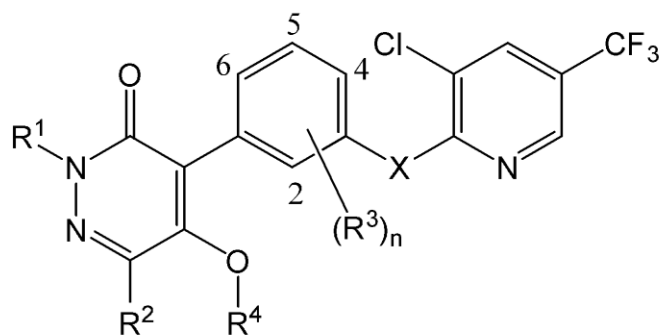


Tabla 1

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Propiedades Físicas
1-1	Me	Me	6-Me	H	O	102-105
1-2	Me	Me	6-Me	H	S	99-102
1-3	Me	Me	6-Et	H	O	94-96
1-4	Me	Me	6-Et	H	S	109-111
1-5	Me	Me	6-Pr	H	O	
1-6	Me	Me	6- <i>i</i> -Pr	H	O	
1-7	Me	Me	6- <i>t</i> -Bu	H	O	
1-8	Me	Me	6-CF ₃	H	O	
1-9	Me	Me	6- <i>c</i> -Pr	H	O	
1-10	Me	Me	6-OMe	H	O	133
1-11	Me	Me	6-Cl	H	O	
1-12	Me	Me	2-Me	H	O	190
1-13	Me	Me	2,6-(Me) ₂	H	O	90
1-14	Me	Me	4,6-(Me) ₂	H	O	94
1-15	Me	Me	4-Me	H	O	
1-16	Me	Me	6-Pr	H	S	
1-17	Me	Me	6- <i>i</i> -Pr	H	S	
1-18	Me	Me	6- <i>t</i> -Bu	H	S	
1-19	Me	Me	6-CF ₃	H	S	
1-20	Me	Me	6- <i>c</i> -Pr	H	S	
1-21	Me	Me	6-OMe	H	S	
1-22	Me	Me	6-Cl	H	S	
1-23	Me	Me	2-Me	H	S	
1-24	Me	Me	2,6-(Me) ₂	H	S	
1-25	Me	Me	4,6-(Me) ₂	H	S	
1-26	Me	Me	4-Me	H	S	
1-27	Me	Me	6-Me	Me	O	NMR
1-28	Me	Me	6-Et	Me	O	NMR
1-29	Me	Me	2-Me	Me	O	NMR
1-30	Me	Me	6-Pr	Me	O	
1-31	Me	Me	6- <i>i</i> -Pr	Me	O	
1-32	Me	Me	6-Me	Me	S	NMR

Tabla 1 (Continuación)

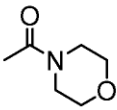
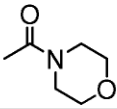
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Propiedades Físicas
1-33	Me	Me	6-Et	Me	S	
1-34	Me	Me	6-Pr	Me	S	
1-35	Me	Me	6- <i>i</i> -Pr	Me	S	
1-36	Me	Me	6- <i>t</i> -Bu	Me	O	
1-37	Me	Me	6-CF ₃	Me	O	
1-38	Me	Me	6- <i>t</i> -Bu	Me	S	
1-39	Me	Me	6-CF ₃	Me	S	
1-40	Me	Me	6-Me	COMe	O	NMR
1-41	Me	Me	6-Me	COOEt	O	NMR
1-42	Me	Me	6-Me	COMe	S	127-130
1-43	Me	Me	6-Me	COOEt	S	
1-44	Me	Me	2-Me	COMe	O	118
1-45	Me	Me	6-Et	COMe	O	138
1-46	Me	Me	6-Et	COMe	S	174
1-47	Me	Me	6-Me	COEt	O	
1-48	Me	Me	6-Et	COEt	O	
1-49	Me	Me	6-Me	CO- <i>i</i> -Pr	O	
1-50	Me	Me	6-Et	CO- <i>i</i> -Pr	O	
1-51	Me	Me	6-Me	CO- <i>t</i> -Bu	O	
1-52	Me	Me	6-Et	CO- <i>t</i> -Bu	O	
1-53	Me	Me	6-Me	COOMe	O	
1-54	Me	Me	6-Et	COOMe	O	
1-55	Me	Me	6-Me	COOEt	O	
1-56	Me	Me	6-Et	COOEt	O	
1-57	Me	Me	6-Me	COO- <i>i</i> -Pr	O	
1-58	Me	Me	6-Et	COO- <i>i</i> -Pr	O	
1-59	Me	Me	6-Me	COO- <i>t</i> -Bu	O	NMR
1-60	Me	Me	6-Et	COO- <i>t</i> -Bu	O	
1-61	Me	Me	6-Me		O	
1-62	Me	Me	6-Me	SO ₂ Me	O	60
1-63	Me	Me	6-Et		O	
1-64	Me	Me	6-Et	SO ₂ Me	O	
1-65	Et	Me	6-Me	H	O	97
1-66	Et	Me	6-Et	H	O	
1-67	<i>i</i> -Pr	Me	6-Me	H	O	

Tabla 1 (Continuación)

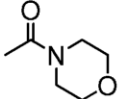
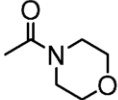
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Propiedades Físicas
1-68	<i>i</i> -Pr	Me	6-Et	H	O	
1-69	Me	Me	6-Et	COOEt	S	
1-70	Me	Me	6-Me	COEt	S	
1-71	Me	Me	6-Et	COEt	S	
1-72	Me	Me	6-Me	CO <i>i</i> -Pr	S	
1-73	Me	Me	6-Et	CO <i>i</i> -Pr	S	
1-74	Me	Me	6-Me	CO <i>t</i> -Bu	S	
1-75	Me	Me	6-Et	CO <i>t</i> -Bu	S	
1-76	Me	Me	6-Me	COOMe	S	
1-77	Me	Me	6-Et	COOMe	S	
1-78	Me	Me	6-Me	COOEt	S	
1-79	Me	Me	6-Et	COOEt	S	
1-80	Me	Me	6-Me	COO <i>i</i> -Pr	S	
1-81	Me	Me	6-Et	COO <i>i</i> -Pr	S	
1-82	Me	Me	6-Me	COO <i>t</i> -Bu	S	
1-83	Me	Me	6-Et	COO <i>t</i> -Bu	S	
1-84	Me	Me	6-Me		S	
1-85	Me	Me	6-Me	SO ₂ Me	S	
1-86	Me	Me	6-Et		S	
1-87	Me	Me	6-Et	SO ₂ Me	S	
1-88	Et	Me	6-Me	H	S	
1-89	Et	Me	6-Et	H	S	
1-90	<i>i</i> -Pr	Me	6-Me	H	S	
1-91	<i>i</i> -Pr	Me	6-Et	H	S	
1-92	Me	Me	6-Et	H	NMe	
1-93	Me	Me	6-Et	Me	NMe	
1-94	Me	H	6-Me	H	O	
1-95	Me	H	6-Et	H	O	184
1-96	Me	H	6-Me	Me	O	
1-97	Me	H	6-Et	Me	O	
1-98	Me	Et	6-Me	H	O	NMR
1-99	Me	Et	6-Et	H	O	
1-100	Me	Et	6-Me	Me	O	NMR
1-101	Me	Et	6-Et	Me	O	
1-102	Me	<i>i</i> -Pr	6-Me	H	O	
1-103	Me	<i>i</i> -Pr	6-Et	H	O	

Tabla 1 (Continuación)

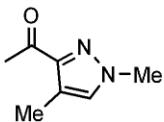
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴		Propiedades Físicas
1-104	Me	<i>i</i> -Pr	6-Me	Me	O	
1-105	Me	<i>i</i> -Pr	6-Et	Me	O	
1-106	Me	<i>t</i> -Bu	6-Me	H	O	
1-107	Me	<i>t</i> -Bu	6-Et	H	O	
1-108	Me	<i>t</i> -Bu	6-Me	Me	O	
1-109	Me	<i>t</i> -Bu	6-Et	Me	O	
1-110	Me	H	6-Me	H	S	
1-111	Me	H	6-Et	H	S	
1-112	Me	H	6-Me	Me	S	
1-113	Me	H	6-Et	Me	S	
1-114	Me	Et	6-Me	H	S	
1-115	Me	Et	6-Et	H	S	
1-116	Me	Et	6-Me	Me	S	
1-117	Me	Et	6-Et	Me	S	
1-118	Me	<i>i</i> -Pr	6-Me	H	S	
1-119	Me	<i>i</i> -Pr	6-Et	H	S	
1-120	Me	<i>i</i> -Pr	6-Me	Me	S	
1-121	Me	<i>i</i> -Pr	6-Et	Me	S	
1-122	Me	<i>t</i> -Bu	6-Me	H	S	
1-123	Me	<i>t</i> -Bu	6-Et	H	S	
1-124	Me	<i>t</i> -Bu	6-Me	Me	S	
1-125	Me	<i>t</i> -Bu	6-Et	Me	S	
1-126	Me	Me	6- <i>c</i> -Pr	Me	O	
1-127	Me	Me	6- <i>c</i> -Pr	COMe	O	
1-128	Me	Me	6- <i>c</i> -Pr	Me	S	
1-129	Me	Me	6- <i>c</i> -Pr	COMe	S	
1-130	Me	Me	6-Me	CH(Me)OCOOMe	O	NMR
1-131	Me	Me	6-Me	CH(Me)OCOEt	O	NMR
1-132	Me	Me	6-Me	CH ₂ OMe	O	NMR
1-133	Me	Me	6-Me	CH(Me)OCOO <i>i</i> -Pr	O	NMR
1-134	Me	Me	6-Me	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	O	105
1-135	Me	Me	6-Me	CO <i>n</i> -Bu	O	NMR
1-136	Me	Me	6-Me		O	NMR

Tabla 1 (Continuación)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Propiedades Físicas
1-137	Me	Et	6-Me	COMe	O	NMR
1-138	Me	Et	6-Me	CH ₂ OMe	O	NMR
1-139	Me	Et	6-Me	CH(Me)OCOOMe	O	NMR
1-140	Me	CF ₃	6-Me	Me	O	NMR
1-141	Me	CF ₃	6-Me	H	O	NMR
1-142	Me	CF ₃	6-Me	COMe	O	NMR
1-143	Me	Me	6-Me	H	NMe	187-188
1-144	Me	Me	6-Me	H	NH	199-202
1-145	Me	Me	6-Me	COMe	NMe	147
1-146	Me	Me	6-Me	COMe	NH	204-205
1-147	Me	Me	6-Me	Me	NMe	NMR
1-148	Me	Me	6-Me	Me	NH	NMR
1-149	Me	Me	6- <i>c</i> -Pr	H	O	85-89
1-150	Me	Me	6- <i>c</i> -Pr	COMe	O	109-112
1-151	Me	Me	4,6-(Me) ₂	CH(Me)OCOOMe	O	45
1-152	Me	Me	4,6-(Me) ₂	COMe	O	129
1-153	Me	Me	H	H	O	168
1-154	Me	Me	4-NO ₂ ,6-Me	H	O	54
1-155	Me	Me	4-NO ₂ ,6-Me	COMe	O	63
1-156	Me	Me	4-NH ₂ ,6-Me	COMe	O	48
1-157	Et	H	6-Me	H	O	184
1-158	Me	Me	4-Et,6-Me	H	O	98
1-159	Me	Me	4-Et,6-Me	COMe	O	144
1-160	Me	Me	4-COMe,6-Me	H	O	55
1-161	Me	Me	4-COMe,6-Me	COMe	O	62
1-162	Me	H	6-OCF ₃	H	O	NMR
1-163	Me	Me	6-OCF ₃	H	O	93
1-164	Me	Me	6-OCF ₃	COMe	O	103
1-165	Et	Me	6-Me	COMe	O	40
1-166	<i>c</i> -Pr-CH ₂ -	H	2-Me	H	O	113
1-167	CH ₂ =CHCH ₂ -	H	6-Me	H	O	79
1-168	Me	Me	6-OH	H	O	96
1-169	MeCOCH ₂ -	H	6-Me	H	O	172
1-170	<i>c</i> -Pr-CH ₂ -	H	2-Me	COMe	O	NMR
1-171	Me	H	6-Me	COMe	O	NMR
1-172	4-MeO-Bn-	H	6-Me	H	O	88

Tabla 1 (Continuación)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Propiedades Físicas
1-173	Et	H	6-Et	H	O	164
1-174	Et	H	6-Et	COMe	O	77
1-175	MeOCH ₂ -	H	6-Me	H	O	73
1-176	MeOCH ₂ -	H	6-Me	COMe	O	NMR
1-177	Pr	H	6-Me	H	O	57
1-178	Me	H	6-Cl	H	O	90
1-179	Me	H	6-CF ₃	H	O	94
1-180	MeOCH ₂ CH ₂ -	H	6-Me	H	O	67
1-181	Et	H	6-Me	COMe	O	NMR
1-182	MeOCH ₂ CH ₂ -	H	6-Me	COMe	O	NMR
1-183	Me S CH ₂ -	Me	6-Me	H	O	68
1-184	Me	H	6-Cl	COMe	O	120
1-185	MeOOCCH ₂ -	Me	6-Me	Me	O	NMR
1-186	MeOOCCH ₂ -	Me	6-Me	COMe	O	
1-187	Me S CH ₂ -	Me	6-Me	COMe	O	NMR
1-188	HOOCCH ₂ -	Me	6-Me	H	O	140-143

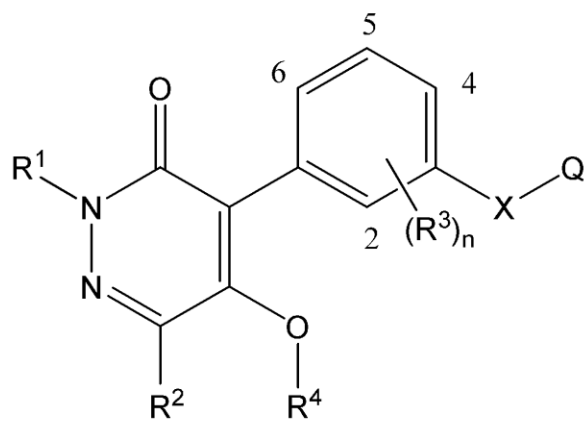


Tabla 2

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Propiedades Físicas
2-1	Me	Me	6-Me	H	O		
2-2	Me	Me	6-Me	H	O		121-124
2-3	Me	Me	6-Me	H	O		99-101
2-4	Me	Me	6-Me	H	O		
2-5	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-6	Me	Me	6-Me	H	O		
2-7	Me	Me	6-Me	H	O		202-204
2-8	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-9	Me	Me	6-Me	H	O		
2-10	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-11	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-12	Me	Me	6-Me	H	O		105-106
2-13	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-14	Me	Me	6-Et	H	O		NMR

