Compuesto de 2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidina, bactericida agrícola y hortícola, nematicida y agente antifúngico médico y veterinario

Campo técnico

[0001]

La presente invención se refiere a compuestos de 2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidina y fungicidas agrícolas y hortícolas. Más particularmente, la presente invención se refiere a un compuesto de 2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidina que tiene una excelente actividad bactericida y antimicrobiana, tiene una excelente seguridad y puede sintetizarse industrialmente de manera favorable, y a un fungicida agrícola y hortícola que contiene el compuesto como un ingrediente activo. La presente invención se refiere además a un nematicida que contiene el compuesto como ingrediente activo. La presente invención se refiere además a un agente antifúngico para uso en medicina/animales que contiene el compuesto como ingrediente activo.

La presente solicitud reivindica prioridad de la solicitud de patente japonesa pendiente de examen N.° 2019-195484, presentada el 28 de octubre de 2019 y la solicitud de patente japonesa pendiente de examen N.° 2020-053191, presentada el 24 de marzo de 2020, cuyos contenidos se incorporan a la presente como referencia.

Técnica anterior

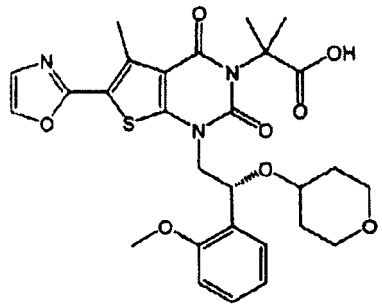
[0002]

En el cultivo de cosechas agrícolas y hortícolas, se han sugerido varios compuestos que tienen actividad de control sobre las enfermedades de los cultivos. Para utilizar de manera práctica el compuesto como un fungicida agrícola y hortícola, se requiere que el compuesto no solo tenga una eficacia suficientemente alta, sino que tenga pocas probabilidades de causar resistencia a los fármacos, que tenga pocas probabilidades de causar fitotoxicidad a las plantas y

contaminación del suelo, y que tenga baja toxicidad para el ganado y los peces.

[0003]

Por cierto, el Documento de Patente 1 divulga un compuesto de la fórmula (A) y similares.



(A)

Documentos de la técnica anterior

Documentos de patentes

[0004]

Documento de patente 1 WO 2013/071169A

Sumario de la invención

Objeto a resolver por la invención

[0005]

Un objeto de la presente invención es proporcionar un compuesto de 2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidina que tiene una excelente actividad antimicrobiana y bactericida, tiene una excelente seguridad y puede sintetizarse industrialmente de manera favorable (en adelante, puede denominarse simplemente como el "compuesto de dihidropirimidina") y un fungicida agrícola y hortícola que contiene el compuesto como ingrediente activo. Otro objeto de la presente invención es proporcionar un nematicida que contiene el compuesto como ingrediente activo. Otro objeto de la presente invención es proporcionar un agente antifúngico para uso en medicina/animales que contiene el compuesto como ingrediente activo.

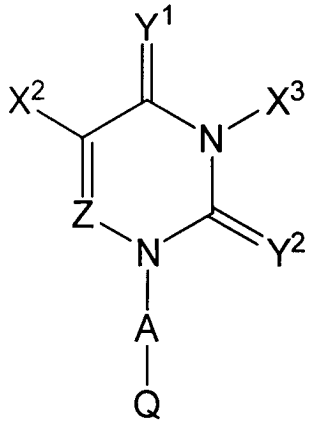
Medios para resolver el objeto

[0006]

Los presentes inventores han realizado estudios intensivos para lograr los objetos mencionados anteriormente, habiendo completado la presente invención que incluye los siguientes aspectos.

[0007]

[1] Un compuesto de la fórmula (I) o una sal del mismo:



(II)

[en donde,

Y^1 representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

Y^2 representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

Z representa un grupo representado por C-X^1 o un átomo de nitrógeno;

X^1 representa un átomo de hidrógeno, un grupo halógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo hidroxi, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alqueniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiltio C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfinilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfonilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquiloxi C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo ariloxi C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo ariltio C6-10 sustituido o no

sustituido, un grupo arilsulfinilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo arilsulfonilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido, un grupo heterocicliloxi de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo representado por R^1-CO-, un grupo carboxi, un grupo representado por R^2-O-CO-, un grupo representado por R^3R^4N-, un grupo representado por R^3R^4N-CO-, un grupo representado por R^1-CO-O-, un grupo representado por R^1-CO-NR^5-, un grupo representado por R^2-O-CO-O-, un grupo representado por R^2-O-CO-NR^5-, un grupo representado por R^3R^4N-CO-O-, un grupo representado por R^3R^4N-CO-NR^5-, un grupo representado por R^2SO_2-NR^5-, un grupo representado por R^3R^4N-SO_2-, o un grupo representado por R^1O-N=CR^6-;

cada R^1 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^2 representa independientemente un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^3 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^4 representa independientemente un átomo de hidrógeno,

un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido,

donde R^3 y R^4 juntos pueden formar un grupo orgánico divalente,

cada R^5 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido,

R^6 representa un átomo de hidrógeno, un grupo halógeno, un grupo amino, un grupo mono-alquilamino C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo di-alquilamino C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiltio C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido;

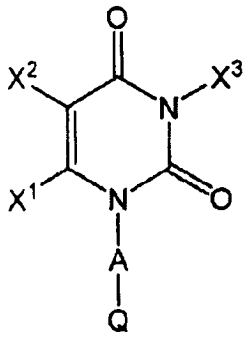
X^2 representa un grupo representado por $R^1O\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, un grupo representado por $R^1CO\text{-}O\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, un grupo representado por $R^3R^4N\text{-}CO\text{-}O\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, un grupo representado por $R^3R^4N\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, o un grupo representado por $R^7\text{-}N{=}CR^6\text{-}$; R^1, R^3, R^4, y R^6 tienen el mismo significado que aquellos en X^1; R^7 representa un grupo heterociclilo de anillo de 5 miembros sustituido o no sustituido;

X^3 representa un grupo alquilo C1-6 lineal sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 lineal sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 lineal sustituido o no sustituido, un grupo representado por $R^1\text{-}CO\text{-}$, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 4 a 6 miembros sustituido o no sustituido;

A representa un grupo alquileno C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenileno C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinileno C2-6 sustituido o no sustituido, o un grupo cicloalquileno C3-6 sustituido o no sustituido; y

Q representa un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 10 miembros sustituido o no sustituido.].

[2] El compuesto o una sal del mismo según [1], en donde la Fórmula (II) es de la fórmula (I):



(I)

[en donde X^1, X^2, X^3, A y Q tienen el mismo significado que los de [1]].

[3] El compuesto o una sal del mismo según [1] o [2], en donde

un sustituyente en el grupo alquilo C1-6 lineal, un sustituyente en el grupo alquenilo C2-6 lineal, un sustituyente en el grupo alquinilo C2-6 lineal, un sustituyente en el grupo cicloalquilo C3-6, un sustituyente en el grupo arilo C6-10, o un sustituyente en el grupo heterociclilo de anillo de 4 a 6 miembros en X^3 es

uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo halógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo hidroxi, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alqueniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiltio C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfinilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfonilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquiloxi C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo ariloxi C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo ariltio C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo arilsulfinilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo arilsulfonilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo heterociclilo de anillo de 3 a 10 miembros sustituido o no sustituido,

un grupo heterocicliloxi de anillo de 3 a 10 miembros sustituido o no sustituido, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo representado por R^a-CO-, un grupo carboxi, un grupo representado por R^b-O-CO-, un grupo representado por R^cR^dN-, un grupo representado por R^cR^dN-CO-, un grupo representado por R^cR^dN-NR^d-CO-, un grupo representado por R^a-CO-O-, un grupo representado por R^a-CO-NR^e-, un grupo representado por R^a-CO-CO-NR^e-, un grupo representado por R^a-CO-NR^e-NR^e-, un grupo representado por R^a-CO-NR^e-NR^e-CO-, un grupo representado por R^b-O-CO-O-, un grupo representado por R^b-O-CO-NR^e-, un grupo representado por R^cR^dN-CO-O-, un grupo representado por R^cR^dN-CO-NR^e-, un grupo representado por R^cR^dN-CO-CO-NR^e-, un grupo representado por R^a-CS-NR^e-, un grupo representado por R^cR^dN-CS-NR^e-, un grupo representado por R^bSO_2-NR^e-, un grupo representado por R^cR^dN-SO_2-, un grupo representado por R^aO-N=CR^f-, un grupo representado por R^hR^jC=N-O-, un grupo representado por R^a-C(=NR^g)-NR^e-, un grupo representado por R^cR^dN-C(=NR^g)-, un grupo representado por R^hR^iS(=O)=N-CO-, y un grupo representado por R^hR^iS=N-CO-;

cada R^a representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 3 a 10 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^b representa independientemente un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 10 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^c representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6

sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^d representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, donde R^c y R^d juntos pueden formar un grupo orgánico divalente,

cada R^e representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido,

R^f representa un átomo de hidrógeno, un grupo amino o un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido,

cada R^g representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido,

cada R^h representa independientemente un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido,

cada R^i representa independientemente un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, donde R^h y R^i juntos pueden formar un grupo orgánico divalente; y

cuando dos o más sustituyentes están presentes en el grupo alquilo C1-6 lineal, dos de los sustituyentes pueden juntos formar un grupo orgánico divalente.

[4] El compuesto o una sal del mismo según cualquiera de [1] a [3], en donde

un sustituyente en el grupo alquileno C1-6 o el grupo alquenileno C2-6 en A es

uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un grupo halógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6

sustituido o no sustituido, un grupo hidroxi, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alqueniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo mercapto, un grupo alquiltio C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfinilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfonilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquiloxi C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo ariloxi C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo ariltio C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo arilsulfinilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo arilsulfonilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo heterociclilo de anillo de 3 a 6 miembros sustituido o no sustituido, un grupo heterocicliloxi de anillo de 3 a 6 miembros sustituido o no sustituido, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo representado por R^{a1}-CO-, un grupo carboxi, un grupo representado por R^{b1}-O-CO-, un grupo representado por $R^{c1}R^{d1}$N-, un grupo representado por $R^{c1}R^{d1}$N-CO-, un grupo representado por R^{a1}-CO-O-, un grupo representado por R^{a1}-CO-NR^{e1}-, un grupo representado por R^{b1}-O-CO-O-, un grupo representado por R^{b1}-O-CO-NR^{e1}-, un grupo representado por $R^{c1}R^{d1}$N-CO-O-, un grupo representado por $R^{c1}R^{d1}$N-CO-NR^{e1}-, un grupo representado por $R^{b1}SO_2$-NR^{e1}-, un grupo representado por $R^{c1}R^{d1}$N-SO_2-, un grupo representado por R^{a1}O-N=CR^{f1}-, un grupo representado por $R^{g1}R^{h1}$C=N-O-, un grupo oxo (O=), un grupo tioxo (S=), un grupo divalente representado por R^{a1}-N=, un grupo divalente representado por R^{a1}O-N=, un grupo divalente representado por $R^{c1}R^{d1}$N-N=, un grupo divalente representado por R^{a1}-CO-NR^{e1}-N=, un grupo divalente representado por R^{b1}-O-CO-NR^{e1}-N=, y un grupo divalente representado por $R^{b1}SO_2$-NR^{e1}-N=;

cada R^{a1} representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo

arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^{b1} representa independientemente un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^{c1} representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^{d1} representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, donde R^{c1} y R^{d1} juntos pueden formar un grupo orgánico divalente,

cada R^{e1} representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido,

R^{f1} representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido,

R^{g1} representa independientemente un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

R^{h1} representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, donde R^{g1} y R^{h1} juntos pueden formar un grupo

orgánico divalente; y

cuando están presentes dos o más sustituyentes en el grupo alquileno C1-6 o en el grupo alquenileno C2-6, dos de los sustituyentes juntos pueden formar un grupo orgánico divalente.

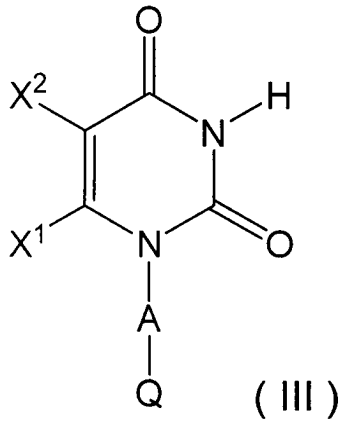
[5] Un fungicida agrícola y hortícola que contiene al menos uno seleccionado del grupo que consiste en el compuesto según cualquiera de [1] a [4] y una sal del mismo como ingrediente activo.

[6] El fungicida agrícola y hortícola según [5], en donde el fungicida es para el tratamiento de semillas.

[7] Un nematicida que contiene al menos uno seleccionado del grupo que consiste en el compuesto según cualquiera de [1] a [4] y una sal del mismo como ingrediente activo.

[8] Un agente antifúngico para uso en medicina/animales que contiene al menos uno seleccionado del grupo que consiste en el compuesto según cualquiera de [1] a [4] y una sal del mismo como ingrediente activo.

[9] Un compuesto de la fórmula (III) o una sal del mismo:



(III)

[en donde,

X^1 representa un átomo de hidrógeno, un grupo halógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo hidroxi, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alqueniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiniloxi C2-6

sustituido o no sustituido, un grupo alquiltio C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfinilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfonilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquiloxi C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo ariloxi C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo ariltio C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo arilsulfinilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo arilsulfonilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido, un grupo heterocicliloxi de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo representado por R^1-CO-, un grupo carboxi, un grupo representado por R^2-O-CO-, un grupo representado por R^3R^4N-, un grupo representado por R^3R^4N-CO-, un grupo representado por R^1-CO-O-, un grupo representado por R^1-CO-NR^5-, un grupo representado por R^2-O-CO-O-, un grupo representado por R^2-O-CO-NR^5-, un grupo representado por R^3R^4N-CO-O-, un grupo representado por R^3R^4N-CO-NR^5-, un grupo representado por R^2SO_2-NR^5-, un grupo representado por R^3R^4N-SO_2-, o un grupo representado por R^1O-N=CR^6-;

cada R^1 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^2 representa independientemente un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^3 representa independientemente un átomo de hidrógeno,

un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^4 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido,

donde R^3 y R^4 juntos pueden formar un grupo orgánico divalente,

cada R^5 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido,

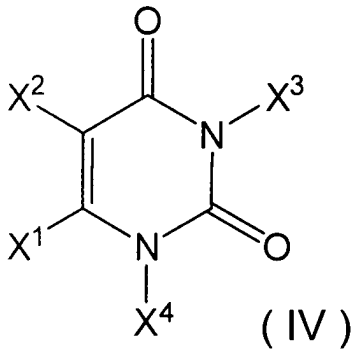
R^6 representa un átomo de hidrógeno, un grupo halógeno, un grupo amino, un grupo mono-alquilamino C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo di-alquilamino C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiltio C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido;

X^2 representa un grupo representado por $R^1O\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, un grupo representado por $R^1CO\text{-}O\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, un grupo representado por $R^3R^4N\text{-}CO\text{-}O\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, un grupo representado por $R^3R^4N\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, o un grupo representado por $R^7\text{-}N{=}CR^6\text{-}$; R^1, R^3, R^4, y R^6 tienen el mismo significado que aquellos en X^1; R^7 representa un grupo heterociclilo de anillo de 5 miembros sustituido o no sustituido;

A representa un grupo alquileno C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenileno C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinileno C2-6 sustituido o no sustituido, o un grupo cicloalquileno C3-6 sustituido o no sustituido; y

Q representa un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 10 miembros sustituido o no sustituido.].

[10] Un compuesto de la fórmula (IV) o una sal del mismo:



(IV)

[en donde,

X^1 representa un átomo de hidrógeno, un grupo halógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo hidroxi, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alqueniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiltio C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfinilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfonilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquiloxi C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo ariloxi C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo ariltio C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo arilsulfinilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo arilsulfonilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido, un grupo heterocicliloxi de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo representado por R^1-CO-, un grupo carboxi, un grupo representado por R^2-O-CO-, un grupo representado por R^3R^4N-, un grupo representado por R^3R^4N-CO-, un grupo representado por R^1-CO-O-, un grupo representado por R^1-CO-NR^5-, un grupo representado por R^2-O-CO-O-, un grupo representado por R^2-O-CO-NR^5-, un grupo representado por R^3R^4N-CO-O-, un grupo representado por R^3R^4N-CO-NR^5-, un grupo representado por R^2SO_2-NR^5-, un grupo representado por

R^3R^4N-SO_2-, o un grupo representado por R^1O-N=CR^6-;

cada R^1 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^2 representa independientemente un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^3 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^4 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido,

donde R^3 y R^4 juntos pueden formar un grupo orgánico divalente,

cada R^5 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido,

R^6 representa un átomo de hidrógeno, un grupo halógeno, un grupo amino, un grupo mono-alquilamino C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo di-alquilamino C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiltio C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo

de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido;

X^2 representa un grupo representado por $R^1O\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, un grupo representado por $R^1CO\text{-}O\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, un grupo representado por $R^3R^4N\text{-}CO\text{-}O\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, un grupo representado por $R^3R^4NR^3R^4N\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, o un grupo representado por $R^7\text{-}N{=}CR^6\text{-}$; R^1, R^3, R^4, y R^6 tienen el mismo significado que aquellos en X^1; R^7 representa un grupo heterociclilo de anillo de 5 miembros sustituido o no sustituido;

X^3 representa un grupo alquilo C1-6 lineal sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 lineal sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 lineal sustituido o no sustituido, un grupo representado por $R^1\text{-}CO\text{-}$, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 4 a 6 miembros sustituido o no sustituido; y

X^4 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alcoximetilo C1-6.].