Tabla 2 (Continuación)

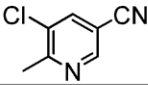
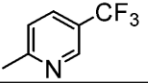
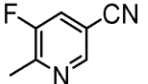
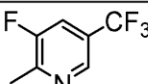
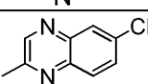
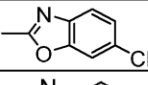
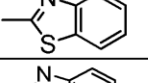
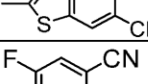
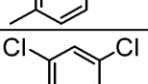
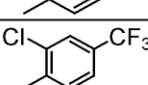
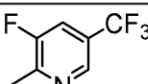
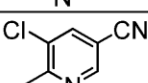
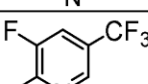
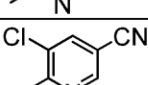
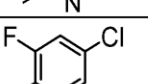
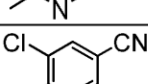
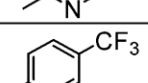
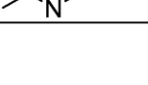
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Propiedades Físicas
2-15	Me	Me	6-Et	H	O		
2-16	Me	Me	6-Et	H	O		
2-17	Me	Me	6-Et	H	O		
2-18	Me	Me	6-Et	H	O		
2-19	Me	Me	6-Et	H	O		
2-20	Me	Me	6-Et	H	O		
2-21	Me	Me	6-Et	H	O		
2-22	Me	H	6-Et	H	O		
2-23	Me	H	6-Et	H	O		
2-24	Me	H	6-Et	H	O		
2-25	Me	H	6-Et	H	O		
2-26	Et	Me	6-Me	H	O		
2-27	Et	Me	6-Et	H	O		
2-28	<i>i</i> -Pr	Me	6-Me	H	O		
2-29	<i>i</i> -Pr	Me	6-Et	H	O		
2-30	Me	Me	6-Me	H	S		
2-31	Me	Me	6-Me	H	S		
2-32	Me	Me	6-Me	H	S		

Tabla 2 (Continuación)

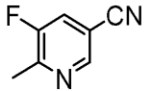
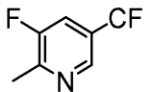
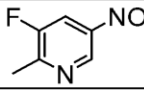
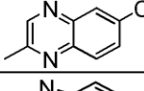
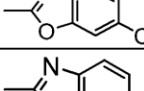
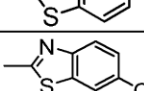
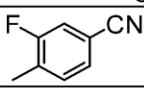
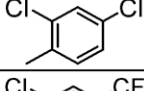
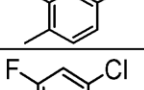
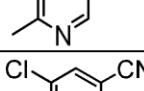
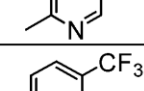
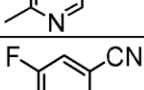
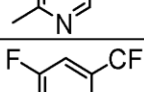
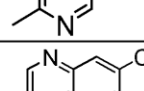
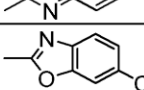
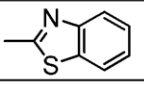
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Propiedades Físicas
2-33	Me	Me	6-Me	H	S		
2-34	Me	Me	6-Me	H	S		
2-35	Me	Me	6-Me	H	S		
2-36	Me	Me	6-Me	H	S		
2-37	Me	Me	6-Me	H	S		
2-38	Me	Me	6-Me	H	S		
2-39	Me	Me	6-Me	H	S		
2-40	Me	Me	6-Me	H	S		
2-41	Me	Me	6-Me	H	S		
2-42	Me	Me	6-Me	H	S		
2-43	Me	Me	6-Et	H	S		
2-44	Me	Me	6-Et	H	S		
2-45	Me	Me	6-Et	H	S		
2-46	Me	Me	6-Et	H	S		
2-47	Me	Me	6-Et	H	S		
2-48	Me	Me	6-Et	H	S		
2-49	Me	Me	6-Et	H	S		
2-50	Me	Me	6-Et	H	S		

Tabla 2 (Continuación)

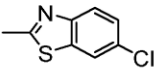
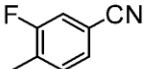
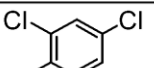
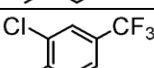
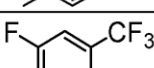
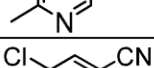
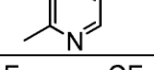
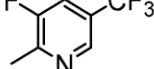
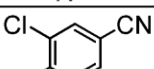
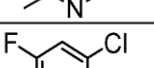
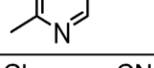
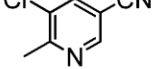
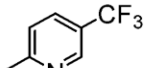
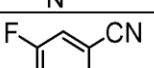
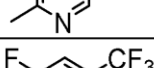
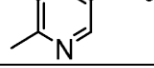
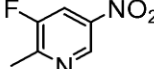
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Propiedades Físicas
2-51	Me	H	6-Et	H	S		
2-52	Me	H	6-Et	H	S		
2-53	Me	H	6-Et	H	S		
2-54	Me	H	6-Et	H	S		
2-55	Et	Me	6-Me	H	S		
2-56	Et	Me	6-Et	H	S		
2-57	<i>i</i> -Pr	Me	6-Me	H	S		
2-58	<i>i</i> -Pr	Me	6-Et	H	S		
2-59	Me	Me	6-Me	COMe	O		157
2-60	Me	Me	6-Me	COMe	O		170
2-61	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-62	Me	Me	6-Me	COMe	O		
2-63	Me	Me	6-Me	COMe	O		143-144
2-64	Me	Me	6-Me	COMe	O		
2-65	Me	Me	6-Et	COMe	O		
2-66	Me	Me	6-Et	COMe	O		
2-67	Me	Me	6-Et	COMe	O		

Tabla 2 (Continuación)

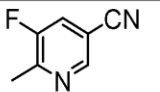
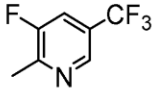
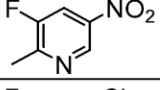
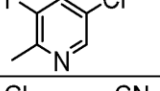
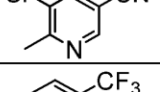
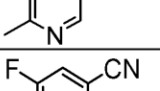
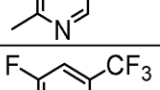
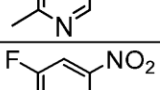
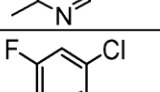
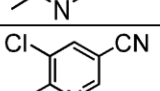
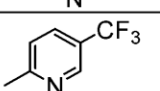
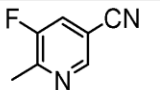
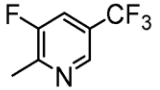
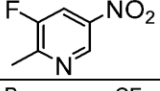
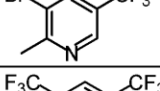
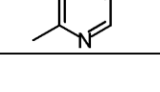
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Propiedades Físicas
2-68	Me	Me	6-Et	COMe	O		
2-69	Me	Me	6-Et	COMe	O		
2-70	Me	Me	6-Et	COMe	O		
2-71	Me	Me	6-Me	COMe	S		
2-72	Me	Me	6-Me	COMe	S		
2-73	Me	Me	6-Me	COMe	S		
2-74	Me	Me	6-Me	COMe	S		
2-75	Me	Me	6-Me	COMe	S		
2-76	Me	Me	6-Me	COMe	S		
2-77	Me	Me	6-Et	COMe	S		
2-78	Me	Me	6-Et	COMe	S		
2-79	Me	Me	6-Et	COMe	S		
2-80	Me	Me	6-Et	COMe	S		
2-81	Me	Me	6-Et	COMe	S		
2-82	Me	Me	6-Et	COMe	S		
2-83	Me	Me	6-Me	H	O		179
2-84	Me	Me	6-Me	H	O		188-189

Tabla 2 (Continuación)

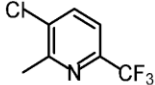
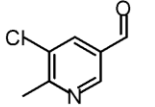
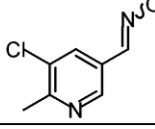
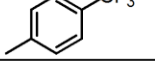
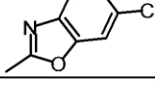
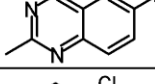
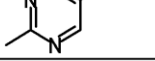
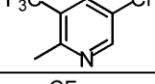
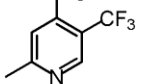
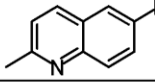
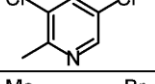
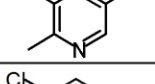
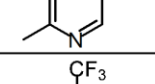
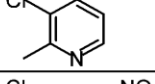
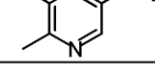
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Propiedades Físicas
2-85	Me	Me	6-Me	H	O		224-225
2-86	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-87	Me	Me	6-Me	H	O		137-139
2-88	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-89	Me	Et	6-Me	H	O		NMR
2-90	Me	Me	6-Me	H	O		120-122
2-91	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-92	Me	Me	6-Me	H	O		109-110
2-93	Me	Me	6-Me	H	O		96-98
2-94	Me	Me	6-Me	H	O		132-134
2-95	Me	Me	6-Me	H	O		104-105
2-96	Me	Me	6-Me	H	O		104-106
2-97	Me	Me	6-Me	H	O		86-87
2-98	Me	Me	6-Me	H	O		120-122
2-99	Me	Me	6-Me	H	O		105-108

Tabla 2 (Continuación)

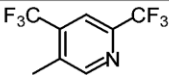
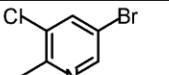
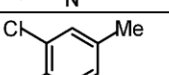
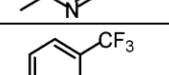
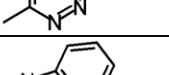
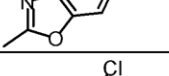
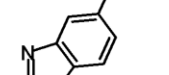
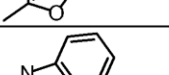
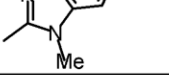
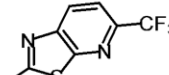
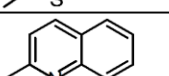
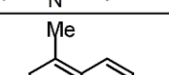
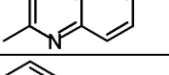
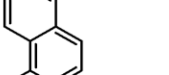
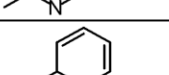
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Propiedades Físicas
2-100	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-101	Me	Me	6-Me	H	O		166-168
2-102	Me	Me	6-Me	H	O		102-105
2-103	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-104	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-105	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-106	Me	Me	6-Me	H	O		116-121
2-107	Me	Me	6-Me	H	O		113-118
2-108	Me	Me	6-Me	H	O		105-108
2-109	Me	Me	6-Me	H	O		223-224
2-110	Me	Me	6-Me	H	O		108-112
2-111	Me	Me	6-Me	H	O		110-112
2-112	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-113	Me	Me	6-Me	H	O		132-133
2-114	Me	Me	6-Me	COMe	O		142

Tabla 2 (Continuación)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Propiedades Físicas
2-115	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-116	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-117	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-118	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-119	Me	Me	6-Me	COMe	O		148-149
2-120	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-121	Me	Me	6-Me	COMe	O		186-187
2-122	Me	Et	6-Me	COMe	O		166-168
2-123	Me	Me	6-Me	COMe	O		207-208
2-124	Me	Me	6-Me	COMe	O		193
2-125	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-126	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-127	Me	Me	6-Me	COMe	O		170-171
2-128	Me	Me	6-Me	COMe	O		166
2-129	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-130	Me	Me	6-Me	COMe	O		173

Tabla 2 (Continuación)

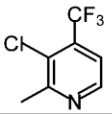
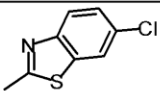
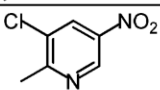
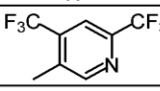
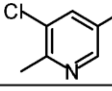
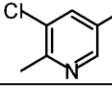
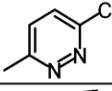
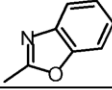
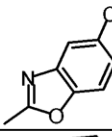
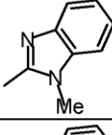
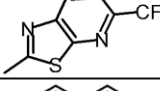
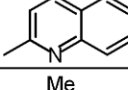
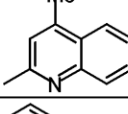
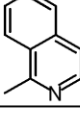
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Propiedades Físicas
2-131	Me	Me	6-Me	COMe	O		140
2-132	Me	Me	6-Me	COMe	O		143-144
2-133	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-134	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-135	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-136	Me	Me	6-Me	COMe	O		179-180
2-137	Me	Me	6-Me	COMe	O		160-161
2-138	Me	Me	6-Me	COMe	O		191-192
2-139	Me	Me	6-Me	COMe	O		149-152
2-140	Me	Me	6-Me	COMe	O		202
2-141	Me	Me	6-Me	COMe	O		137-141
2-142	Me	Me	6-Me	COMe	O		127-129
2-143	Me	Me	6-Me	COMe	O		167-168
2-144	Me	Me	6-Me	COMe	O		198-199

Tabla 2 (Continuación)

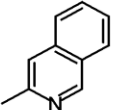
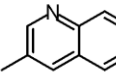
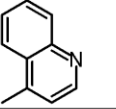
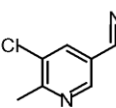
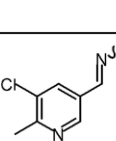
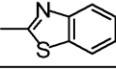
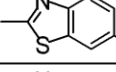
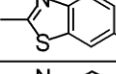
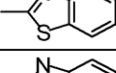
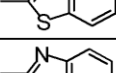
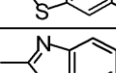
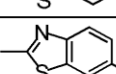
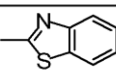
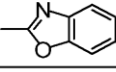
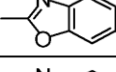
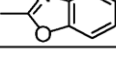
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Propiedades Físicas
2-145	Me	Me	6-Me	COMe	O		143
2-146	Me	Me	6-Me	COMe	O		147
2-147	Me	Me	6-Me	COMe	O		207-208
2-148	Me	Me	6-Me	COMe	O		181-182
2-149	Me	Me	6-Me	CH ₂ OMe	O		NMR
2-150	Me	Me	6-Et	H	O		95-99
2-151	Me	Me	6-Me	H	O		115
2-152	Me	Me	6-Me	COMe	O		157
2-153	Me	Me	6-Me	H	O		94
2-154	Me	Me	6-Me	COMe	O		146
2-155	Me	Me	6-Me	H	O		198
2-156	Me	Me	6-Me	H	O		123
2-157	Me	Me	6-Me	COMe	O		188
2-158	Me	Me	6-Me	COMe	O		147
2-159	Me	Me	6-Et	COMe	O		163
2-160	Me	H	6-Et	COMe	O		NMR
2-161	Me	Me	6-Et	H	O		86-90