Efecto de la invención

[0008]

El compuesto de dihidropirimidina de la presente invención tiene una excelente actividad antimicrobiana y bactericida, ejerce de forma confiable sus efectos, tiene una excelente seguridad y puede sintetizarse industrialmente de manera favorable.

El fungicida agrícola y hortícola y el nematicida de la presente invención tienen un excelente efecto de control, no provocan fitotoxicidad en las plantas y ejercen poca influencia sobre los seres humanos, el ganado y los peces.

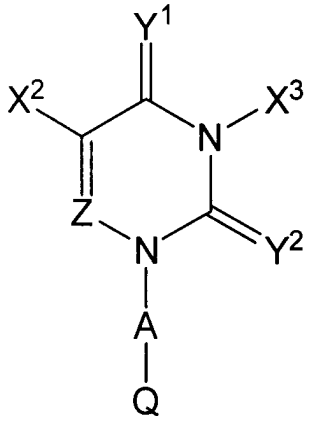
El agente antifúngico para uso en medicina/animales de la presente invención tiene un excelente efecto antimicrobiano y tiene poca toxicidad para los seres humanos, el ganado y los peces.

Modo de llevar a cabo la invención

[0009]

Compuesto de dihidropirimidina

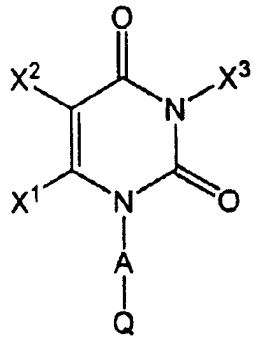
El compuesto de dihidropirimidina de la presente invención es un compuesto de la fórmula (II) (en lo sucesivo, a veces denominado compuesto (II)) o una sal del compuesto (II).



(II)

El compuesto de dihidropirimidina es preferiblemente un compuesto de la fórmula (I) (en lo sucesivo, a veces denominado compuesto (I)) o una sal del compuesto (I).

[0010]



(I)

[0011]

En la presente invención, el término "no sustituido" significa que el grupo tiene solo un grupo que forma un núcleo madre. Las descripciones que usan solo el nombre del grupo que forma un núcleo madre, a menos que se indique lo contrario, significan "no sustituido".

Por otro lado, el término "sustituido" significa que cualquiera de los átomos de hidrógeno del grupo que forma un núcleo madre es

reemplazado por un grupo que tiene la misma estructura o una estructura diferente a la del núcleo madre. Por lo tanto, el término "sustituyente" se refiere a otro grupo unido a un grupo que forma un núcleo madre. Puede haber un sustituyente o dos sustituyentes más. Los dos o más sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí.

[0012]

Un "sustituyente" no está particularmente limitado siempre que sea químicamente aceptable y tenga los efectos de la presente invención.

Ejemplos específicos de grupos que pueden convertirse en "sustituyentes" incluyen los siguientes grupos:

un grupo halógeno tal como un grupo flúor, un grupo cloro, un grupo bromo y un grupo yodo;

un grupo alquilo C1-6 tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo y un grupo n-hexilo;

Un grupo alquenilo C2-6 tal como un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 1-pentenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 3-pentenilo, un grupo 4-pentenilo, un grupo 1-metil-2-butenilo, un grupo 2-metil-2-butenilo, un grupo 1-hexenilo, un grupo 2-hexenilo, un grupo 3-hexenilo y un grupo 4-hexenilo, un grupo 5-hexenilo;

un grupo alquinilo C2-6 tal como un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 1-metil-2-propinilo, un grupo 2-metil-3-butinilo, un grupo 1-pentinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo, un grupo 4-pentinilo, un grupo 1-metil-2-butinilo, un grupo 2-metil-3-pentinilo, un grupo 1-hexinilo y un grupo 1,1-dimetil-2-butinilo;

[0013]

un grupo cicloalquilo C3-6 tal como un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo y un grupo ciclohexilo;

un grupo cicloalquenilo C3-6 tal como un grupo 2-ciclopropenilo, un grupo 2-ciclopentenilo y un grupo 3-ciclohexenilo;

un grupo arilo C6-10 tal como un grupo fenilo y un grupo naftilo;

un grupo arilo C6-10 alquilo C1-6 tal como un grupo bencilo y un grupo fenetilo;

un grupo heterociclilo de anillo de 3 a 6 miembros;

un grupo heterociclil-alquilo C1-6 de anillo de 3 a 6 miembros;

[0014]

un grupo hidroxi;

un grupo alcoxi C1-6 tal como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi y un grupo t-butoxi;

un grupo alqueniloxi C2-6 tal como un grupo viniloxi, un grupo aliloxi, un grupo propeniloxi y un grupo buteniloxi;

un grupo alquiniloxi C2-6 tal como un grupo etiniloxi y un grupo propargiloxi;

un grupo ariloxi C6-10 tal como un grupo fenoxi y un grupo naftoxi;

un grupo arilo C6-10 alcoxi C1-6 tal como un grupo benciloxi y un grupo fenetiloxi;

[0015]

un grupo carboxi;

un grupo formilo;

un grupo alquilcarbonilo C1-6 tal como un grupo acetilo y un grupo propionilo;

un grupo formiloxi;

un grupo alquilcarboniloxi C1-6 tal como un grupo acetiloxi y un grupo propioniloxi;

un grupo alcoxicarbonilo C1-6 tal como un grupo metoxicarbonilo, un grupo etoxicarbonilo, un grupo n-propoxicarbonilo, un grupo i-propoxicarbonilo, un grupo n-butoxicarbonilo y un grupo t-butoxicarbonilo;

[0016]

un grupo haloalquilo C1-6 tal como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo, un grupo 1-fluoro-n-butilo y un grupo perfluoro-n-pentilo;

un grupo haloalquenilo C2-6 tal como un grupo 2-cloro-1-propenilo y un grupo 2-fluoro-1-butenilo;

un grupo haloalquinilo C2-6 tal como un grupo 4,4-dicloro-1-butinilo, un grupo 4-fluoro-1-pentinilo y un grupo 5-bromo-2-pentinilo;

un grupo halocicloalquilo C3-6 tal como un grupo 3,3-difluorociclobutilo;

un grupo haloalcoxi C1-6 tal como un grupo 2-cloro-n-propoxi, un grupo 2,3-diclorobutoxi, un grupo trifluorometoxi y un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi;

un grupo haloalqueniloxi C2-6 tal como un grupo 2-cloropropeniloxi y un grupo 3-bromobuteniloxi;

un grupo haloalquilcarbonilo C1-6 tal como un grupo cloroacetilo, un grupo trifluoroacetilo y un grupo tricloroacetilo;

[0017]

un grupo amino;

un grupo amino sustituido con alquilo C1-6 tal como un grupo metilamino, un grupo dimetilamino y un grupo dietilamino;

un grupo arilamino C6-10 tal como un grupo anilino y un grupo naftilamino;

un grupo arilo C6-10 alquilamino C1-6, tal como un grupo bencilamino y un grupo fenetilamino;

[0018]

un grupo formilamino;

un grupo alquilcarbonilamino C1-6, tal como un grupo acetilamino, un grupo propionilamino, un grupo butirilamino y un grupo i-propilcarbonilamino;

un grupo alcoxicarbonilamino C1-6 tal como un grupo metoxicarbonilamino, un grupo etoxicarbonilamino, un grupo n-

propoxicarbonilamino y un grupo i-propoxicarbonilamino;

un grupo aminocarbonilo no sustituido o sustituido tal como un grupo carbamoilo, un grupo dimetilaminocarbonilo, un grupo fenilaminocarbonilo y un grupo N-fenil-N-metilaminocarbonilo;

un grupo imino-alquilo C1-6, tal como un grupo iminometilo, un grupo (1-imino) etilo y un grupo (1-imino)-n-propilo;

un grupo alquilo C1-6 N-hidroxiimino sustituido o no sustituido tal como un grupo N-hidroxi-iminometilo, un grupo (1-(N-hidroxi)-imino)etilo, un grupo (1-(N-hidroxi)-imino)propilo, un grupo N-metoxi-iminometilo, y un grupo (1-(N-metoxi)-imino)etilo;

un grupo aminocarboniloxi;

un grupo aminocarboniloxi sustituido con alquilo C1-6 tal como un grupo etilaminocarboniloxi y un grupo dimetilaminocarboniloxi;

[0019]

un grupo mercapto;

un grupo alquiltio C1-6 tal como un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo n-propiltio, un grupo i-propiltio, un grupo n-butiltio, un grupo i-butiltio, un grupo s-butiltio y un grupo t-butiltio;

un grupo haloalquiltio C1-6 tal como un grupo trifluorometiltio y un grupo 2,2,2-trifluoroetiltio;

un grupo alqueniltio C2-6 tal como un grupo viniltio y un grupo ariltio;

un grupo alquiniltio C2-6 tal como un grupo etiniltio y un grupo propargiltio;

un grupo alquilsulfinilo C1-6 tal como un grupo metilsulfinilo, un grupo etilsulfinilo y un grupo t-butilsulfinilo;

un grupo haloalquilsulfinilo C1-6 tal como un grupo trifluorometilsulfinilo y un grupo 2,2,2-trifluoroetilsulfinilo;

un grupo alquenilsulfinilo C2-6 tal como un grupo arilsulfinilo;

un grupo alquinilsulfinilo C2-6 tal como un grupo propargilsulfinilo;

un grupo alquilsulfonilo C1-6 tal como un grupo metilsulfonilo, un

grupo etilsulfonilo y un grupo t-butilsulfonilo;

un grupo haloalquilsulfonilo C1-6 tal como un grupo trifluorometilsulfonilo y un grupo 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo;

un grupo alquenilsulfonilo C2-6 tal como un grupo alilsulfonilo;

un grupo alquinilsulfonilo C2-6 tal como un grupo propargilsulfonilo;

un grupo aminotiocarbonilo;

un grupo alquilsulfoxiimino C1-6 tal como un grupo S,S-dimetilsulfoxiimino;

[0020]

un grupo sililo sustituido con tri-alquilo C1-6, tal como un grupo trimetilsililo, un grupo trietilsililo y un grupo t-butildimetilsililo;

un grupo sililo sustituido con tri arilo C6-10 tal como un grupo trifenilsililo;

un grupo ciano; y

un grupo nitro.

[0021]

El término "C1 a 6" o similar significa que el número de átomos de carbono en un grupo que forma un núcleo madre es de 1 a 6, o similar. El número de átomos de carbono no incluye el número de átomos de carbono presentes en los sustituyentes. Por ejemplo, un grupo etoxibutilo, que tiene un grupo butilo como grupo que forma un núcleo madre y tiene un grupo etoxi como sustituyente, se clasifica en grupos alcoxi C2 alquilo C4.

[0022]

El "grupo heterociclilo de anillo de 3 a 6 miembros" descrito anteriormente incluye de 1 a 4 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre como un átomo(s) constituyente del anillo. Ejemplos del "grupo heterociclilo de anillo de 3 a 6 miembros" incluyen un grupo heterociclilo saturado de anillo de 3 a 6 miembros, un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros y un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5

a 6 miembros.

[0023]

Ejemplos del grupo heterociclilo saturado de anillo de 3 a 6 miembros pueden incluir un grupo aziridinilo, un grupo epoxi, un grupo azetidinilo, un grupo oxetanilo, un grupo pirrolidinilo, un grupo tetrahidrofuranilo, un grupo tiazolidinilo, un grupo tetrahidro-2H-piranilo, un grupo piperidilo, un grupo piperazinilo, un grupo morfolinilo, un grupo dioxolanilo y un grupo dioxanilo.

[0024]

Ejemplos del grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros pueden incluir un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxadiazolilo, un grupo tiadiazolilo y un grupo tetrazolilo.

Ejemplos del grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros pueden incluir un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo y un grupo triazinilo.

Ejemplos del grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 miembros incluyen un grupo pirrolinilo, un grupo dihidrofuranilo, un grupo imidazolinilo, un grupo pirazolinilo y un grupo oxazolinilo.

Ejemplos del grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 6 miembros pueden incluir un grupo isoxazolinilo y un grupo dihidropiranilo.

Cualquier átomo de hidrógeno en estos "sustituyentes" puede estar sustituido con un grupo con una estructura diferente.

[0025]

[Y^1 e Y^2]

Y^1 representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre, e Y^2 representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre.

En la presente invención, Y^1 es preferiblemente un átomo de oxígeno, e Y^2 es preferiblemente un átomo de oxígeno.

[0026]

[Z]

Z representa un grupo representado por C-X^1 o un átomo de nitrógeno.

[0027]

[X^1]

X^1 representa un átomo de hidrógeno, un grupo halógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo hidroxi, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alqueniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiltio C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfinilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfonilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquiloxi C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo ariloxi C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo ariltio C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo arilsulfinilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo arilsulfonilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido, un grupo heterocicliloxi de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo representado por R^1-CO-, un grupo carboxi, un grupo representado por R^2-O-CO-, un grupo representado por R^3R^4N-, un grupo representado por R^3R^4N-CO-, un grupo representado por R^1-CO-O-, un grupo representado por R^1-CO-NR^5-, un grupo representado por R^2-O-CO-O-, un grupo representado por R^2-O-CO-NR^5-, un grupo representado por R^3R^4N-CO-O-, un grupo representado por R^3R^4N-CO-NR^5-, un grupo representado por R^2SO_2-NR^5-, un grupo representado por R^3R^4N-SO_2-, o un grupo representado por R^1O-N=CR^6-.

[0028]

Cada R^1 representa independientemente un átomo de hidrógeno,

un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido.

Cada R^2 representa independientemente un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido.

Cada R^3 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido.

Cada R^4 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido.

Aquí, R^3 y R^4 juntos pueden formar un grupo orgánico divalente.

Cada R^5 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido.

R^6 representa un átomo de hidrógeno, un grupo halógeno, un grupo amino, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiltio C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido.

[0029]

Ejemplos del "grupo halógeno" en X^1 pueden incluir un grupo

fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo y un grupo yodo.

[0030]

El "grupo alquilo C1-6" en X^1 puede ser una cadena lineal o puede ser una cadena ramificada. Ejemplos del "grupo alquilo C1-6" en X^1 pueden incluir un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo n-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo n-hexilo, un grupo i-propilo, un grupo i-butilo, un grupo s-butilo, un grupo t-butilo, un grupo i-pentilo, un grupo neopentilo, un grupo 2-metilbutilo y un grupo i-hexilo.

[0031]

Ejemplos del “grupo alquenilo C2-6” en X^1 pueden incluir un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 1-pentenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 3-pentenilo, un grupo 4-pentenilo, un grupo 1-metil-2-butenilo, un grupo 2-metil-2-butenilo, un grupo 1-hexenilo, un grupo 2-hexenilo, un grupo 3-hexenilo, un grupo 4-hexenilo y un grupo 5-hexenilo.

[0032]

Ejemplos del “grupo alquinilo C2-6” en X^1 pueden incluir un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 1-metil-2-propinilo, un grupo 2-metil-3-butinilo, un grupo 1-pentinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo, un grupo 4-pentinilo, un grupo 1-metil-2-butinilo, un grupo 2-metil-3-pentinilo, un grupo 1-hexinilo y un grupo 1,1-dimetil-2-butinilo.

[0033]

Ejemplos del "grupo alcoxi C1-6" en X^1 pueden incluir un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo n-pentiloxi, un grupo n-hexiloxi, un grupo i-propoxi, un grupo i-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo t-butoxi y un grupo i-hexiloxi.

Ejemplos del "grupo alqueniloxi C2-6" en X^1 pueden incluir un grupo viniloxi, un grupo aliloxi, un grupo propeniloxi y un grupo buteniloxi.

Ejemplos del "grupo alquiniloxi C2-6" en X^1 pueden incluir un grupo

etiniloxi y un grupo propargiloxi.

[0034]

Ejemplos del "grupo alquiltio C1-6" en X^1 pueden incluir un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo n-propiltio, un grupo n-butiltio, un grupo n-pentiltio, un grupo n-hexiltio y un grupo i-propiltio.

Ejemplos del "grupo alquilsulfinilo C1-6" en X^1 pueden incluir un grupo metilsulfinilo, un grupo etilsulfinilo y un grupo t-butilsulfinilo.

Ejemplos del "grupo alquilsulfonilo C1-6" en X^1 pueden incluir un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo y un grupo t-butilsulfonilo.

[0035]

El sustituyente en el "grupo alquilo C1-6", el "grupo alquenilo C2-6", el "grupo alquinilo C2-6", el "grupo alcoxi C1-6", el "grupo alqueniloxi C2-6", el "grupo alquiniloxi C2-6", el "grupo alquiltio C1-6", el "grupo alquilsulfinilo C1-6" o el "grupo alquilsulfonilo C1-6" en X^1 es preferiblemente un grupo halógeno tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo; un grupo hidroxi; un grupo alcoxi C1-6 tal como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi o un grupo t-butoxi; un grupo haloalcoxi C1-6 tal como un grupo 2-cloro-n-propoxi, un grupo 2,3-diclorobutoxi o un grupo trifluorometoxi; un grupo cicloalquilo C3-6 tal como un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo o un grupo ciclohexilo; un grupo arilo C6-10 tal como un grupo fenilo o un grupo naftilo; un grupo arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6, tal como un grupo 4-metilfenilo, grupo 4-metoxifenilo, grupo 4-clorofenilo, grupo 4-trifluorometilfenilo o grupo 4-trifluorometoxifenilo; un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxadiazolilo, grupo tiadiazolilo o un grupo

tetrazolilo; un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros tal como un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo o un grupo triazinilo; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; o un grupo ciano.