Tabla 2 (Continuación)

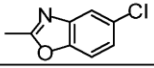
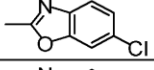
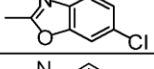
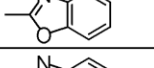
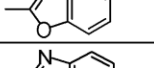
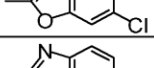
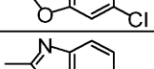
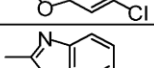
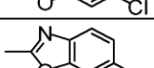
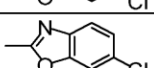
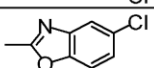
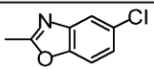
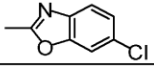
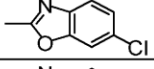
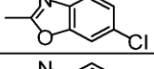
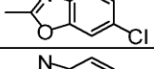
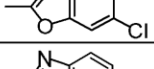
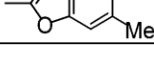
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Propiedades Físicas
2-162	Me	Me	6-Et	H	O		176
2-163	Me	H	6-Me	H	O		250
2-164	Me	H	6-Me	COMe	O		NMR
2-165	Me	Me	6-Et	H	O		95
2-166	Me	Me	6-Et	H	O		147
2-167	Et	H	6-Me	H	O		239
2-168	Ph	H	6-Me	H	O		234
2-169	Et	H	6-Me	COMe	O		131
2-170	Ph	H	6-Me	COMe	O		63
2-171	<i>i</i> -Pr	H	6-Me	H	O		229
2-172	<i>i</i> -Pr	H	6-Me	COMe	O		NMR
2-173	Me	H	6-Me	H	O		99
2-174	Me	H	6-Me	COMe	O		114
2-175	Me	Me	6-OCF ₃	H	O		92
2-176	Et	Me	6-Me	H	O		92
2-177	Et	Me	6-Me	COMe	O		138
2-178	Me	H	6-Me	CH(Me)OCOOMe	O		40-42
2-179	CHF ₂ CH ₂ -	H	6-Me	H	O		210
2-180	Me	H	6-Me	H	O		186-189

Tabla 2 (Continuación)

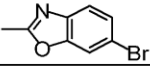
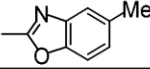
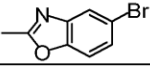
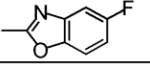
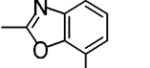
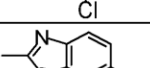
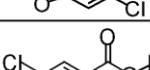
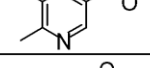
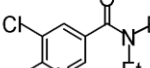
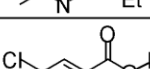
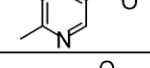
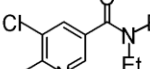
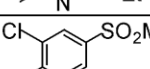
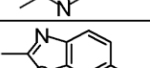
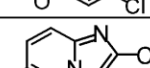
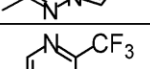
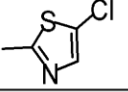
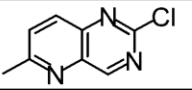
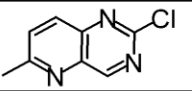
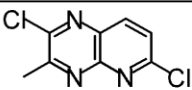
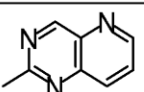
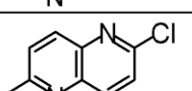
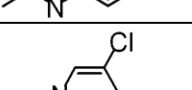
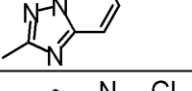
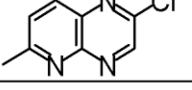
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Propiedades Físicas
2-181	Me	H	6-Me	H	O		250
2-182	Me	H	6-Me	H	O		140
2-183	Me	H	6-Me	H	O		105
2-184	Me	H	6-Me	H	O		210
2-185	Me	H	6-Me	H	O		150
2-186	<i>c</i> -Pr-CH ₂ -	H	6-Me	H	O		211
2-187	Me	Me	6-Et	H	O		183
2-188	Me	Me	6-Et	H	O		55
2-189	Me	Me	6-Et	COMe	O		138
2-190	Me	Me	6-Et	COMe	O		NMR
2-191	Me	Me	6-Me	H	O		140
2-192	Ph	H	6-Me	COMe	O		63
2-193	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-194	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-195	Me	Me	6-Me	COMe	O		NMR
2-196	Me	Me	6-Me	H	O		149-150

Tabla 2 (Continuación)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Q	Propiedades Físicas
2-197	Me	Me	6-Me	COMe	O		137-138
2-198	Me	Me	6-Me	H	O		NMR
2-199	Me	Me	6-Me	COMe	O		183-185
2-200	Me	Me	6-Me	Me	O		229-230
2-201	Me	Me	6-Me	Me	O		
2-202	Me	Me	6-Me	Me	O		
2-203	Me	Me	6-Me	Me	O		
2-204	Me	Me	6-Me	Me	O		
2-205	Me	Me	6-Me	Me	O		173-175

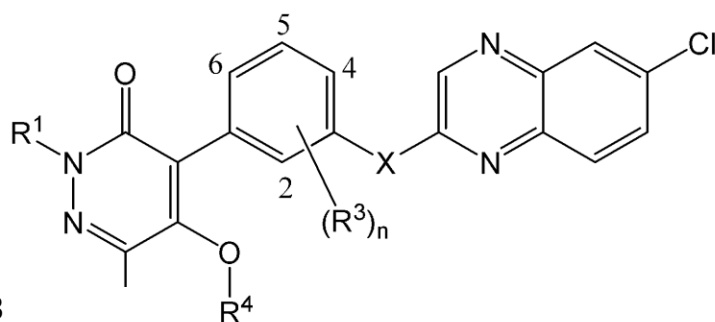


Tabla 3

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Propiedades Físicas
3-1	Me	Me	6-Me	H	O	202-204
3-2	Me	Me	6-Me	H	S	
3-3	Me	Me	6-Et	H	O	
3-4	Me	Me	6-Et	H	S	
3-5	Me	Me	6-Pr	H	O	
3-6	Me	Me	6- <i>i</i> -Pr	H	O	
3-7	Me	Me	6- <i>t</i> -Bu	H	O	
3-8	Me	Me	6-CF ₃	H	O	
3-9	Me	Me	6- <i>c</i> -Pr	H	O	
3-10	Me	Me	6-OMe	H	O	
3-11	Me	Me	6-Cl	H	O	
3-12	Me	Me	2-Me	H	O	
3-13	Me	Me	2,6-(Me) ₂	H	O	
3-14	Me	Me	4,6-(Me) ₂	H	O	
3-15	Me	Me	4-Me	H	O	
3-16	Me	Me	6-Pr	H	S	
3-17	Me	Me	6- <i>i</i> -Pr	H	S	
3-18	Me	Me	6- <i>t</i> -Bu	H	S	
3-19	Me	Me	6-CF ₃	H	S	
3-20	Me	Me	6- <i>c</i> -Pr	H	S	
3-21	Me	Me	6-OMe	H	S	
3-22	Me	Me	6-Cl	H	S	
3-23	Me	Me	2-Me	H	S	
3-24	Me	Me	2,6-(Me) ₂	H	S	
3-25	Me	Me	4,6-(Me) ₂	H	S	
3-26	Me	Me	4-Me	H	S	
3-27	Me	Me	6-Me	Me	O	NMR
3-28	Me	Me	6-Et	Me	O	
3-29	Me	Me	2-Me	Me	O	
3-30	Me	Me	6-Pr	Me	O	
3-31	Me	Me	6- <i>i</i> -Pr	Me	O	
3-32	Me	Me	6-Me	Me	S	

Tabla 3 (Continuación)

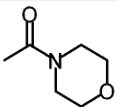
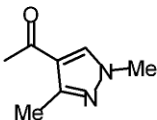
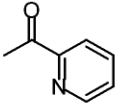
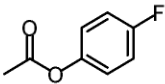
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Propiedades Físicas
3-33	Me	Me	6-Me	COMe	O	192
3-34	Me	Et	6-Me	H	O	164-168
3-35	Me	Me	6-Me	COOEt	O	NMR
3-36	Me	Me	6-Me	CO <i>n</i> -Bu	O	112-113
3-37	Me	Me	6-Me	CO <i>c</i> -Pr	O	NMR
3-38	Me	Me	6-Me	COPh	O	200-201
3-39	Me	Me	6-Me		O	NMR
3-40	Me	Me	6-Me	CH ₂ OMe	O	NMR
3-41	Me	Me	6-Me	CH ₂ Ph	O	128
3-42	Me	Me	6-Me	CO <i>t</i> -Bu	O	178-180
3-43	Me	Me	6-Me		O	NMR
3-44	Me	Me	6-Me	CH(Me)OCOOMe	O	NMR
3-45	Me	Me	6-Me	COCH ₂ OMe	O	168-169
3-46	Me	Me	6-Me	COCH ₂ CH ₂ COOMe	O	NMR
3-47	Me	Me	6-Me	COCH ₂ Ph	O	NMR
3-48	Me	Me	6-Me	COCH ₂ OPh	O	NMR
3-49	Me	Me	6-Me	COCH=CH ₂	O	NMR
3-50	Me	Me	6-Me	COCH ₂ CH ₂ SMe	O	164-165
3-51	Me	Me	6-Me		O	172-175
3-52	Me	Me	6-Me	COCF ₃	O	NMR
3-53	Me	Me	6-Me	COCH ₂ <i>t</i> -Bu	O	146
3-54	Me	Me	6-Me	COCH=CHCl	O	NMR
3-55	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ OMe	O	NMR
3-56	Me	Me	6-Me	COSPr	O	NMR
3-57	Me	Me	6-Me		O	NMR
3-58	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH=CH ₂	O	NMR
3-59	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ Cl	O	NMR
3-60	Me	Me	6-Me	COO <i>i</i> -Pr	O	NMR

Tabla 3 (Continuación)

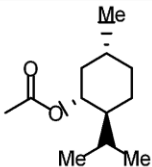
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Propiedades Físicas
3-61	Me	Me	6-Me		O	NMR
3-62	Me	Me	6-Me	CSOPh	O	NMR
3-63	Me	Me	6-Me	CSSPh	O	NMR
3-64	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ C≡CH	O	NMR
3-65	Me	Me	6-Me	CON(Me) ₂	O	NMR
3-66	Me	Me	6-Me	CON(Me)Ph	O	166-167
3-67	Me	Me	6-Me	CSN(Me) ₂	O	NMR
3-68	Me	Me	6-Me	SO ₂ Et	O	187-188
3-69	Me	Me	6-Me	SO ₂ CF ₃	O	167-168
3-70	Me	Me	6-Me	SO ₂ <i>c</i> -Pr	O	197-198
3-71	Me	Me	6-Me	SO ₂ (4-Me-Ph)	O	NMR
3-72	Me	Me	6-Me	CH ₂ COMe	O	186-187
3-73	Me	Me	6-Me	CH ₂ COPh	O	168
3-74	Me	Me	6-Me	CH ₂ CH=CH ₂	O	119
3-75	Me	Me	6-Me	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	O	NMR
3-76	Me	Me	6-Me	CH(Me)OCOOC- <i>Hex</i>	O	NMR
3-77	Me	Me	6-Me	CH ₂ C≡CH	O	162-164
3-78	Me	Me	6-Me	CH ₂ CN	O	165
3-79	Me	Me	6-Me	COCOOEt	O	NMR
3-80	Me	Me	6-Me	COCH ₂ <i>c</i> -Hex	O	NMR
3-81	Me	Me	6-Me	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ Cl	O	NMR
3-82	Me	Me	6-Me	COC≡CH	O	NMR
3-83	Me	Me	6-Me	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	O	130-131
3-84	Me	Me	6-Me	COCH ₂ NMe ₂	O	141-142
3-85	Me	Me	6-Me	COCH ₂ CN	O	
3-86	Me	Me	6-Me	COCH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	O	
3-87	Me	Me	6-Me	COOCH(Me)Cl	O	NMR
3-88	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ OCH ₂ <i>c</i> -Pr	O	
3-89	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OEt	O	

Tabla 3 (Continuación)

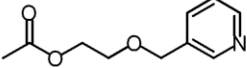
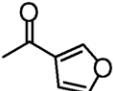
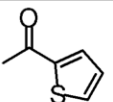
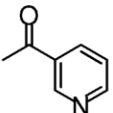
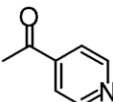
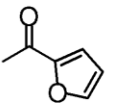
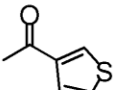
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Propiedades Físicas
3-90	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ OCH ₂ Ph	O	NMR
3-91	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	O	
3-92	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SMe	O	
3-93	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ F	O	
3-94	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	O	
3-95	Me	Me	6-Me		O	
3-96	Et	Me	6-Me	H	O	103
3-97	Et	Me	6-Me	COMe	O	173
3-98	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	O	NMR
3-99	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ OCH=CH ₂	O	NMR
3-100	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ SMe	O	NMR
3-101	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH ₂ <i>c</i> -Pr	O	NMR
3-102	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ CH(Me) ₂	O	NMR
3-103	Me	Me	6-Me	COOC(Me)=CH ₂	O	122
3-104	Me	Me	6-Me		O	185-186
3-105	Me	Me	6-Me		O	NMR
3-106	Me	Me	6-Me		O	NMR
3-107	Me	Me	6-Me		O	217
3-108	Me	Me	6-Me	COOCH ₂ OCH ₂ CH ₂ O <i>n</i> -Bu	O	NMR
3-109	Me	Me	6-Me		O	207-208
3-110	Me	Me	6-Me		O	NMR