[0036]

Ejemplos del "grupo cicloalquilo C3-6" en X^1 pueden incluir un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo y un grupo ciclohexilo.

Ejemplos del "grupo cicloalquiloxi C3-6" en X^1 pueden incluir un grupo ciclopropiloxi, un grupo ciclobutiloxi, un grupo ciclopentiloxi y un grupo ciclohexiloxi.

[0037]

Ejemplos del "grupo arilo C6-10" en X^1 pueden incluir un grupo fenilo, un grupo naftilo, un grupo indanilo, un grupo indenilo y un grupo tetralinilo.

Ejemplos del "grupo ariloxi C6-10" en X^1 pueden incluir un grupo fenoxi y un grupo naftoxi.

[0038]

Ejemplos del "grupo ariltio C6-10" en X^1 pueden incluir un grupo feniltio y un grupo naftiltio.

Ejemplos del "grupo arilsulfinilo C6-10" en X^1 pueden incluir un grupo fenilsulfinilo y un grupo naftilsulfinilo.

Ejemplos del "grupo arilsulfonilo C6-10" en X^1 pueden incluir un grupo fenilsulfonilo un grupo naftilsulfonilo.

[0039]

El "grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros" en X^1 es un

grupo que incluye 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre como átomo(s) constituyente(s) del anillo. Cuando se incluyen dos o más heteroátomos, los heteroátomos pueden ser iguales o diferentes. Ejemplos del "grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros" pueden incluir un grupo heterociclilo saturado de anillo de 5 a 6 miembros, un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros y un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 a 6 miembros.

[0040]

Ejemplos del grupo heterociclilo saturado de anillo de 5 a 6 miembros pueden incluir un grupo pirrolidinilo, un grupo tetrahidrofuranilo, un grupo tiazolidinilo, un grupo tetrahidro-2H-piranilo, un grupo piperidilo, un grupo piperazinilo, un grupo morfolinilo, un grupo dioxolanilo y un grupo dioxanilo.

Ejemplos del grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros pueden incluir un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxadiazolilo, un grupo tiadiazolilo y un grupo tetrazolilo; y un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros tal como un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo y un grupo triazinilo.

Ejemplos del grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 a 6 miembros pueden incluir un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolinilo, un grupo dihidrofuranilo, un grupo imidazolinilo, un grupo pirazolinilo y un grupo oxazolinilo; y un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 6 miembros tal como un grupo isoxazolinilo y un grupo dihidropiranilo.

[0041]

El "grupo heterocicliloxi de anillo de 5 a 6 miembros" en X^1 tiene una estructura en la que un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6

miembros está unido a un grupo oxi. Ejemplos específicos del mismo pueden incluir un grupo tiazoliloxi y un grupo piridiloxi.

[0042]

El sustituyente del "grupo cicloalquilo C3-6", el "grupo cicloalquiloxi C3-6", el "grupo arilo C6-10", el "grupo ariloxi C6-10", el "grupo ariltio C6-10", el "grupo arilsulfinilo C6-10", el "grupo arilsulfonilo C6-10", el "grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros", o el "grupo heterocicliloxi de anillo de 5 a 6 miembros" en X^1 es preferiblemente un grupo halógeno tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo; un grupo alquilo C1-6 tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo o un grupo n-hexilo; un grupo haloalquilo C1-6 tal como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo o un grupo 1-fluoro-n-butilo; un grupo hidroxi; un grupo alcoxi C1-6 tal como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi y un grupo t-butoxi; un grupo haloalcoxi C1-6 tal como un grupo 2-cloro-n-propoxi, un grupo 2,3-diclorobutoxi y un grupo trifluorometoxi; un grupo arilo C6-10 tal como un grupo fenilo o un grupo naftilo; un grupo arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6, tal como un grupo 4-metilfenilo, un grupo 4-metoxifenilo, grupo 4-clorofenilo, grupo 4-trifluorometilfenilo o un grupo 4-trifluorometoxifenilo; un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxadiazolilo, grupo tiadiazolilo o grupo tetrazolilo; un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo

heteroarilo de anillo de 6 miembros tal como un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo o un grupo triazinilo; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; o un grupo ciano.

Además, como sustituyente en el "grupo cicloalquilo C3-6", el "grupo cicloalquiloxi C3-6", el "grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros", o el "grupo heterocicliloxi de anillo de 5 a 6 miembros", también se prefiere el grupo oxo.

[0043]

En el "grupo representado por R^1-CO-" en X^1, R^1 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido.

[0044]

Ejemplos del "grupo alquilo C1-6" en R^1 pueden incluir un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo n-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo n-hexilo, un grupo i-propilo, un grupo i-butilo, un grupo s-butilo, un grupo t-butilo, un grupo i-pentilo, un grupo neopentilo, un grupo 2-metilbutilo y un grupo i-hexilo.

Ejemplos del "grupo alquenilo C2-6" en R^1 pueden incluir un grupo vinilo y un grupo 1-propenilo.

Ejemplos del "grupo alquinilo C2-6" en R^1 pueden incluir un grupo etinilo y un grupo 1-propinilo.

El sustituyente en el "grupo alquilo C1-6", el "grupo alquenilo C2-6", o el "grupo alquinilo C2-6" in R^1 es preferiblemente un grupo halógeno tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo; un grupo hidroxi; un grupo alcoxi C1-6 tal como un grupo metoxi, un grupo

etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi o un grupo t-butoxi; un grupo haloalcoxi C1-6 tal como un grupo 2-cloro-n-propoxi, un grupo 2,3-diclorobutoxi o un grupo trifluorometoxi; un grupo cicloalquilo C3-6 tal como un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, o un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo; un grupo arilo C6-10 tal como un grupo fenilo o un grupo naftilo; un grupo arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6, tal como un grupo 4-metilfenilo, grupo 4-metoxifenilo, grupo 4-clorofenilo, grupo 4-trifluorometilfenilo o grupo 4-trifluorometoxifenilo; un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxadiazolilo, grupo tiadiazolilo o un grupo tetrazolilo; un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros tal como un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo o un grupo triazinilo; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; o un grupo ciano.

[0045]

Ejemplos del "grupo cicloalquilo C3-6" en R^1 pueden incluir un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo y un grupo ciclohexilo.

Ejemplos del "grupo arilo C6-10" en R^1 pueden incluir un grupo fenilo, un grupo naftilo, un grupo indenilo, un grupo indanilo y un grupo tetralinilo.

[0046]

El "grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros" en R^1 es un grupo que incluye 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre como átomo(s) constituyente(s) del anillo. Cuando se incluyen dos o más heteroátomos, los heteroátomos pueden ser iguales o diferentes. Ejemplos del "grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros" pueden incluir un grupo heterociclilo saturado de anillo de 5 a 6 miembros, un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros y un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 a 6 miembros.

Ejemplos del grupo heterociclilo saturado de anillo de 5 a 6 miembros pueden incluir un grupo pirrolidinilo, un grupo tetrahidrofuranilo, un grupo tiazolidinilo, un grupo tetrahidro-2H-piranilo, un grupo piperidilo, un grupo piperazinilo, un grupo morfolinilo, un grupo dioxolanilo y un grupo dioxanilo.

Ejemplos del grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros pueden incluir un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxadiazolilo, un grupo tiadiazolilo y un grupo tetrazolilo; y un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros tal como un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo y un grupo triazinilo.

Ejemplos del grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 a 6 miembros incluyen un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolinilo, un grupo dihidrofuranilo, un grupo imidazolinilo, un grupo pirazolinilo y un grupo oxazolinilo; y un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 6 miembros tal como un grupo isoxazolinilo y un grupo dihidropiranilo.

[0047]

El sustituyente en el "grupo cicloalquilo C3-6", el "grupo arilo C6-10" o el "grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros" en R^1 es

preferiblemente un grupo halógeno tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo; un grupo alquilo C1-6 tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo o un grupo n-hexilo; un grupo haloalquilo C1-6 tal como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo o un grupo 1-fluoro-n-butilo; un grupo hidroxi; un grupo alcoxi C1-6 tal como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, o un grupo i-butoxi, o un grupo t-butoxi; un grupo haloalcoxi C1-6 tal como un grupo 2-cloro-n-propoxi, un grupo 2,3-diclorobutoxi o un grupo trifluorometoxi; un grupo arilo C6-10 tal como un grupo fenilo o un grupo naftilo; un grupo arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6, tal como un grupo 4-metilfenilo, un grupo 4-metoxifenilo, grupo 4-clorofenilo, grupo 4-trifluorometilfenilo o un grupo 4-trifluorometoxifenilo; un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxadiazolilo, grupo tiadiazolilo o grupo tetrazolilo; un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros tal como un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo o un grupo triazinilo; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; o un grupo ciano.