Tabla 4

No.	$^1\text{H-NMR}$ δ ppm (Solvent : CDCl_3)
1-27	$^1\text{H NMR}$ (300MHz, CDCl_3): δ ppm =2.22(3H, s), 2.27(3H, s), 3.47(3H, s), 3.73(3H, s), 7.03(1H, d, J = 2.4Hz), 7.13(1H, dd, J = 2.4Hz, J = 8.4Hz), 7.34(1H, d, J = 8.1Hz), 7.95(1H, d, J = 2.1Hz), 8.23(1H, dd, J = 0.9Hz, J = 2.1Hz)。
1-28	$^1\text{H NMR}$ (300MHz, CDCl_3): δ ppm =2.22(3H, t, J = 7.5Hz), 2.26(3H, s), 2.46-2.65(2H, m), 3.49(3H, s), 3.74(3H, s), 7.00(1H, d, J = 2.4 Hz), 7.19(1H, dd, J = 2.7Hz, J = 8.4Hz), 7.40(1H, d, J = 8.4Hz), 7.95(1H, dd, J = 0.6Hz, J = 2.1Hz), 8.23(1H, dd, J = 0.9Hz, J = 1.8Hz)。
1-29	$^1\text{H NMR}$ (300MHz, CDCl_3): δ ppm =1.96(3H, s), 2.29(3H, s), 3.44(3H, s), 3.68(3H, s), 7.14-7.20(2H, m), 7.32(1H, dd, J = 0.6Hz, J = 8.1Hz), 7.98(1H, dd, J = 0.3Hz, J = 2.1Hz), 8.21(1H, dd, J = 0.9Hz, J = 2.1Hz)。
1-32	$^1\text{H NMR}$ (300MHz, CDCl_3): δ ppm =2.24(3H, s), 2.30(3H, s), 3.53(3H, s), 3.73(3H, s), 7.36-7.38(2H, m), 7.48(1H, dd, J = 2.1Hz, J = 8.4Hz), 7.76(1H, dd, J = 0.6Hz, J = 2.1Hz), 8.33(1H, dd, J = 0.9Hz, J = 1.8Hz)。
1-40	$^1\text{H NMR}$ (300MHz, CDCl_3): δ ppm =2.07(3H, s), 2.21(3H, s), 2.25(3H, s), 3.82(3H, s), 6.89(1H, d, J = 2.4Hz), 7.11(1H, dd, J = 2.7Hz, J = 8.4Hz), 7.33(1H, d, J = 8.4Hz), 7.96(1H, d, J = 2.1Hz), 8.21(1H, dd, J = 0.9Hz, J = 2.1Hz)。
1-41	$^1\text{H NMR}$ (300MHz, CDCl_3): δ ppm =1.26(3H, t, J = 7.2Hz), 2.22(3H, s), 2.31(3H, s), 3.82(3H, s), 4.12(2H, q, J = 7.2Hz), 6.95(1H, d, J = 2.7Hz), 7.13(1H, dd, J = 2.4Hz, J = 8.4Hz), 7.33(1H, d, J = 8.4 Hz), 7.95(1H, d, J = 2.1Hz), 8.23(1H, dd, J = 1.2Hz, J = 2.4Hz)。
1-59	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.33(9H, s), 2.21(3H, s), 2.29(3H, s), 3.80(3H, s), 6.94(1H, d, J = 3.0Hz), 7.10(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.31(1H, d, J = 8.5Hz), 7.93(1H, d, J = 2.5Hz), 8.22(1H, d, J = 1.0Hz)。
1-98	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.24(3H, t, J = 7.5Hz), 2.20(3H, s), 2.68(2H, q, J = 7.5Hz), 3.74(3H, s), 6.68(1H, br.s), 7.00(1H, d, J = 2.5Hz), 7.13(1H, d, J = 8.0Hz), 7.40(1H, d, J = 8.0Hz), 7.97(1H, d, J = 2.0Hz), 8.19(1H, s)。
1-100	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.21(3H, t, J = 7.5Hz), 2.23(3H, s), 2.64(3H, s), 3.45(3H, s), 7.03(1H, d, J = 3.0Hz), 7.12(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.33(1H, d, J = 8.5Hz), 7.94(1H, d, J = 1.5 Hz), 8.22(1H, s)。
1-130	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.27-1.30(3H, m), 2.14-2.25(3H, m), 2.26-2.34(3H, m), 3.60-3.76(6H, m), 5.65-5.83(1H, m), 6.92-7.20(2H, m), 7.35-7.39(1H, m), 7.95(1H, br.s), 8.17-8.22(1H, m)。

Tabla 4 (Continuación)

No.	$^1\text{H-NMR}$ δ ppm (Solvent : CDCl_3)
1-131	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.22-1.36(6H, m), 2.15-2.25(3H, m), 2.26-2.35(3H, m), 3.74-3.76(3H, m), 4.10-4.19(2H, m), 5.65-5.84(1H, m), 6.92-7.20(2H, m), 7.34-7.39(1H, m), 7.94(1H, br.s), 8.17-8.19(1H, m)。
1-132	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.23(3H, s), 2.34(3H, s), 3.31(3H, s), 3.75(3H, s), 4.60(1H, d, J = 6.0Hz), 4.71(1H, d, J = 6.5Hz), 7.01(1H, d, J = 2.5Hz), 7.10(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.33(1H, d, J = 8.5Hz), 7.94(1H, d, J = 2.5Hz), 8.20(1H, s)。
1-133	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.22-1.29(9H, m), 2.15-2.24(3H, m), 2.26-2.36(3H, m), 3.74-3.76(6H, m), 4.71-4.83(1H, m), 5.64-5.86(1H, m), 6.92-7.20(2H, m), 7.35-7.39(1H, m), 7.94(1H, br.s), 8.17(1H, br.s)。
1-135	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 0.81(3H, t, J = 7.5Hz), 1.11-1.19(2H, m), 1.36-1.45(2H, m), 2.19(3H, s), 2.23(3H, s), 2.25-2.32(2H, m), 3.80(3H, s), 6.88(1H, d, J = 3.0Hz), 7.10(1H, m), 7.31(1H, d, J = 8.5Hz), 7.94(1H, d, J = 1.5Hz), 8.19(1H, d, J = 1.0Hz)。
1-136	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.22(3H, s), 2.24-2.26(6H, m), 3.81(3H, s), 3.83(3H, s), 6.91(1H, d, J = 3.0Hz), 7.03(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.28(1H, d, J = 9.0Hz), 7.74(1H, s), 7.91-7.94(2H, m)。
1-137	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.23(3H, t, J = 7.5Hz), 2.04(3H, s), 2.20(3H, s), 2.56(2H, q, J = 7.5Hz), 3.82(3H, s), 6.88(1H, s), 7.09(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.0Hz), 7.32(1H, d, J = 8.5Hz), 7.94(1H, d, J = 2.5Hz), 8.19(1H, s)。
1-138	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.26(3H, m), 2.23(3H, s), 2.71(2H, m), 3.32(3H, s), 3.76(3H, s), 4.58(1H, d, J = 5.5Hz), 4.69(1H, d, J = 6.0Hz), 7.02(1H, s), 7.10(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.33(1H, d, J = 8.5Hz), 7.94(1H, d, J = 2.5Hz), 8.21(1H, s)。
1-139	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.15-1.29(6H, m), 2.14-2.34(3H, m), 2.53-2.73(2H, m), 3.69-3.72(3H, m), 3.75-3.77(3H, m), 5.66-5.84(1H, m), 6.92-7.21(2H, m), 7.34-7.39(1H, m), 7.94-7.95(1H, m), 8.17-8.20(1H, m)。
1-140	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.25(3H, s), 3.51(3H, s), 3.82(3H, s), 7.06(1H, d, J = 2.5Hz), 7.18(1H, d, J = 8.5Hz), 7.37(1H, d, J = 8.5Hz), 7.96(1H, d, J = 2.0Hz), 8.22(1H, s)。
1-141	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.23(3H, s), 3.83(3H, s), 7.02(1H, d, J = 3.0Hz), 7.17(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.45(1H, d, J = 8.5Hz), 7.99-8.00(2H, m), 8.17(1H, d, J = 1.5Hz)。
1-142	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.05(3H, s), 2.22(3H, s), 3.90(3H, s), 6.93(1H, d, J = 2.5Hz), 7.13(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.34(1H, d, J = 8.5Hz), 7.96(1H, d, J = 2.0Hz), 8.19(1H, s)。

Tabla 4 (Continuación)

No.	$^1\text{H-NMR}$ δ ppm (Solvent : CDCl_3)
1-147	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.17(3H, s), 2.26(3H, s), 3.44(3H, s), 3.47(3H, s), 3.71(3H, s), 6.87(1H, d, J = 2.5Hz), 6.99(1H, d, J = 2.0Hz, J = 8.0Hz), 7.22(1H, d, J = 8.0Hz), 7.66(1H, d, J = 2.0Hz), 8.45(1H, s)。
1-148	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.18(3H, s), 2.29(3H, s), 3.45(3H, s), 3.76(3H, s), 7.20(1H, br.s), 7.25-7.38(2H, m), 7.67-7.74(2H, m), 8.34(1H, d, J = 1.0Hz)。
1-162	^1H NMR (300MHz, CDCl_3): δ ppm = 3.74(3H, s), 7.19-7.26(2H, m), 7.42(1H, dd, J = 1.2Hz, J = 7.5Hz), 7.72(1H, s), 8.00(1H, d, J = 2.1Hz), 8.09(1H, dd, J = 1.2Hz, J = 2.1Hz)。
1-170	^1H NMR (300MHz, CDCl_3): δ ppm = 0.55-0.58(4H, m), 1.33-1.41(1H, m), 2.10(3H, s), 2.22(3H, s), 4.03-4.16(2H, m), 6.94(1H, d, J = 2.7Hz), 7.11(1H, dd, J = 2.1Hz, J = 8.4Hz), 7.34(1H, d, J = 8.4Hz), 7.76(1H, s), 7.96(1H, d, J = 2.1Hz), 8.22(1H, dd, J = 1.2Hz, J = 2.1Hz)。
1-171	^1H NMR (300MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.21(3H, t, J = 8.4Hz), 2.15(3H, s), 2.40-2.60(2H, m), 3.82(3H, s), 6.88(1H, d, J = 2.7Hz), 7.18(1H, dd, J = 2.1Hz, J = 8.4Hz), 7.40(1H, d, J = 8.4Hz), 7.75(1H, s), 7.96(1H, d, J = 2.1Hz), 8.23(1H, dd, J = 1.2Hz, J = 2.1Hz)。
1-176	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.07(3H, s), 2.20(3H, s), 3.50(3H, s), 5.46-5.50(2H, m), 6.90(1H, s), 7.11(1H, dd, J = 2.1Hz, J = 8.4Hz), 7.32(1H, d, J = 8.4Hz), 7.79(1H, s), 7.95(1H, s), 8.20(1H, s)。
1-181	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.40(3H, t, J = 8.4Hz), 2.09(3H, s), 2.20(3H, s), 4.20-4.32(2H, m), 6.91(1H, s), 7.12(1H, dd, J = 2.1Hz, J = 8.4Hz), 7.33(1H, d, J = 8.4Hz), 7.75(1H, s), 7.95(1H, s), 8.20(1H, s)。
1-182	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.07(3H, s), 2.20(3H, s), 3.37(3H, s), 3.78-3.81(2H, m), 4.38-4.45(2H, m), 6.90(1H, s), 7.11(1H, dd, J = 2.1Hz, J = 8.4Hz), 7.34(1H, d, J = 8.4Hz), 7.77(1H, s), 7.95(1H, s), 8.20(1H, s)。
1-185	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.18(3H, s), 3.76(3H, s), 3.88(3H, s), 4.83-4.95(2H, m), 7.01(1H, s), 7.11(1H, d, J = 8.0Hz), 7.31(1H, d, J = 8.0Hz), 7.91(1H, s), 7.95(1H, s), 8.25(1H, s)。
1-187	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.10(3H, s), 2.21(3H, s), 2.30(3H, s), 5.20(1H, d, J = 13.0Hz), 5.27(1H, d, J = 13.0Hz), 6.90(1H, s), 7.11(1H, d, J = 8.0Hz), 7.33(1H, d, J = 8.0Hz), 7.78(1H, s), 7.96(1H, s), 8.20(1H, s)。

Tabla 4 (Continuación)

No.	$^1\text{H-NMR}$ δ ppm (Solvent : CDCl_3)
2-5	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.22(3H, s), 2.32(3H, s), 3.75(3H, s), 6.59(1H, br.s), 7.02(1H, d, J = 2.5Hz), 7.17(1H, dd, J = 2.5 Hz, J = 8.0Hz), 7.43(1H, d, J = 8.5Hz), 7.69(1H, d, J = 8.5Hz), 8.12(1H, s)。
2-8	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.22(3H, s), 2.32(3H, s), 3.74(3H, s), 7.17(1H, br.s), 7.22-7.24(2H, m), 7.31-7.34(2H, m,) 7.42-7.45(2H, m)。
2-10	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.21(3H, s), 2.31(3H, s), 3.73(3H, s), 7.17(1H, d, J = 3.0Hz), 7.25-7.26(2H, m), 7.30-7.33(1H, m) 7.40(1H, d, J = 8.0Hz), 7.50(1H, d, J = 8.5Hz), 7.64(1H, d, J = 1.0 Hz)。
2-11	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.18(3H, s), 2.32(3H, s), 3.74(3H, s), 5.54(1H, br.s), 6.90(1H, d, J = 2.5Hz), 7.04-7.08(2H, m), 7.36-7.40(2H, m), 7.45(1H, dd, J = 2.0Hz, J = 10.0Hz)。
2-13	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.17(3H, s), 2.31(3H, s), 3.72(3H, s), 5.73(1H, br.s), 6.86(1H, d, J = 3.0Hz), 7.00-7.04(2H, m), 7.36(1H, d, J = 8.0Hz), 7.40-7.44(1H, m), 7.69(1H, d, J = 2.5Hz)。
2-14	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.20(3H, s), 2.30(3H, s), 3.74(3H, s), 6.97(1H, s), 7.11(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.18(1H, br.s), 7.39(1H, d, J = 8.5Hz), 7.52(1H, dd, J = 1.5Hz, J = 9.0Hz), 7.78(1H, s)。
2-61	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.06(3H, s), 2.19(3H, s), 2.24(3H, s), 3.80(3H, s), 6.86(1H, d, J = 3.0Hz), 6.98(1H, d, J = 8.5Hz), 7.08(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.31(1H, d, J = 8.0Hz), 7.86(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 8.38(1H, s)。
2-86	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.23(3H, s), 2.32(3H, s), 3.76(3H, s), 6.59(1H, br.s), 7.03(1H, d, J = 2.5Hz), 7.16-7.20(1H, m,) 7.44(1H, d, J = 8.5Hz), 8.23(1H, d, J = 2.0Hz), 8.39(1H, d, J = 2.0Hz), 9.94(1H, s)。
2-88	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.16(3H, s), 2.31(3H, s), 3.73(3H, s), 5.76(1H, br.s), 6.87(1H, d, J = 3.0Hz), 7.01-7.06(3H, m), 7.35(1H, d, J = 9.0Hz), 7.53-7.55(2H, m)。
2-89	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.25(3H, t, J = 7.5Hz), 2.23(3H, s), 2.69(2H, q, J = 7.5Hz), 3.75(3H, s), 7.21-7.24(2H, m), 7.30-7.33(2H, m), 7.43-7.45(2H, m)。
2-91	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.21(3H, s), 2.31(3H, s), 3.74(3H, s), 6.57(1H, br.s), 7.01(1H, d, J = 2.5Hz), 7.15(1H, dd, J = 2.5 Hz, J = 8.0Hz), 7.40(1H, d, J = 8.0Hz), 8.46(2H, s)。

Tabla 4 (Continuación)

No.	$^1\text{H-NMR}$ δ ppm (Solvent : CDCl_3)
2-100	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.17(3H, s), 2.29(3H, s), 3.70(3H, s), 6.19(1H, br.s), 6.98(1H, d, J = 3.0Hz), 7.05-7.07(1H, m), 7.38(1H, d, J = 8.0Hz), 7.87(1H, s), 8.41(1H, s)。
2-103	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.24(3H, s), 2.30(3H, s), 3.74(3H, s), 7.04(1H, d, J = 2.0Hz), 7.13(1H, d, J = 8.0Hz), 7.42-7.44(2H, m), 7.84(1H, d, J = 9.5Hz)。
2-104	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.28(3H, s), 2.31(3H, s), 3.74(3H, s), 7.19(1H, d, J = 3.0Hz), 7.23-7.28(3H, m), 7.35-7.39(1H, m), 7.41-7.44(2H, m)。
2-105	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.22(3H, s), 2.31(3H, s), 3.74(3H, s), 7.18-7.22(2H, m), 7.25-7.30(1H, m), 7.33-7.37(2H, m), 7.42(1H, d, J = 8.5Hz), 7.98(1H, br.s)。
2-112	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.05(3H, s), 2.38(3H, s), 3.74(3H, s), 6.76(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 6.94(1H, d, J = 8.5Hz), 7.00(1H, d, J = 3.0Hz), 7.51-7.54(1H, m), 7.61-7.64(1H, m), 7.66-7.69(2H, m), 8.01(1H, d, J = 8.0Hz), 8.22(1H, d, J = 3.0Hz)。
2-115	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.06(3H, s), 2.20(3H, s), 2.24(3H, s), 3.80(3H, s), 6.87(1H, d, J = 2.5Hz), 7.09(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.32(1H, d, J = 8.5Hz), 8.11(1H, d, J = 2.0Hz), 8.23(1H, s)。
2-116	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.05(3H, s), 2.20(3H, s), 2.25(3H, s), 3.80(3H, s), 6.89(1H, d, J = 3.0Hz), 7.10(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.33(1H, d, J = 8.5Hz), 8.17(1H, d, J = 1.5Hz), 8.47(1H, s)。
2-117	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.98(3H, s), 2.18(3H, s), 2.24(3H, s), 3.80(3H, s), 6.89(1H, d, J = 2.5Hz), 7.10(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.28-7.32(2H, m), 7.87(1H, d, J = 8.0Hz)。
2-118	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.03(3H, s), 2.17(3H, s), 2.37(3H, s), 3.80(3H, s), 6.79(1H, d, J = 2.5Hz), 6.98-7.05(3H, m), 7.25-7.30(1H, m), 7.52-7.55(2H, m)。
2-120	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.02(3H, s), 2.17(3H, s), 2.24(3H, s), 3.80(3H, s), 6.76(1H, d, J = 2.5Hz), 6.96-7.02(2H, m), 7.29(1H, d, J = 8.5Hz), 7.35(1H, d, J = 8.5Hz), 7.44(1H, dd, J = 2.0Hz, J = 10.0Hz)。
2-125	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.05(3H, s), 2.19(3H, s), 2.24(3H, s), 3.80(3H, s), 6.85(1H, d, J = 2.5Hz), 7.08(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.0Hz), 7.30(1H, d, J = 8.0Hz), 7.93(1H, d, J = 3.0Hz), 8.15(1H, d, J = 3.0Hz)。
2-126	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.05(3H, s), 2.20(3H, s), 2.25(3H, s), 3.81(3H, s), 6.87(1H, d, J = 3.0Hz), 7.08(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.0Hz), 7.32-7.34(2H, m), 8.53(1H, s)。

Tabla 4 (Continuación)

No.	^1H -NMR δ ppm (Solvent : CDCl_3)
2-129	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.07(3H, s), 2.17(3H, s), 2.24(3H, s), 2.29(3H, s), 3.80(3H, s), 6.78(1H, d, J = 2.5Hz), 7.03(1H, d, J = 2.0Hz, J = 8.5Hz), 7.27(1H, d, J = 8.0Hz), 7.60(1H, d, J = 2.0Hz), 7.92(1H, d, J = 2.0Hz)。
2-133	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.06(3H, s), 2.21(3H, s), 2.25(3H, s), 3.81(3H, s), 6.89(1H, d, J = 2.0Hz), 7.10(1H, dd, J = 2.0Hz, J = 8.5Hz), 7.34(1H, d, J = 8.5Hz), 8.54(1H, d, J = 2.5Hz), 8.81(1H, d, J = 2.5Hz)。
2-134	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.04(3H, s), 2.20(3H, s), 2.27(3H, s), 3.80(3H, s), 6.83(1H, d, J = 2.5Hz), 7.07(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.35(1H, d, J = 8.0Hz), 7.90(1H, s), 8.35(1H, s)。
2-135	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.05(3H, s), 2.17(3H, s), 2.24(3H, s), 3.80(3H, s), 6.84(1H, d, J = 2.0Hz), 7.07(1H, dd, J = 2.0Hz, J = 8.0Hz), 7.29(1H, d, J = 8.0Hz), 7.86(1H, d, J = 2.5Hz), 7.98(1H, d, J = 2.5Hz)。
2-149	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.24(3H, s), 2.34(3H, s), 3.31(3H, s), 3.47(3H, s), 3.74(3H, s), 4.58-4.61(1H, m), 4.70-4.73(1H, m), 5.17(2H, s), 6.99-7.03(1H, m), 7.10-7.15(1H, m), 7.30-7.36(1H, m), 7.94(1H, s), 8.08(1H, s), 8.15(1H, m)。
2-160	^1H NMR (300MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.21(3H, t, J = 8.4Hz), 2.16(3H, s), 2.62-2.39(2H, m), 3.85(3H, s), 7.11(1H, s), 7.23-7.27(1H, m), 7.35-7.44(4H, m), 7.77(1H, s)。
2-164	^1H NMR (300MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.13(3H, s), 2.26(3H, s), 3.85(3H, s), 7.15(1H, s), 7.22-7.26 (1H, m), 7.26-7.37(3H, m), 7.44(1H, d, J = 2.1Hz), 7.77(1H, s)。
2-172	^1H NMR (300MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.39-1.43(6H, m), 2.08(3H, s), 2.20(3H, s), 5.32(1H, q, J = 6.6Hz), 7.15(1H, s), 7.22-7.37(4H, m), 7.41(1H, d, J = 2.1Hz), 7.82(1H, s)。
2-190	^1H NMR (300MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.15-1.28(9H, m), 2.06(3H, s), 2.24(3H, s), 2.38-2.60(2H, m), 3.36-3.50(4H, m), 3.81(3H, s), 6.84(1H, d, J = 2.7Hz), 7.17(1H, dd, J = 2.7Hz, J = 8.7Hz), 7.38(1H, d, J = 8.7Hz), 7.81(1H, d, J = 1.8Hz), 8.01(1H, d, J = 2.4Hz)。
2-193	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.21(3H, s), 2.32(3H, s), 3.73(3H, s), 6.88(1H, d, J = 10.0Hz), 7.01(1H, d, J = 2.5Hz), 7.12(1H, dd, J = 2.3Hz, J = 8.3Hz), 7.36(1H, d, J = 8.5Hz), 7.54(1H, s), 7.74(1H, d, J = 10.0Hz)。
2-194	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.23(3H, s), 2.32(3H, s), 3.75(3H, s), 6.42(1H, brs), 7.02(1H, d, J = 3.0Hz), 7.15(1H, dd, J = 2.3Hz, J = 8.3Hz), 7.44(1H, d, J = 7.0Hz), 8.37(1H, s), 8.53(1H, s)。

Tabla 4 (Continuación)

No.	$^1\text{H-NMR}$ δ ppm (Solvent : CDCl_3)
2-195	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.05(3H, s), 2.20(3H, s), 2.20(3H, s), 3.81(3H, s), 6.89(1H, d, J = 2.5Hz), 7.10(1H, dd, J = 2.3Hz, J = 7.5Hz), 7.34(1H, d, J = 8.0Hz), 8.38(1H, s), 8.46(1H, s)。
2-198	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.25(3H, s), 2.32(3H, s), 3.76(3H, s), 6.26(1H, brs), 7.13(1H, d, J = 3.0Hz), 7.46(1H, d, J = 8.5Hz, J = 8.3Hz), 7.70(1H, d, J = 8.5Hz), 8.05(1H, d, J = 8.0Hz), 9.40(1H, s)。
3-27	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.26(6H, br.s), 3.55(3H, s), 3.76(3H, s), 7.10(1H, d, J = 2.5Hz), 7.18-7.21(1H, m), 7.35-7.37(1H, m), 7.58-7.59(2H, m), 8.04(1H, s), 8.68(1H, s)。
3-35	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.14(3H, t, J = 7.5Hz), 2.23(3H, s), 2.36(3H, s), 3.82(3H, s), 4.11(2H, m), 7.06(1H, d, J = 2.5Hz), 7.22(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.34(1H, d, J = 8.0Hz), 7.60(1H, dd, J = 2.0Hz, J = 8.5Hz), 7.73(1H, d, J = 9.5Hz), 8.03(1H, d, J = 2.5Hz), 8.65(1H, s)。
3-37	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 0.78-0.92(4H, m), 1.59-1.63(1H, m), 2.21(3H, s), 2.25(3H, s), 3.80(3H, s), 7.00(1H, d, J = 3.0Hz), 7.21(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.34(1H, d, J = 8.5Hz), 7.59(1H, dd, J = 2.0Hz, J = 9.5Hz), 7.70(1H, d, J = 8.5Hz), 8.03(1H, d, J = 2.5Hz), 8.65(1H, s)。
3-39	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.22(3H, s), 2.30(3H, s), 3.31-3.46(4H, m), 3.81(3H, s), 7.06(1H, br.s), 7.23-7.25(1H, m), 7.34(1H, d, J = 8.5Hz), 7.60(1H, dd, J = 2.0Hz, J = 9.0Hz), 7.72(1H, d, J = 9.0Hz), 8.04(1H, d, J = 2.0Hz), 8.65(1H, s)。
3-40	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.26(3H, s), 2.34(3H, s), 3.34(3H, s), 3.75(3H, s), 4.63(1H, d, J = 5.5Hz), 4.85(1H, d, J = 5.5Hz), 7.09(1H, d, J = 2.5Hz), 7.18(1H, dd, J = 2.0Hz, J = 8.0Hz), 7.36(1H, d, J = 8.5Hz), 7.57-7.63(2H, m), 8.03(1H, d, J = 2.0Hz), 8.68(1H, s)。
3-43	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.24(3H, s), 2.26(3H, s), 2.27(3H, s), 3.75(3H, s), 3.83(3H, s), 7.04(1H, d, J = 2.0Hz), 7.12(1H, d, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.29(1H, d, J = 8.5Hz), 7.52(1H, d, J = 9.0Hz), 7.56-7.59(1H, m), 7.74(1H, s), 8.02(1H, d, J = 2.5Hz), 8.58(1H, s)。
3-44	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.09-1.31(3H, m), 2.17-2.25(3H, m), 2.26-2.37(3H, m), 3.66-3.77(6H, m), 5.67-5.93(1H, m), 7.02-7.31(2H, m), 7.36-7.42(1H, m), 7.54-7.59(2H, m), 8.04(1H, d, J = 1.0 Hz), 8.68(1H, s)。

Tabla 4 (Continuación)

No.	¹ H-NMR δ ppm (Solvent : CDCl ₃)
3-46	¹ H NMR (500MHz, CDCl ₃): δ ppm = 2.21(3H, s), 2.26(3H, s), 2.38-2.49(2H,m), 2.60(2H, br.t, J = 6.5Hz), 3.62(3H, s), 3.81(3H, s), 6.98(1H, d, J = 3.0Hz), 7.18-7.21(1H, m), 7.34(1H, d, J = 8.5Hz), 7.59(1H, d, J = 9.0Hz), 7.66(1H, d, J = 9.0Hz), 8.04(1H, d, J = 2.5Hz), 8.67(1H, s)。
3-47	¹ H NMR (500MHz, CDCl ₃): δ ppm = 2.13(6H, s), 3.58(1H, d, J = 15.0Hz), 3.64(1H, d, J = 15.0Hz), 3.79(3H, s), 6.99-7.01(3H, m), 7.19-7.30(5H, m), 7.49-7.55(2H, m), 8.03(1H, d, J = 1.5Hz), 8.67(1H, s)。
3-48	¹ H NMR (500MHz, CDCl ₃): δ ppm = 2.20(3H, s), 2.24(3H, s), 3.82(3H, s), 4.64(2H, s), 6.57-6.59(2H, m), 6.96(1H, t, J = 8.0Hz), 7.04(1H, d, J = 2.0Hz), 7.18-7.25(3H, m), 7.39(1H, d, J = 8.0Hz), 7.44-7.48(2H, m), 8.01(1H, d, J = 1.5Hz), 8.68(1H, s)。
3-49	¹ H NMR (500MHz, CDCl ₃): δ ppm = 2.23(3H, s), 2.24(3H, s), 3.82(3H, s), 5.90(1H, d, J = 11.0Hz), 6.06(1H, dd, J = 11.0Hz, J = 17.0 Hz), 6.40(1H, d, J = 17.0Hz), 7.00(1H, d, J = 2.5Hz), 7.18(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.0Hz), 7.32(1H, d, J = 8.5Hz), 7.59(1H, dd, J = 2.5 Hz, J = 9.0Hz), 7.68(1H, d, J = 9.0Hz), 8.03(1H, d, J = 1.5Hz), 8.63(1H, s)。
3-52	¹ H NMR (500MHz, CDCl ₃): δ ppm = 2.22(3H, s), 2.29(3H, s), 3.85(3H, s), 7.00(1H, d, J = 2.0Hz), 7.23(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.0Hz), 7.36(1H, d, J = 8.5Hz), 7.60(1H, dd, J = 2.0Hz, J = 9.0Hz), 7.67(1H, d, J = 9.0Hz), 8.03(1H, d, J = 2.5Hz), 8.67(1H, s)。
3-54	¹ H NMR (500MHz, CDCl ₃): δ ppm = 2.23(3H, s), 2.26(3H, s), 3.82(3H, s), 6.15(1H, d, J = 9.0Hz), 6.75(1H, d, J = 9.0Hz), 7.01(1H, d, J = 2.0Hz), 7.19(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.33(1H, d, J = 8.5 Hz), 7.59(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 9.0Hz), 7.68(1H, d, J = 9.0Hz), 8.03(1H, d, J = 2.0Hz), 8.64(1H, s)。
3-55	¹ H NMR (500MHz, CDCl ₃): δ ppm = 2.22(3H, s), 2.30(3H, s), 3.27(3H, s), 3.43-3.47(2H, m), 3.81(3H, s), 4.18-4.22(2H, m), 7.07(1H, d, J = 2.5Hz), 7.23(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.34(1H, d, J = 8.5Hz), 7.60(1H, dd, J = 2.0Hz, J = 9.0Hz), 7.74(1H, d, J = 8.5Hz), 8.03(1H, d, J = 2.0Hz), 8.65(1H, s)。
3-56	¹ H NMR (500MHz, CDCl ₃): δ ppm = 0.84(3H, t, J = 7.5Hz), 1.44-1.51(2H, m), 2.22(3H, s), 2.28(3H, s), 2.66-2.75(2H, m), 3.81(3H, s), 7.04(1H, d, J = 2.5Hz), 7.22(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.33(1H, d, J = 8.5Hz), 7.59(1H, dd, J = 2.0Hz, J = 8.5Hz), 7.74(1H, d, J = 9.0Hz), 8.03(1H, d, J = 2.0Hz), 8.65(1H, s)。