Además, como sustituyente en el "grupo cicloalquilo C3-6" o el

"grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros", también se prefiere un grupo oxo.

[0048]

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^1-CO-" pueden incluir un grupo formilo, un grupo acetilo, un grupo propionilo, un grupo butirilo y un grupo i-propilcarbonilo.

[0049]

En el "grupo representado por R^2-O-CO-" en X^1, R^2 representa un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido.

Ejemplos específicos del sustituyente en R^2 pueden incluir los mismos que los ejemplificados para R^1.

[0050]

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^2-O-CO-" pueden incluir un grupo metoxicarbonilo, un grupo etoxicarbonilo y un grupo t-butoxicarbonilo.

[0051]

En el "grupo representado por R^3R^4N-" en X^1, R^3 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido, y R^4 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido.

Ejemplos específicos del sustituyente en R^3 o R^4 pueden incluir los mismos que los ejemplificados para R^1.

[0052]

Aquí, R^3 y R^4 juntos pueden formar un grupo orgánico divalente.

Ejemplos del grupo orgánico divalente que se puede formar pueden incluir un grupo alquileno C2-5 sustituido o no sustituido o un grupo alquileneoxi C1-3 alquileno C1-3 sustituido o no sustituido.

Ejemplos del "grupo alquileno C2-5" pueden incluir un grupo dimetileno, un grupo trimetileno y un grupo tetrametileno.

Ejemplos del "grupo alquilenoxi C1-3 alquileno C1-3" pueden incluir un grupo dimetilenoxidimetileno.

El sustituyente en el "grupo alquileno C2-5" o en el "grupo alquilenoxi C1-3 alquileno C1-3" es preferiblemente un grupo halógeno, tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo; un grupo alquilo C1-6 tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo o un grupo t-butilo; o un grupo haloalquilo C1-6 tal como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo, o un grupo 1-fluoro-n-butilo.

[0053]

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^3R^4N-" pueden incluir un grupo amino, un grupo metilamino, un grupo dimetilamino y un grupo i-propilamino.

[0054]

En el "grupo representado por R^3R^4N-CO-" en X^1, R^3 y R^4 tienen el mismo significado que los del anterior "grupo representado por R^3R^4N-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^3R^4N-CO-" pueden incluir un grupo carbamoílo, un grupo N,N-dimetilaminocarbonilo, un grupo N-(i-propil) aminocarbonilo y un grupo N-(i-propil)-N-metilaminocarbonilo.

[0055]

En el "grupo representado por R^1-CO-O-" en X^1, R^1 representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^1-CO-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^1-CO-O-"

pueden incluir un grupo acetiloxi y un grupo i-propilcarboniloxi.

[0056]

En el "grupo representado por R^1-CO-NR^5-" en X^1, R^1 representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^1-CO-".

R^5 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido.

Ejemplos específicos del sustituyente en R^5 pueden incluir los mismos que los ejemplificados para R^1.

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^1-CO-NR^5-" pueden incluir un grupo acetilamino y un grupo i-propilcarbonilamino.

[0057]

En el "grupo representado por R^2-O-CO-O-" en X^1, R^2 representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^2-O-CO-".

Los ejemplos específicos del "grupo representado por R^2-O-CO-O-" pueden incluir un grupo metoxicarboniloxi y un grupo etoxicarboniloxi.

[0058]

En el "grupo representado por R^2-O-CO-NR^5-" en X^1, R^2 representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^2-O-CO-". R^5 representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^1-CO-NR^5-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^2-O-CO-NR^5-" pueden incluir un grupo metoxicarbonilamino.

[0059]

En el "grupo representado por R^3R^4N-CO-O-" en X^1, R^3 y R^4 tienen el mismo significado que los del anterior "grupo representado por R^3R^4N-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^3R^4N-CO-O-" pueden incluir un grupo carbamoiloxi y un grupo N,N-dimetilaminocarboniloxi.

[0060]

En el "grupo representado por R^3R^4N-CO-NR^5-" en X^1, R^3 y R^4 tienen el mismo significado que los del anterior "grupo representado por

R^3R^4N-". R^5 representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^1-CO-NR^5-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^3R^4N-CO-NR^5-" pueden incluir un grupo carbamoilamino y un grupo N,N-dimetilaminocarbonilamino.

[0061]

En el "grupo representado por R^2SO_2-NR^5-" en X^1, R^2 representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^2-O-CO-". R^5 representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^1-CO-NR^5-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^2SO_2-NR^5-" pueden incluir un grupo metanosulfonilamino.

[0062]

En el "grupo representado por R^3R^4N-SO_2-" en X_1, R^3 y R^4 tienen el mismo significado que los del anterior "grupo representado por R^3R^4N-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^3R^4N-SO_2-" pueden incluir un grupo N,N-dimetilaminosulfonilo.

[0063]

En el "grupo representado por R^1O-N=CR^6-" en X^1, R^1 representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^1-CO-".

R^6 representa un átomo de hidrógeno, un grupo halógeno, un grupo amino, un grupo mono-alquilamino C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo di-alquilamino C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiltio C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido.

Ejemplos específicos del "grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido" o el "grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido" en R^6 pueden incluir los mismos que los ejemplificados para R^1.

Ejemplos del "grupo halógeno" en R^6 pueden incluir un grupo

fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo y un grupo yodo.

Ejemplos del "grupo mono-alquilamino C1-6" del "grupo mono-alquilamino C1-6 sustituido o no sustituido" en R^6 pueden incluir un grupo metilamino, un grupo etilamino y un grupo i-propilamino.

Ejemplos del "grupo di-alquilamino C1-6" del "grupo di-alquilamino C1-6 sustituido o no sustituido" en R^6 pueden incluir un grupo dimetilamino, un grupo dietilamino y un grupo N-metil-N-i-propilamino.

Ejemplos del "grupo alcoxi C1-6" del "grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido" en R^6 pueden incluir un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo n-pentiloxi, un grupo n-hexiloxi, un grupo i-propoxi, un grupo i-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo t-butoxi y un grupo i-hexiloxi.

Ejemplos del "grupo alquiltio C1-6" en el "grupo alquiltio C1-6 sustituido o no sustituido" en R^6 pueden incluir un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo n-propiltio, un grupo n-butiltio, un grupo n-pentiltio, un grupo n-hexiltio y un grupo i-propiltio.

Ejemplos del sustituyente en el "grupo alcoxi C1-6", el "grupo mono-alquilamino C1-6", el "grupo di-alquilamino C1-6" o el "grupo alquiltio C1-6" en R^6 pueden incluir lo mismo que los sustituyentes en el "grupo alquilo C1-6" ejemplificados para R^1.

Ejemplos específicos del "grupo representado por $R^1O\text{-}N{=}CR^6\text{-}$" pueden incluir un grupo (hidroxiimino)metilo, un grupo (etoxiimino)metilo y un grupo 1-(i-propoxiimino)etilo.

[0064]

En la presente invención, los ejemplos de X^1 preferidos pueden incluir un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido. Como X^1, se prefiere adicionalmente un átomo de hidrógeno.

[0065]

[X^2]

X^2 representa un grupo representado por $R^1O\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, un grupo representado por $R^1CO\text{-}O\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, un grupo representado por $R^3R^4N\text{-}$

CO-O-N=CR^6-, un grupo representado por R^3R^4N-N=CR^6-, o un grupo representado por R^7-N=CR^6-.

R^1, R^3, R^4, y R^6 tienen el mismo significado que aquellos en X^1.

R^7 representa un grupo heterociclilo de anillo de 5 miembros sustituido o no sustituido.

Ejemplos específicos del sustituyente en X^2 pueden incluir los mismos que los ejemplificados para X^1.

El "grupo heterociclilo de anillo de 5 miembros" en R^7 incluye de 1 a 4 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre como átomo(s) constituyente(s) del anillo. Ejemplos del "grupo heterociclilo de anillo de 5 miembros" pueden incluir un grupo heterociclilo saturado de anillo de 5 miembros, un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros y un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 miembros.

Ejemplos del grupo heterociclilo saturado con anillo de 5 miembros pueden incluir un grupo pirrolidinilo, un grupo tetrahidrofuranilo, un grupo tiazolidinilo y un grupo dioxolanilo.

Ejemplos del grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros pueden incluir un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxadiazolilo, un grupo tiadiazolilo y un grupo tetrazolilo.

Ejemplos del grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 miembros incluyen un grupo pirrolinilo, un grupo dihidrofuranilo, un grupo imidazolinilo, un grupo pirazolinilo y un grupo oxazolinilo.

[0066]

El sustituyente en el "grupo heterociclilo de anillo de 5 miembros" en R^7 es preferiblemente un grupo halógeno tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo; un grupo alquilo C1-6 tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo, un grupo t-

butilo, un grupo n-pentilo o un grupo n-hexilo; un grupo haloalquilo C1-6 tal como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo o un grupo 1-fluoro-n-butilo; un grupo hidroxi; un grupo alcoxi C1-6 tal como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi, o un grupo t-butoxi; un grupo haloalcoxi C1-6 tal como un grupo 2-cloro-n-propoxi, un grupo 2,3-diclorobutoxi o un grupo trifluorometoxi; un grupo arilo C6-10 tal como un grupo fenilo o un grupo naftilo; un grupo arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6, tal como un grupo 4-clorofenilo, un grupo 4-trifluorometilfenilo o un grupo 4-trifluorometoxifenilo; un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxadiazolilo, grupo tiadiazolilo o grupo tetrazolilo; un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros tal como un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo o un grupo triazinilo; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; o un grupo ciano.

[0067]

En la presente invención, los ejemplos de X^2 preferidos pueden incluir un grupo representado por R^1O-N=CR^6-.

Como R^1, se prefiere un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido

o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido.

Como R^6, se prefiere un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido.

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^1O-N=CR^6-" pueden incluir un grupo (hidroxiimino)metilo, un grupo (etoxiimino)metilo, un grupo 1-(etoxiimino)etilo y un grupo 1-(i-propoxiimino)etilo.

[0068]

[Q]

Q representa un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 10 miembros sustituido o no sustituido.

[0069]

Ejemplos del "grupo arilo C6-10" en Q pueden incluir un grupo fenilo, un grupo naftilo, un grupo indenilo, un grupo indanilo y un grupo tetralinilo.

[0070]

El "grupo heterociclilo de anillo de 5 a 10 miembros" en Q es un grupo que incluye 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre como átomo(s) constituyente(s) del anillo. Cuando se incluyen dos o más heteroátomos, los heteroátomos pueden ser iguales o diferentes. El grupo puede ser monocíclico o policíclico.

Ejemplos del "grupo heterociclilo de anillo de 5 a 10 miembros" pueden incluir un grupo heterociclilo saturado de anillo de 5 a 6 miembros, un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 10 miembros y un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 a 10 miembros.

[0071]

Ejemplos del grupo heterociclilo saturado de anillo de 5 a 6 miembros pueden incluir un grupo pirrolidinilo, un grupo tetrahidrofuranilo, un grupo tiazolidinilo, un grupo tetrahidro-2H-piranilo, un grupo piperidilo, un grupo piperazinilo, un grupo morfolinilo, un grupo dioxolanilo y un

grupo dioxanilo.

Ejemplos del grupo heteroarilo de anillo de 5 a 10 miembros pueden incluir un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxadiazolilo, un grupo tiadiazolilo y un grupo tetrazolilo; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros tal como un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo y un grupo triazinilo; un grupo heteroarilo de 9 miembros tal como un grupo indolilo, un grupo isoindolilo, un grupo benzofuranilo, un grupo benzotienilo, un grupo indazolilo, un grupo bencimidazolilo, un grupo benzoxazolilo, un grupo benzoisoxazolilo, un grupo benzotiazolilo y un grupo bencisotiazolilo; y un grupo heteroarilo de 10 miembros tal como un grupo quinolinilo, un grupo isoquinolinilo, un grupo cinolinilo, un grupo ftalazinilo, un grupo quinazolinilo y un grupo quinoxalinilo.

Ejemplos del grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 a 10 miembros pueden incluir un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolinilo, un grupo dihidrofuranilo, un grupo imidazolinilo, un grupo pirazolinilo y un grupo oxazolinilo; un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 6 miembros tal como un grupo isoxazolinilo y un grupo dihidropiranilo; un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 9 miembros tal como un grupo indolinilo, un grupo isoindolinilo, un grupo 2,3-dihidrobenzofuranilo y un grupo 1,3-dihidrobenzofuranilo; y un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 10 miembros tal como un grupo 1,2,3,4-tetrahidroquinolinilo.

[0072]

El sustituyente en el "grupo arilo C6-10" o el "grupo heterociclilo de anillo de 5 a 10 miembros" en Q es preferiblemente un grupo halógeno tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo;

un grupo alquilo C1-6 tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo o un grupo n-hexilo; un grupo alquenilo C2-6 tal como un grupo vinilo; un grupo alquinilo C2-6 tal como un grupo etinilo; un grupo haloalquilo C1-6 tal como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo o un grupo 1-fluoro-n-butilo; un grupo alcoxi C1-6 alquilo C1-6 tal como un grupo metoximetilo; un grupo hidroxi; un grupo alcoxi C1-6 tal como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi o un grupo t-butoxi; un grupo hidroxi-alcoxi C1-6 tal como un grupo hidroxietoxi; un grupo alcoxialcoxi C1-6 tal como un grupo metoximetoxi o un grupo metoxietoxi; un grupo sililoxi-alcoxi C1-6 sustituido con tri-alquilo C1-6 tal como un grupo trimetilsililoxietoxi o un grupo t-butildimetilsililoxietoxi; un grupo haloalcoxi C1-6 tal como un grupo 2-cloro-n-propoxi, un grupo 2,3-diclorobutoxi o un grupo trifluorometoxi; un grupo cicloalquilo C3-6 alcoxi C1-6; un grupo arilo C6-10 alcoxi C1-6; un grupo (arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6) alcoxi C1-6; un grupo heteroaril-alcoxi C1-6 de anillo de 5 miembros; un grupo (heteroarilo de anillo de 5 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6) alcoxi C1-6; un grupo heteroarilalcoxi C1-6 de anillo de 6 miembros; un grupo (heteroarilo de anillo de 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6) alcoxi C1-6; un grupo alquiltio C1-6 tal como un grupo metiltio o un grupo etiltio; un grupo alquilsulfinilo C1-6 tal como un grupo metilsulfinilo o un grupo etilsulfinilo; un grupo alquilsulfonilo C1-6 tal como un grupo metilsulfonilo o un grupo etilsulfonilo; un grupo haloalquiltio C1-6 tal como un grupo

trifluorometiltio o un grupo 2,2,2-trifluoroetiltio; un grupo haloalquilsulfinilo C1-6 tal como un grupo trifluorometilsulfinilo o un grupo 2,2,2-trifluoroetilsulfinilo; un grupo haloalquilsulfonilo C1-6 tal como un grupo trifluorometilsulfonilo o un grupo 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo; un grupo cicloalquilo C3-6 tal como un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo o un grupo ciclopentilo; un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6, un grupo haloalcoxi C1-6 o un grupo ciano; un grupo cicloalquenilo C3-6 tal como un grupo ciclopropenilo, un grupo ciclobutenilo o un grupo ciclopentenilo; un grupo arilo C6-10 tal como un grupo fenilo o un grupo naftilo; un grupo arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6, tal como un grupo 4-metilfenilo, un grupo 4-metoxifenilo, grupo 4-clorofenilo, un grupo 4-fluorofenilo, un grupo 4-trifluorometilfenilo o un grupo 4-trifluorometoxifenilo; un grupo heterociclilo saturado de anillo de 3 a 4 miembros tal como un grupo aziridinilo, un grupo epoxi, un grupo azetidinilo o un grupo oxetanilo; un grupo heterociclilo saturado de anillo de 3 a 4 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heterociclilo saturado de anillo de 5 a 6 miembros tal como un grupo pirrolidinilo, un grupo tetrahidrofuranilo, un grupo tiazolidinilo, un grupo tetrahidro-2H-piranilo, un grupo piperidilo, un grupo piperazinilo, un grupo morfolinilo, un grupo dioxolanilo o un grupo dioxanilo; un grupo heterociclilo saturado de anillo de 5 a 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un

grupo oxadiazolilo, un grupo tiadiazolilo o grupo tetrazolilo; un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros tal como un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo o un grupo triazinilo; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heterociclilo de anillo de 5 miembros parcialmente insaturado tal como un grupo pirrolinilo, un grupo dihidrofuranilo, un grupo imidazolinilo, un grupo pirazolinilo o un grupo oxazolinilo; un grupo heterociclilo parcialmente saturado de anillo de 5 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heterociclilo parcialmente insaturado anillo de 6 miembros tal como un grupo isoxazolinilo o un grupo dihidropiranilo; un grupo heterociclilo parcialmente saturado de anillo de 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6;

un grupo representado por R^{Q1}-CO- (en donde R^{Q1} representa un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo C1-6; un grupo alquilo C1-6 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo halógeno, un grupo alcoxi C1-6, un grupo haloalcoxi C1-6, un grupo cicloalquilo C3-6, un grupo fenilo, o un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros; un grupo (arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6, o un grupo haloalcoxi C1-6) alquilo C1-6; un grupo (heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6) alquilo C1-6; un grupo

alquenilo C2-6, un grupo haloalquenilo C2-6; un grupo alquinilo C2-6; un grupo haloalquinilo C2-6; un grupo cicloalquilo C3-6; un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6, un grupo haloalcoxi C1-6 o un grupo ciano; un grupo arilo C6-10; un grupo arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros; o un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; lo mismo se aplica a R^{Q1} a continuación.);