Tabla 4 (Continuación)

No.	^1H -NMR δ ppm (Solvent : CDCl_3)
3-57	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.24(3H, s), 2.38(3H, s), 3.83(3H, s), 6.81-6.84(2H, m), 6.89-6.99(2H, m), 7.13(1H, d, J = 2.5Hz), 7.28(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.39(1H, d, J = 8.5Hz), 7.48(2H, br.s), 8.02(1H, s), 8.67(1H, s)。
3-58	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.22(3H, s), 2.30(3H, s), 3.81(3H, s), 4.49-4.56(2H, m), 5.15-5.18(2H, m), 5.67-5.76(1H, m), 7.06(1H, d, J = 2.5Hz), 7.23(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.34(1H, d, J = 8.0Hz), 7.59(1H, d, J = 9.0Hz), 7.72(1H, d, J = 8.5Hz), 8.03(1H, d, J = 2.5Hz), 8.65(1H, s)。
3-59	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.23(3H, s), 2.32(3H, s), 3.46-3.52(2H, m), 3.82(3H, s), 4.28(2H, t, J = 5.5Hz), 7.07(1H, d, J = 2.5Hz), 7.23-7.25(1H, m), 7.35(1H, d, J = 8.5Hz), 7.60(1H, dd, J = 2.0Hz, J = 9.0Hz), 7.73(1H, d, J = 8.5Hz), 8.04(1H, d, J = 2.0Hz), 8.65(1H, s)。
3-60	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.11(3H, d, J = 6.0Hz), 1.14(3H, d, J = 6.5Hz), 2.23(3H, s), 2.31(3H, s), 3.81(3H, s), 4.70-4.78(1H, m), 7.07(1H, d, J = 2.0Hz), 7.22(1H, dd, J = 3.0Hz, J = 8.0Hz), 7.33(1H, d, J = 8.5Hz), 7.59(1H, dd, J = 2.0Hz, J = 8.5Hz), 7.73(1H, d, J = 8.5Hz), 8.03(1H, d, J = 2.0Hz), 8.64(1H, s)。
3-61	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 0.59-0.98(13H, m), 1.23-1.39(2H, m), 1.51-1.86(3H, m), 2.22-2.23(3H, m), 2.30(3H, s), 3.82(3H, s), 4.37-4.45(1H, m), 7.07-7.11(1H, m), 7.20-7.25(1H, m), 7.32(1H, d, J = 8.0Hz), 7.57-7.61(1H, m), 7.75(1H, d, J = 9.0Hz), 8.03(1H, d, J = 2.5Hz), 8.64(1H, s)。
3-62	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.25(3H, s), 2.30(3H, s), 3.84(3H, s), 6.83-6.85(2H, m), 7.15(1H, d, J = 2.0Hz), 7.23-7.30(4H, m), 7.38(1H, d, J = 8.5Hz), 7.47(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.53(1H, d, J = 8.5Hz), 8.02(1H, d, J = 2.5Hz), 8.68(1H, s)。
3-63	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.04(3H, s), 2.24(3H, s), 3.80(3H, s), 6.96(1H, br.s), 7.26-7.38(6H, m), 7.40-7.44(1H, m), 7.54(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 9.0Hz), 7.66(1H, d, J = 9.0Hz), 8.04(1H, d, J = 2.5Hz), 8.70(1H, s)。
3-64	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.23(3H, s), 2.31(3H, s), 2.50(1H, t, J = 2.5Hz), 3.82(3H, s), 4.57-4.64(2H, m), 7.05(1H, d, J = 3.0Hz), 7.22(1H, d, J = 8.0Hz), 7.34(1H, d, J = 8.5Hz), 7.60(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.74(1H, d, J = 9.0Hz), 8.03(1H, d, J = 2.5Hz), 8.65(1H, s)。

Tabla 4 (Continuación)

No.	^1H -NMR δ ppm (Solvent : CDCl_3)
3-65	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.23(3H, s), 2.28(3H, s), 2.76(3H, s), 2.77(3H, s), 3.80(3H, s), 7.05(1H, d, J = 2.0Hz), 7.20(1H, d, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.33(1H, d, J = 8.5Hz), 7.60(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 9.0Hz), 7.68(1H, d, J = 9.0Hz), 8.04(1H, d, J = 2.0Hz), 8.64(1H, s)。
3-67	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.20-2.33(6H, m), 2.97-3.03(3H, m), 3.13-3.24(3H, m), 3.81-3.83(3H, m), 6.96-7.33(3H, m), 7.58-7.73(2H, m), 8.04-8.05(1H, m), 8.64-8.65(1H, m)。
3-71	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.98(3H, s), 2.40(3H, s), 2.53(3H, s), 3.78(3H, s), 6.98(1H, d, J = 8.0Hz), 7.06-7.12(4H, m), 7.50-7.52(2H, m), 7.58(1H, dd, J = 2.0Hz, J = 8.5Hz), 7.69(1H, d, J = 9.0Hz), 8.05(1H, d, J = 2.0Hz), 8.66(1H, s)。
3-75	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.26(3H, s), 2.33(3H, s), 3.33(3H, s), 3.47(2H, t, J = 4.0Hz), 3.60-3.67(2H, m), 3.75(3H, s), 4.72(1H, d, J = 6.0Hz), 4.93(1H, d, J = 6.0Hz), 7.09(1H, br.s), 7.17-7.19(1H, m), 7.35(1H, d, J = 8.5Hz), 7.56-7.59(1H, m), 7.66(1H, d, J = 9.0Hz), 8.03(1H, d, J = 2.5Hz), 8.67(1H, s)。
3-76	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.17-1.55(9H, m), 1.67-1.91(4H, m), 2.16-2.23(3H, m), 2.25-2.38(3H, m), 3.74-3.76(3H, m), 4.39-4.57(1H, m), 5.67-5.96(1H, m), 7.01-7.25(2H, m), 7.31-7.41(1H, m), 7.53-7.58(2H, m), 8.03-8.04(1H, m), 8.67-8.68(1H, m)。
3-79	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.27(3H, t, J = 7.0Hz), 2.24(3H, s), 2.29(3H, s), 3.83(3H, s), 4.22-4.34(2H, m), 7.05(1H, d, J = 2.5Hz), 7.22(1H, dd, J = 2.0Hz, J = 9.0Hz), 7.34(1H, d, J = 8.5Hz), 7.60(1H, dd, J = 2.0Hz, J = 9.0Hz), 7.75(1H, d, J = 8.5Hz), 8.03(1H, d, J = 2.0Hz), 8.64(1H, s)。
3-80	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 0.70-0.82(2H, m), 0.97-1.17(4H, m), 1.38-1.41(2H, m), 1.52-1.58(3H, m), 2.19(2H, dd, J = 2.0Hz, J = 6.5Hz), 2.21(3H, s), 2.23(3H, s), 3.80(3H, s), 7.03(1H, d, J = 2.5Hz), 7.21(1H, dd, J = 2.0Hz, J = 9.0Hz), 7.32(1H, d, J = 8.0Hz), 7.60(1H, dd, J = 2.0Hz, J = 8.5Hz), 7.70(1H, d, J = 9.0Hz), 8.03(1H, d, J = 2.5Hz), 8.65(1H, s)。
3-81	^1H NMR (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.26(3H, s), 2.33(3H, s), 3.52-3.59(2H, m), 3.73(2H, t, J = 6.0Hz), 3.75(3H, s), 4.73(1H, d, J = 6.0Hz), 4.96(1H, d, J = 6.0Hz), 7.10(1H, d, J = 2.5Hz), 7.20(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.37(1H, d, J = 8.5Hz), 7.59(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 9.0Hz), 7.65(1H, d, J = 9.0Hz), 8.04(1H, d, J = 2.0Hz), 8.68(1H, s)。

Tabla 4 (Continuación)

No.	$^1\text{H-NMR}$ δ ppm (Solvent : CDCl_3)
3-82	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.22(3H, s), 2.28(3H, s), 3.00(1H, s), 3.82(3H, s), 7.02(1H, d, J = 2.5Hz), 7.23(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.36(1H, d, J = 8.5Hz), 7.59(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.74(1H, d, J = 9.0Hz), 8.03(1H, d, J = 2.5Hz), 8.66(1H, s)。
3-87	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 1.69-1.73(3H, m), 2.22-2.23(3H, m), 2.31-2.32(3H, m), 3.82-3.83(3H, m), 6.18-6.25(1H, m), 7.04-7.06(1H, m), 7.21-7.24(1H, m), 7.33-7.36(1H, m), 7.59-7.62(1H, m), 7.72-7.76(1H, m), 8.03-8.04(1H, m), 8.64-8.54(1H, m)。
3-90	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.22(3H, s), 2.28(3H, s), 3.48-3.56(2H, m), 3.81(3H, s), 4.18-4.26(2H, m), 4.43(2H, s), 7.08(1H, d, J = 2.5Hz), 7.18-7.33(7H, m), 7.55(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 9.5Hz), 7.72(1H, d, J = 9.5Hz), 8.02(1H, d, J = 2.0Hz), 8.60(1H, s)。
3-98	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.22(3H, s), 2.30(3H, s), 3.33(1H, s), 3.45-3.48(2H, m), 3.50-3.53(2H, m), 3.54-3.57(2H, m), 3.81(3H, s), 4.19-4.22(2H, m), 7.07(1H, d, J = 2.5Hz), 7.21-7.24(1H, m), 7.34(1H, d, J = 8.0Hz), 7.59-7.62(1H, m), 7.74(1H, d, J = 9.0Hz), 8.03(1H, d, J = 2.5Hz), 8.65(1H, s)。
3-99	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.23(3H, s), 2.31(3H, s), 3.72(2H, t, J = 4.5Hz), 3.81(3H, s), 4.00(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 7.0Hz), 4.07-4.11(1H, m), 4.26-4.29(2H, m), 6.34(1H, dd, J = 7.0Hz, J = 14.0Hz), 7.07(1H, d, J = 2.0Hz), 7.22(1H, dd, J = 2.0Hz, J = 8.5Hz), 7.34(1H, d, J = 9.0Hz), 7.59(1H, dd, J = 2.0Hz, J = 9.0Hz), 7.73(1H, d, J = 9.5Hz), 8.03(1H, d, J = 2.5Hz), 8.65(1H, s)。
3-100	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.01(3H, s), 2.23(3H, s), 2.32(3H, s), 2.47-2.59(2H, m), 3.82(3H, s), 4.20(2H, t, J = 7.0Hz), 7.07(1H, d, J = 2.5Hz), 7.23-7.25(1H, m), 7.34(1H, d, J = 8.5Hz), 7.60(1H, dd, J = 2.0Hz, J = 9.5Hz), 7.74(1H, d, J = 9.0Hz), 8.03(1H, d, J = 2.5Hz), 8.65(1H, s)。
3-101	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = [-0.06]-[-0.03](2H, m), 0.34-0.39(2H, m), 0.47-0.55(1H, m), 1.38(2H, q, J = 6.5Hz), 2.23(3H, s), 2.30(3H, s), 3.80(3H, s), 4.10-4.15(2H, m), 7.07(1H, d, J = 2.5Hz), 7.22(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.33(1H, d, J = 8.0Hz), 7.59(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 9.0Hz), 7.74(1H, d, J = 8.5Hz), 8.03(1H, d, J = 2.5Hz), 8.64(1H, s)。
3-102	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 0.78(6H, d, J = 7.5Hz), 1.77-1.85(1H, m), 2.23(3H, s), 2.30(3H, s), 3.81(3H, s), 3.84(2H, d, J = 6.0Hz), 7.07(1H, d, J = 3.0Hz), 7.21-7.24(1H, m), 7.33(1H, d, J = 8.5Hz), 7.59(1H, dd, J = 2.5Hz, J = 8.5Hz), 7.73(1H, d, J = 8.5Hz), 8.03(1H, d, J = 2.0Hz), 8.64(1H, s)。

Tabla 4 (Continuación)

No.	$^1\text{H-NMR}$ δ ppm (Solvent : CDCl_3)
3-105	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.27(3H, s), 2.29(3H, s), 3.84(3H, s), 7.04-7.06(1H, m), 7.08(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.10-7.13(1H, m), 7.28(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.49(1H, d, $J = 9.0\text{Hz}$), 7.54(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.55-7.58(1H, m), 7.77(1H, dd, $J = 1.0\text{Hz}$, $J = 4.0\text{Hz}$), 8.10(1H, d, $J = 2.0\text{Hz}$), 8.58(1H, s)。
3-106	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.27(3H, s), 2.29(3H, s), 3.86(3H, s), 7.07(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.10(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.28(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.29-7.33(1H, m), 7.45(1H, d, $J = 9.5\text{Hz}$), 7.55(1H, dd, $J = 2.0\text{Hz}$, $J = 9.5\text{Hz}$), 8.01(1H, d, $J = 2.0\text{Hz}$), 8.13-8.16(1H, m), 8.59(1H, s), 8.76(1H, dd, $J = 1.5\text{Hz}$, $J = 5.0\text{Hz}$), 9.11(1H, d, $J = 2.0\text{Hz}$)。
3-108	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 0.88(3H, t, $J = 7.0\text{Hz}$), 1.28-1.33(2H, m), 1.48-1.53(2H, m), 2.22(3H, s), 2.25(3H, s), 3.35-3.49(6H, m), 3.82(3H, s), 4.16(2H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.00(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 7.19(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 9.0\text{Hz}$), 7.33(1H, d, $J = 9.0\text{Hz}$), 7.60(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 9.0\text{Hz}$), 7.73(1H, d, $J = 9.0\text{Hz}$), 8.04(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 8.66(1H, s)。
3-110	$^1\text{H NMR}$ (500MHz, CDCl_3): δ ppm = 2.26(3H, s), 2.28(3H, s), 3.84(3H, s), 7.07(1H, d, $J = 2.0\text{Hz}$), 7.11(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.25-7.29(2H, m), 7.39-7.41(1H, m), 7.49(1H, d, $J = 8.5\text{Hz}$), 7.55(1H, dd, $J = 2.5\text{Hz}$, $J = 8.5\text{Hz}$), 8.02(1H, d, $J = 2.5\text{Hz}$), 8.09-8.10(1H, m), 8.59(1H, s)。

5

A continuación se describen ejemplos de prueba de la presente invención.

EJEMPLO DE PRUEBA 1

Se colocó tierra de campo de tierra alta en una maceta de 1/300,000 y se sembraron semillas de diversas plantas. Cuando las respectivas plantas alcanzaron

cierta edad fenológica (leaf stage) ((1)) Pasto dentado (*Echinochloa crus-galli* L.): 0,5 a 2,9 edad fenológica, (2) Pasto cangrejo (*Digitaria sanguinalis* L.): 0,5 a 3,0 edad fenológica, (3) Almorejo (*Setaria viridis* L.): 0,5 a 3,2 edad fenológica, (4) Avena fatua (*Avena fatua* L.): 0,4 a 1,2 edad fenológica, (5) Raigrás italiano (*Lolium multiflorum* Lam.): 0,4 a 2,0 edad fenológica, (6) Abrebujo (*Amaranthus retroflexus* L.): etapa de cotiledón a 2,2, edad fenológica, (7) arroz (*Oryza sativa* L.): 0,2 a 2,7 edad fenológica, (8) maíz (*Zea mays* L.): 1,7 a 3,6 edad fenológica, (9) trigo (*Triticum aestivum* L.): 1,3 a 2,3 edad fenológica, (10) soja (*Glycine max* Merr.): etapa primaria de la hoja) los polvos humectables o los concentrados emulsionables de los compuestos de la presente invención preparados de acuerdo con un método de preparación convencional, se

pesaron para alcanzar las cantidades prescritas del principio activo y se diluyeron con agua en una cantidad correspondiente a 1,000 litros por 1 hectárea (que contenía 0,1 % de volumen de un esparcidor agrícola (tensioactivo WK fabricado por MARUWA

20

5 BIOCHEMICAL Co., Ltd.)), y las soluciones de spray así preparadas se aplicaron para el tratamiento foliar mediante un spray pequeño.

En el día 14, después de la aplicación, se observó visualmente el estado de crecimiento de las plantas respectivas, y se evaluó el efecto herbicida por una tasa de inhibición de crecimiento (%) de 0 (equivalente al área no tratada) a 100 (muerte

10 completa). Los resultados se muestran en la Tabla 5.

Tabla 5

Compuesto	Cantidad de principio activo	Tasa de inhibición de crecimiento (%)									
		Pasto dentado	Pasto cangrejo	Almorejo	Avena fatua	Raigrás italiano	Abrebujo	Arroz	Maíz	Trigo	Soja
No.	g/ha										
1-1	31	100	95	99	98	98	10	80	90	65	0
1-2	31	100	99	99	95	99	0	10	95	20	0
1-3	31	100	99	100	98	98	0	75	99	15	15
1-4	31	99	95	100	99	95	10	20	93	10	35
1-10	31	70	90	90	20	0	0	0	60	0	20
1-13	31	100	95	100	75	70	0	40	88	20	0
1-14	31	98	93	98	95	85	0	80	70	0	0
1-40	31	100	99	100	98	100	40	80	100	93	10
1-41	31	100	99	100	99	100	10	80	98	98	0
1-42	31	100	100	100	100	100	10	88	100	100	10
1-45	31	100	100	100	100	100	10	99	100	99	10
1-46	31	100	100	100	100	99	30	80	98	98	0
1-59	31	100	100	100	99	98	0	40	98	93	0
1-62	31	100	100	100	99	98	0	88	100	90	0
1-65	31	99	100	100	98	98	0	60	98	10	0
1-95	31	100	100	100	99	95	0	80	100	45	0
1-98	31	88	30	60	65	78	0	0	80	20	10

1-130	31	100	99	99	98	93	0	30	95	80	0
1-131	31	100	100	93	93	83	0	30	80	60	0
1-132	31	100	100	100	98	98	0	88	99	98	20
1-133	31	88	0	30	40	0	0	0	0	0	0
1-134	31	98	99	100	99	98	0	88	93	98	0
1-135	31	100	99	100	100	100	0	90	98	100	0
1-136	31	100	98	100	98	98	0	25	99	90	0
1-137	31	100	75	80	93	93	0	85	95	85	15

Tabla 5 (continuación)

Compuesto	Cantidad de principio activo	Tasa de inhibición de crecimiento (%)									
		Pasto dentado	Pasto cangrejo	Almorejo	Avena fatua	Raigrás italiano	Abrebujo	Arroz	Maíz	Trigo	Soja
No.	g/ha										
1-138	31	100	85	60	90	70	0	0	83	83	30
1-139	31	100	80	60	88	98	0	20	50	45	15
1-142	31	90	88	40	85	20	20	15	50	20	40
1-144	31	30	10	60	10	0	0	20	10	0	20
1-145	31	93	90	70	40	20	0	0	40	50	35
1-146	31	98	90	93	88	70	0	0	75	85	10
1-149	31	100	98	100	85	83	10	70	50	20	0
1-150	31	100	100	100	100	100	0	88	95	99	0
1-151	31	99	99	95	95	83	30	65	35	10	0
1-152	31	100	99	100	100	99	0	85	90	88	30
1-157	31	100	100	100	100	99	0	80	100	93	20
1-162	31	100	100	100	100	99	0	93	98	99	0
1-163	31	100	100	100	100	99	0	75	100	60	0
1-165	31	100	100	100	100	100	0	83	100	95	0
1-166	31	95	99	100	93	30	0	10	98	10	15
1-167	31	98	99	100	98	93	0	35	100	40	10
1-169	31	90	95	99	90	90	20	10	98	0	0

1-170	31	95	99	98	40	30	10	40	99	0	0
1-171	31	100	100	100	100	100	0	85	100	83	0
1-173	31	100	100	100	100	95	0	60	99	35	0
1-174	31	100	100	100	100	93	0	20	100	75	0
2-2	31	70	70	75	10	10	20	0	10	0	0
2-3	31	85	15	85	35	20	0	10	10	30	10
2-5	31	100	99	100	95	95	20	85	75	40	0
2-7	31	100	99	100	98	100	50	100	10	98	0
2-8	31	100	100	99	65	83	0	15	10	25	0
2-10	31	99	40	99	10	10	0	0	0	10	30
2-59	31	99	83	83	95	90	0	90	90	40	0
2-60	31	88	85	75	50	40	0	50	50	0	0
2-61	31	99	78	95	98	93	0	90	95	95	0
2-63	31	100	98	100	100	100	0	90	100	95	0

Tabla 5 (continuación)

Compuesto	Cantidad de principio activo	Tasa de inhibición de crecimiento (%)									
		Pasto dentado	Pasto cangrejo	Almorejo	Avena fatua	Raigrás italiano	Abrebujo	Arroz	Maíz	Trigo	Soja
No.	g/ha										
2-83	31	99	98	99	88	80	0	0	60	10	0
2-84	31	99	100	100	99	93	0	0	90	0	0
2-89	31	95	65	93	0	20	0	10	30	0	20
2-90	31	90	0	75	0	10	0	0	0	20	0
2-92	31	80	30	10	50	78	20	0	80	0	0
2-93	31	100	99	100	30	88	20	0	95	0	10
2-94	31	100	0	100	40	20	0	0	0	0	0
2-101	31	75	85	88	70	50	0	0	80	0	20
2-104	31	85	60	70	35	30	10	10	10	20	10
2-105	31	90	95	90	75	80	0	35	65	25	25
2-108	500	100	85	95	50	10	0	93	10	50	20
2-112	500	99	98	100	90	90	20	93	93	80	0
2-114	31	98	10	80	83	80	0	10	75	25	0
2-115	31	100	95	98	100	98	20	78	98	83	0
2-116	31	100	100	100	100	100	0	90	100	99	10
2-118	31	85	40	60	88	70	0	80	20	50	10
2-121	31	100	98	100	98	98	20	90	20	78	0

2-122	31	100	90	95	60	75	0	0	85	60	40
2-123	31	90	10	83	10	0	0	50	0	90	0
2-124	31	85	80	80	0	0	30	0	0	0	0
2-125	31	100	90	50	90	93	0	70	90	50	0
2-126	31	100	100	100	100	100	0	93	100	99	20
2-127	31	100	30	100	90	78	0	70	0	100	0
2-128	31	85	83	75	88	93	0	45	75	60	0
2-131	31	85	65	98	50	78	10	10	40	45	10
2-132	31	90	50	80	90	78	-	40	0	70	30
2-135	31	93	90	95	90	95	0	80	93	88	0
2-138	31	90	65	65	20	20	0	35	15	10	0
2-139	31	90	98	90	98	98	0	98	65	95	10
2-142	500	100	83	90	50	0	0	80	20	50	25
2-146	500	99	95	95	80	20	0	75	85	50	10

Tabla 5 (continuación)

Compuesto	Cantidad de principio activo	Tasa de inhibición de crecimiento (%)									
		Pasto dentado	Pasto cangrejo	Almorejo	Avena fatua	Raigrás italiano	Abrebujo	Arroz	Maíz	Trigo	Soja
No.	g/ha										
2-150	31	100	60	98	50	98	0	30	30	75	0
2-152	31	85	20	85	0	35	0	78	0	75	0
2-154	31	80	10	60	0	10	0	0	0	0	10
2-155	31	78	40	60	0	10	0	0	10	25	0
2-156	31	98	93	98	10	30	0	0	0	0	0
2-158	31	100	93	98	65	65	0	60	0	93	0
2-159	31	100	100	100	100	100	0	100	100	99	35
2-160	31	100	100	100	100	100	0	100	100	99	30
2-161	31	100	83	100	99	99	40	99	90	85	0
2-162	31	100	100	99	100	100	10	100	90	99	0
2-163	31	100	95	100	75	88	0	35	80	10	35
2-164	31	100	100	100	90	95	0	83	90	10	40
2-165	31	100	70	88	0	0	0	25	35	0	25
2-166	31	100	88	100	40	99	20	88	80	10	30
2-167	31	100	99	100	45	80	0	60	90	25	30
2-169	31	100	100	100	88	85	0	83	98	85	40
2-171	31	99	90	93	0	30	0	25	80	0	30

2-172	31	100	98	99	40	35	0	30	98	10	40
2-173	31	99	95	88	35	90	0	85	65	75	0
2-174	31	100	93	93	88	95	-	93	95	93	0
2-175	31	98	98	99	10	50	0	0	95	0	10
2-176	31	100	99	100	25	85	0	10	80	0	0
2-177	31	100	100	99	98	98	0	65	83	90	30
2-178	31	100	100	100	95	98	0	15	83	75	0
2-179	31	88	98	100	0	0	0	0	75	10	0
2-181	31	100	99	100	83	93	0	10	70	35	0
2-183	31	95	98	98	95	98	0	90	50	90	30
2-184	31	95	95	99	30	35	0	60	40	10	30
2-185	31	93	85	88	0	0	0	0	10	0	20
2-186	31	90	99	99	25	0	0	0	98	0	15
2-193	31	70	90	93	0	0	0	0	65	0	0

Tabla 5 (continuación)

Compuesto	Cantidad de principio activo	Tasa de inhibición de crecimiento (%)									
		Pasto dentado	Pasto cangrejo	Almorejo	Avena fatua	Raigrás italiano	Abrebujo	Arroz	Maíz	Trigo	Soja
No.	g/ha										
2-194	31	85	90	90	10	35	0	0	60	0	10
2-195	31	93	90	93	90	85	0	40	83	35	30
3-1	31	100	99	100	98	100	50	100	10	98	0
3-33	31	100	99	100	100	98	0	93	10	100	30
3-34	31	100	95	100	95	99	0	90	15	90	30
3-35	31	100	99	99	100	99	10	95	60	100	25
3-36	31	100	99	99	99	99	0	90	40	99	40
3-37	31	100	99	100	98	99	10	95	45	99	30
3-38	31	100	100	100	98	99	20	80	30	98	25
3-39	31	88	0	95	0	0	0	0	15	0	0
3-40	31	99	99	99	98	98	0	85	25	98	10
3-41	31	100	95	99	98	99	20	10	20	99	0
3-42	31	100	20	98	100	95	10	60	30	20	0
3-43	31	100	98	100	98	98	0	80	40	95	10
3-44	31	100	99	100	100	98	0	85	20	85	10
3-45	31	100	99	99	100	100	0	98	45	98	25
3-46	31	100	99	100	100	100	20	98	50	98	35

3-47	31	100	99	100	99	99	0	30	40	98	20
3-48	31	100	98	100	75	95	0	0	25	90	10
3-49	31	99	100	100	98	100	0	50	45	99	20
3-50	31	100	98	100	98	93	0	60	15	99	10
3-51	31	99	100	100	99	99	0	60	60	99	30
3-52	31	100	95	100	20	90	0	70	35	10	20
3-53	31	100	93	95	60	65	0	40	0	0	0
3-54	31	100	98	100	78	95	0	20	30	93	20
3-55	31	98	99	100	99	99	0	90	50	98	30
3-56	31	98	99	100	99	98	0	0	40	93	30
3-57	31	100	99	100	99	95	0	0	25	95	25
3-58	31	100	99	100	95	99	0	50	55	98	25
3-59	31	99	98	100	93	93	0	0	0	65	20
3-60	31	99	95	100	98	95	0	10	20	93	10

Tabla 5 (continuación)

Compuesto	Cantidad de principio activo	Tasa de inhibición de crecimiento (%)									
		Pasto dentado	Pasto cangrejo	Almorejo	Avena fatua	Raigrás italiano	Abrebujo	Arroz	Maíz	Trigo	Soja
No.	g/ha										
3-61	31	0	20	60	0	0	0	0	20	0	0
3-62	31	100	99	99	99	93	0	0	60	90	20
3-63	31	100	98	100	98	90	0	0	40	83	0
3-64	31	98	90	100	83	85	0	0	50	60	0
3-65	31	100	83	99	75	85	0	0	40	98	10
3-66	31	10	20	35	50	40	0	0	25	10	0
3-67	31	100	95	100	100	99	0	40	50	99	0
3-68	31	100	95	100	90	83	0	0	20	30	0
3-69	31	100	95	100	99	99	0	30	20	98	0
3-70	31	98	88	98	60	40	0	0	30	0	10
3-71	31	100	90	100	99	98	0	15	0	95	0
3-74	31	93	20	95	25	0	0	0	20	0	0
3-75	31	99	95	99	98	98	0	0	10	95	0
3-76	31	93	30	93	0	10	0	0	0	0	0
3-77	31	100	90	100	60	85	0	0	30	25	0
3-78	31	99	93	98	40	10	0	0	0	0	0
3-79	31	100	98	100	98	99	0	99	50	93	30

3-80	31	100	95	99	99	93	0	0	25	90	25
3-81	31	99	93	99	95	95	0	0	0	25	0
3-82	31	100	98	100	98	98	10	93	35	98	0
3-96	31	100	100	100	98	99	0	95	20	95	0
3-97	31	100	100	100	100	99	0	75	15	95	0

5 EJEMPLO DE PRUEBA 2

La tierra de campo de tierra alta se colocó en una maceta de 1/300,000 hectáreas y se sembraron semillas de diversas plantas: (pasto dentado (*Echinochloa crus-galli* L.), pasto cangrejo (*Digitaria sanguinalis* L.), almorejo (*Setaria viridis* L.), abrebujo (*Amaranthus retroflexus* L.), popotalagua o quesillo (*Sida spinosa* L.), hoja terciopelo (*Abutilon theophrasti* MEDIC.), arroz (*Oryza sativa* L.), maíz (*Zea mays* L.), trigo (*Triticum aestivum* L.), soja (*Glycine max* Merr.)). El día después de la siembra, se pesaron los polvos humectables o los concentrados emulsionables de los compuestos de la presente invención preparados de acuerdo con un método de preparación convencional, para alcanzar las cantidades prescritas del principio activo y se diluyeron con agua en una cantidad correspondiente a 1,000 litros por 1 hectárea, seguido de la aplicación al suelo con un pequeño spray.

En el día 14, después de la aplicación, se observó visualmente el estado de crecimiento de las plantas respectivas, y se evaluó el efecto herbicida por una tasa de inhibición de crecimiento (%) de 0 (equivalente al área no tratada) a 100 (muerte completa). Los resultados se muestran en la Tabla 6.

Tabla 6

Compuesto	Cantidad de principio activo	Tasa de inhibición de crecimiento (%)									
		Pasto dentado	Pasto cangrejo	Almorejo	Abrebujo	Quesillo	Hoja terciopelo	Arroz	Maíz	Trigo	Soja
No.	g/ha										
1-1	31	85	100	100	0	0	0	20	50	0	0
1-2	31	98	98	99	-	30	0	20	20	10	0
1-3	31	100	100	100	0	0	0	80	90	35	0
1-4	31	100	99	98	0	0	0	40	0	0	0
1-14	31	99	83	93	0	0	0	0	0	0	0
1-40	31	100	100	100	0	0	0	60	30	0	0
1-41	31	100	100	100	0	0	0	0	20	0	0
1-42	31	100	100	100	0	0	0	80	40	0	0
1-45	31	100	100	100	0	0	0	30	88	20	0
1-46	31	80	90	99	0	0	0	30	0	30	0
1-59	31	100	100	99	0	0	0	20	0	0	0
1-62	31	100	100	99	0	0	0	20	0	0	0
1-65	31	100	100	99	0	0	0	20	0	0	0
1-95	31	100	100	100	0	0	0	50	80	0	0
1-98	31	95	20	30	0	0	0	35	0	0	0
1-132	31	99	93	98	0	0	0	0	10	0	0
1-149	31	98	99	100	0	0	0	0	0	0	0

1-150	31	99	98	98	0	0	0	0	0	0	0
1-152	31	80	35	85	0	0	0	0	10	0	10
1-157	31	100	99	100	0	0	0	40	0	0	30
1-162	31	100	100	100	0	0	0	95	40	0	0
1-163	31	100	100	100	0	0	0	40	80	0	0
1-165	31	99	100	95	0	0	0	0	0	0	0
1-166	31	80	95	80	0	0	0	0	0	0	0
1-167	31	85	100	95	0	0	0	0	0	0	0
1-170	31	75	93	98	0	0	0	0	0	0	0
1-171	31	100	100	100	0	0	0	0	0	0	0
1-173	31	100	100	100	0	0	0	60	50	0	0

Tabla 6 (continuación)

Compuesto	Cantidad de principio activo	Tasa de inhibición de crecimiento (%)									
		Pasto dentado	Pasto cangrejo	Almorejo	Abrebujo	Quesillo	Hoja terciopelo	Arroz	Maíz	Trigo	Soja
No.	g/ha										
1-174	31	100	100	100	0	0	0	0	0	0	0
2-3	31	50	80	98	0	0	0	20	0	0	0
2-5	31	100	100	100	0	0	0	80	65	30	0
2-7	31	99	99	100	0	0	0	40	20	25	0
2-8	31	100	95	100	0	0	0	20	0	0	0
2-10	31	95	50	85	0	0	0	40	30	0	0
2-59	31	75	70	40	0	0	0	0	0	0	0
2-61	31	65	50	98	0	0	0	0	0	0	0
2-63	31	100	100	98	0	0	0	15	0	0	0
2-83	31	99	100	100	100	75	0	30	0	0	0
2-84	31	100	100	100	0	0	0	60	0	0	0
2-89	31	95	30	50	0	0	0	30	0	0	0
2-93	31	100	99	99	0	0	0	0	0	0	0
2-101	31	78	93	95	0	0	0	0	20	10	0
2-108	500	100	98	93	0	0	0	93	0	0	0
2-112	500	100	100	100	0	0	0	70	0	20	0
2-116	31	100	100	100	0	0	0	0	85	60	0

2-121	31	100	98	100	0	0	0	0	20	0	0
2-126	31	100	98	100	0	0	0	0	30	10	0
2-127	31	93	10	78	0	0	0	0	0	0	0
2-135	31	90	75	90	0	0	0	0	0	0	10
2-138	31	93	83	90	0	0	0	25	0	0	0
2-142	500	100	98	93	0	0	0	90	0	0	0
2-146	500	100	100	100	0	0	50	85	20	0	0
2-150	31	100	90	98	100	75	0	0	0	0	0
2-155	31	85	83	88	0	0	0	70	0	0	0
2-156	31	83	75	98	0	0	0	15	0	0	0
2-158	31	80	70	95	0	0	0	0	10	0	0
2-159	31	100	98	99	0	0	0	0	0	0	0
2-160	31	100	99	100	95	50	0	0	0	0	0
2-161	31	98	0	0	0	0	0	0	0	0	0

Tabla 6 (continuación)

Compuesto	Cantidad de principio activo	Tasa de inhibición de crecimiento (%)									
		Pasto dentado	Pasto cangrejo	Almorejo	Abrebujo	Quesillo	Hoja terciopelo	Arroz	Maíz	Trigo	Soja
No.	g/ha										
2-162	31	90	20	20	-	-	0	0	0	20	0
2-163	31	98	98	99	0	0	0	20	15	20	0
2-164	31	50	98	90	0	0	0	0	0	0	0
2-165	31	99	98	99	0	0	0	70	0	0	0
2-166	31	99	95	100	0	0	0	70	0	0	0
2-167	31	40	99	100	-	0	0	0	0	0	0
2-169	31	70	98	98	0	0	0	0	0	0	0
2-171	31	65	30	75	0	0	0	0	0	0	0
2-172	31	60	30	20	0	0	0	0	0	0	0
2-173	31	65	80	10	0	0	0	20	10	0	0
2-174	31	20	80	0	0	0	0	0	20	0	0
2-175	31	100	95	99	0	0	0	90	30	0	0
2-176	31	100	98	99	0	0	0	60	0	0	0
2-177	31	90	98	90	0	0	0	30	0	0	0
2-181	31	90	0	40	0	0	0	20	0	0	0
2-194	31	95	83	99	0	0	0	30	40	0	0
2-195	31	98	98	99	0	0	0	20	0	0	0

3-1	31	99	99	100	0	0	0	40	20	25	0
3-33	31	100	99	100	0	0	0	60	20	40	0
3-34	31	99	65	98	0	0	0	20	20	0	0
3-40	31	90	10	40	0	0	0	10	10	0	0
3-45	31	95	20	85	0	0	0	25	0	0	0
3-48	31	98	60	100	0	0	0	0	0	20	0
3-49	31	95	20	85	0	0	0	0	0	10	0
3-50	31	99	80	98	0	0	0	0	0	0	0
3-51	31	99	95	100	0	0	0	0	0	0	0
3-52	31	99	95	100	0	0	0	0	0	0	0
3-54	31	99	30	98	0	0	0	0	0	0	0
3-55	31	80	30	60	0	0	0	0	0	0	0
3-57	31	90	30	95	0	0	0	0	40	0	30
3-58	31	85	10	75	0	0	0	0	0	0	0

Tabla 6 (continuación)

Compuesto	Cantidad de principio activo	Tasa de inhibición de crecimiento (%)									
		Pasto dentado	Pasto cangrejo	Almorejo	Abrebujo	Quesillo	Hoja terciopelo	Arroz	Maíz	Trigo	Soja
No.	g/ha										
3-59	31	85	0	80	0	0	0	0	0	0	0
3-64	31	98	50	93	0	0	0	0	0	0	0
3-69	31	93	30	95	0	0	0	0	0	0	0
3-79	31	100	95	100	0	0	0	0	0	0	0
3-82	31	99	85	99	0	0	0	0	0	0	0
3-96	31	99	98	85	0	0	0	75	0	0	0
3-97	31	95	93	99	0	0	0	20	0	20	0

A continuación se describirán los ejemplos de formulación de la presente invención.

EJEMPLO DE FORMULACIÓN 1

(1) El compuesto de la presente invención 75 partes en peso

- 5 (2) Geropon T-77 (nombre comercial, fabricado por Rhone-Poulenc) 14, 5 partes en peso
- (3) NaCl 10 partes en peso
- (4) Dextrin 0.5 partes en peso

10 Los anteriores componentes (1) a (4) se colocan en un granulador de mezcla de alta velocidad y adicionalmente se le adiciona 20 % de agua, seguido por la granulación y secado para obtener gránulos dispersos en agua.

EJEMPLO DE FORMULACIÓN 2

(1) Caolín 78 partes en peso

- 15 (2) Laveline FAN (nombre comercial, fabricado por DAI-ICHI KOGYO SEIYAKU CO., LTD.) 2 partes en peso

(3) Sorpol 5039 (nombre comercial, fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) 5 partes en peso

(4) Carplex (nombre comercial, fabricado por DSL Japan Co., Ltd.) 15 partes en peso

20 La mezcla de los componentes (1) a (4) anteriores y el compuesto de la presente invención se mezclan en una relación en peso de 9: 1 para obtener un polvo humectable.

EJEMPLO DE FORMULACIÓN 3

(1) Hi-Filler No. 10 (nombre comercial, fabricado por Matsumura Sangyo Co., Ltd.)

- 25 33 partes en peso

(2) Sorpol 5050 (nombre comercial, fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) 3 partes en peso

(3) Sorpol 5073 (nombre comercial, fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) 4 partes en peso

- 30 (4) El compuesto de la presente invención 60 partes en peso

Los anteriores componentes (1) a (4) se mezclan para obtener polvo humectable.

EJEMPLO DE FORMULACIÓN 4

(1) El compuesto de la presente invención 4 partes en peso

- 35 (2) Bentonita 30 partes en peso

- (3) Carbonata de calcio 61,5 partes en peso
- (4) Toxanon GR-31A (nombre comercial, fabricado por Sanyo Chemical Industries Co., Ltd.) 3 partes en peso
- (5) sulfanato de lignina de calcio 1,5 partes en peso

5 El componente pulverizado (1) y los componentes (2) y (3) se mezclan preliminarmente, y luego se añaden y se mezclan los componentes (4) y (5) y el agua. La mezcla se extruye y se granula, seguido del secado y tamizado para obtener gránulos.

EJEMPLO DE FORMULACIÓN 5

- 10 (1) El compuesto de la presente invención 30 partes en peso
- (2) Zeeklite (nombre comercial, fabricado por Zeeklite Co., Ltd.) 60 partes en peso
- (3) New Kalgen WG-1 (nombre comercial, fabricado por TAKEMOTO OIL & FAT CO., LTD.) 5 partes en peso
- 15 (4) New Kalgen FS-7 (nombre comercial, fabricado por TAKEMOTO OIL & FAT CO., LTD.) 5 partes en peso

Los componentes (1), (2) y (3) se mezclan y pasan a través de un pulverizador, y luego se agrega el componente (4). La mezcla se amasa y luego se extruye y se granula, seguido del secado y tamizado para obtener gránulos dispersables en agua.

20 EJEMPLO DE FORMULACIÓN 6

- (1) El compuesto de la presente invención 28 partes en peso
- (2) Soprophor FL (nombre comercial, fabricado por Rhone-Poulenc) 2 partes en peso
- (3) Sorpol 335 (nombre comercial, fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) 1 partes en peso
- 25 (4) disolvente IP 1620 (nombre comercial, fabricado por Idemitsu Petrochemical Co., Ltd.) 32 partes en peso
- (5) Etilenglicol 6 partes en peso
- (6) Agua 31 partes en peso

30 Los componentes anteriores (1) a (6) se mezclan y se pulverizan con una máquina de molienda en húmedo (Dyno-mill) para obtener un concentrado en suspensión a base de agua.

La presente invención no está de ningún modo limitada a las modalidades descritas anteriormente, y son posibles diversas modificaciones dentro del rango reivindicado de la presente invención. Además, las modalidades que se pueden

35

obtener combinando adecuadamente los medios técnicos divulgados respectivamente en diferentes modalidades, se incluirán en la presente invención. Además, al combinar los medios técnicos divulgados respectivamente en las respectivas modalidades, es posible formar una nueva característica técnica.

5

APLICACIÓN INDUSTRIAL

El compuesto de la presente invención, realiza una mejora extraordinaria en las actividades herbicidas contra las plantas indeseadas (maleza) en comparación con los compuestos similares convencionales. Además, es bastante seguro para las plantas de cultivo. De este modo, el compuesto de piridazinona de la presente invención o su sal, exhibe excelentes efectos herbicidas cuando se utiliza como principio activo de un herbicida. Su rango de aplicación cubre varios campos incluyendo campos agrícolas tales como: arrozal, campo seco, campo hortícola, campo de morera, etc. y campos no agrícolas tales como bosques de montaña, caminos agrícolas, terrenos, sitios de plantas, etc. Su método de aplicación también puede ser adecuadamente seleccionado para su uso, entre el tratamiento del suelo, el tratamiento foliar, el tratamiento de riego, etc.

La descripción completa de la Solicitud de Patente Japonesa No. 2016-067797 presentada el 30 de marzo de 2016, incluyendo las especificaciones, las reivindicaciones, las cifras y el resumen, se incorpora en este documento como referencia en su totalidad.

25

KAM\KAM\ID-777771\WPCL8028

30

35