un grupo carboxi;

un grupo representado por R^{Q2}-O-CO- (en donde R^{Q2} representa un grupo alquilo C1-6; un grupo alquilo C1-6 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo halógeno, un grupo alcoxi C1-6, un grupo haloalcoxi C1-6, un grupo cicloalquilo C3-6, un grupo fenilo, o un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros; un grupo (arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6, o un grupo haloalcoxi C1-6) alquilo C1-6; un grupo (heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6) alquilo C1-6; un grupo alquenilo C2-6, un grupo haloalquenilo C2-6; un grupo alquinilo C2-6; un grupo haloalquinilo C2-6; un grupo cicloalquilo C3-6; un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido con un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6, un grupo haloalcoxi C1-6 o un grupo ciano; un grupo arilo C6-10; un grupo arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heteroarilo

de anillo de 5 a 6 miembros; o un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; lo mismo se aplica a R^{Q2} a continuación.);

un grupo representado por $R^{Q1}R^{Q1}N$- (en donde R^{Q1} en la fórmula puede ser el mismo o diferente; R^{Q1} juntos pueden formar un grupo trimetileno, un grupo tetrametileno, un grupo pentametileno o un grupo dimetilenoxidimetileno);

un grupo representado por $R^{Q1}R^{Q1}N$-CO- (en donde R^{Q1} en la fórmula puede ser el mismo o diferente; R^{Q1} juntos pueden formar un grupo trimetileno, un grupo tetrametileno, un grupo pentametileno o un grupo dimetilenoxidimetileno);

un grupo representado por R^{Q1}-CO-O-; un grupo representado por R^{Q1}-CO-NR^{Q3}- (en donde R^{Q3} representa un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo C1-6; un grupo alquilo C1-6 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo halógeno, un grupo alcoxi C1-6, un grupo haloalcoxi C1-6, un grupo cicloalquilo C3-6, un grupo fenilo o un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros; un grupo (arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6) alquilo C1-6; o un grupo (heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6) alquilo C1-6; lo mismo se aplica a R^{Q3} a continuación.);

un grupo representado por R^{Q2}-O-CO-O-; un grupo representado por R^{Q2}-O-CO-NR^{Q3}-; un grupo representado por $R^{Q1}R^{Q1}$N-CO-O- (en donde R^{Q1} en la fórmula puede ser el mismo o diferente; R^{Q1} juntos pueden juntos un grupo trimetileno, un grupo tetrametileno, un grupo pentametileno o un grupo dimetilenoxidimetileno.);

un grupo representado por $R^{Q1}R^{Q1}$N-CO-NR^{Q3}- (en donde R^{Q1} en la fórmula puede ser el mismo o diferente; R^{Q1} juntos pueden formar un

grupo trimetileno, un grupo tetrametileno, un grupo pentametileno o un grupo dimetilenoxidimetileno); un grupo representado por $R^{Q2}SO_2$-NR^{Q3}-; un grupo representado por $R^{Q1}R^{Q1}N$-SO_2- (en donde R^{Q1} en la fórmula puede ser el mismo o diferente; R^{Q1} juntos pueden formar un grupo trimetileno, un grupo tetrametileno, un grupo pentametileno o un grupo dimetilenoxidimetileno.);

un grupo representado por R^{Q1}-O-N=C(R^{Q4})- (en donde R^{Q4} representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-6); un grupo representado por $(R^{Q1})_2$C=N-O- (en donde R^{Q1} en la fórmula puede ser el mismo o diferente; R^{Q1} juntos pueden formar un grupo trimetileno, un grupo tetrametileno, un grupo pentametileno o un grupo dimetilenoxidimetileno.);

un grupo pentafluorosulfanilo, un grupo trimetilsililetinilo, un grupo nitro o un grupo ciano.

Además, como sustituyente en el "grupo heterociclilo de anillo de 5 a 10 miembros", también se prefiere un grupo oxo.

[0073]

[X^3]

X^3 representa un grupo alquilo C1-6 lineal sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 lineal sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 lineal sustituido o no sustituido, un grupo representado por R^1-CO-, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 4 a 6 miembros sustituido o no sustituido.

[0074]

Ejemplos del "grupo alquilo C1-6 lineal" en X^3 pueden incluir un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo n-butilo, un grupo n-pentilo y un grupo n-hexilo.

Ejemplos del "grupo alquenilo C2-6 lineal" en X^3 pueden incluir un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 1-pentenilo,

un grupo 2-pentenilo, un grupo 3-pentenilo, un grupo 4-pentenilo, un grupo 1-hexenilo, un grupo 2-hexenilo, un grupo 3-hexenilo, un grupo 4-hexenilo y un grupo 5-hexenilo.

Ejemplos del "grupo alquinilo C2-6 lineal" en X^3 pueden incluir un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 1-pentinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo, un grupo 4-pentinilo y un grupo 1-hexinilo.

Ejemplos del "grupo heterociclilo de anillo de 4 miembros" en X^3 pueden incluir un grupo azetidinilo y un grupo oxetanilo.

Ejemplos específicos de otros sustituyentes en X^3 pueden incluir los mismos que los ejemplificados para X^1.

[0075]

En la presente invención, los ejemplos de X^3 preferidos pueden incluir un grupo alquilo C1-6 lineal sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido.

[0076]

Ejemplos de un sustituyente en el grupo alquilo C1-6 lineal, un sustituyente en el grupo alquenilo C2-6 lineal, un sustituyente en el grupo alquinilo C2-6 lineal, un sustituyente en el grupo cicloalquilo C3-6, un sustituyente en el grupo arilo C6-10, o un sustituyente en el grupo heterociclilo del anillo de 4 a 6 miembros puede incluir uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes a continuación (en lo sucesivo, este sustituyente a veces se denomina con un símbolo "G").

Cuando están presentes dos o más sustituyentes (G), dos de los sustituyentes juntos pueden formar un grupo orgánico divalente. El grupo de sustituyentes se muestra a continuación:

un grupo halógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6

sustituido o no sustituido, un grupo hidroxi, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alqueniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiltio C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfinilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfonilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquiloxi C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo ariloxi C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo ariltio C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo arilsulfinilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo arilsulfonilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo heterociclilo de anillo de 3 a 10 miembros sustituido o no sustituido, un grupo heterocicliloxi de anillo de 3 a 10 miembros sustituido o no sustituido, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo representado por R^a-CO-, un grupo carboxi, un grupo representado por R^b-O-CO-, un grupo representado por R^cR^dN-, un grupo representado por R^cR^dN-CO-, un grupo representado por R^cR^dN-NR^d-CO-, un grupo representado por R^a-CO-O-, un grupo representado por R^a-CO-NR^e-, un grupo representado por R^a-CO-CO-NR^e-, un grupo representado por R^a-CO-NR^e-NR^e-, un grupo representado por R^a-CO-NR^e-NR^e-CO-, un grupo representado por R^b-O-CO-O-, un grupo representado por R^b-O-CO-NR^e-, un grupo representado por R^cR^dN-CO-O-, un grupo representado por R^cR^dN-CO-NR^e-, un grupo representado por R^cR^dN-CO-CO-NR^e-, un grupo representado por R^a-CS-NR^e-, un grupo representado por R^cR^dN-CS-NR^e-, un grupo representado por R^bSO_2-NR^e-, un grupo representado por R^cR^dN-SO_2-, un grupo representado por R^aO-N=CR^f-, un grupo representado por R^hR^jC=N-O-, un grupo representado por R^a-C(=NR^g)-NR^e-, un grupo representado por R^cR^dN-C(=NR^g)-, un grupo representado por R^hR^iS(=O)=N-CO-, y un grupo representado por R^hR^iS=N-CO-.

[0077]

En el grupo de sustituyentes descrito anteriormente, cada Ra representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo

C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 3 a 10 miembros sustituido o no sustituido.

Cada R^b representa independientemente un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido.

Cada R^c representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido.

Cada R^d representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, donde R^c y R^d juntos pueden formar un grupo orgánico divalente.

Cada R^e representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido.

R^f representa un átomo de hidrógeno, un grupo amino o un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido.

Cada R^g representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido.

Cada R^h representa independientemente un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido.

Cada R^i representa independientemente un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, donde R^h y R^i juntos pueden formar un grupo orgánico divalente.

[0078]

Ejemplos del "grupo halógeno" en G pueden incluir un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo y un grupo yodo.

[0079]

El "grupo alquilo C1-6" en G puede ser una cadena lineal o puede ser una cadena ramificada.

Ejemplos del "grupo alquilo C1-6" en G pueden incluir un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo n-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo n-hexilo, un grupo i-propilo, un grupo i-butilo, un grupo s-butilo, un grupo t-butilo, un grupo i-pentilo, un grupo neopentilo, un grupo 2-metilbutilo y un grupo i-hexilo.

[0080]

Ejemplos del “grupo alquenilo C2-6” en G pueden incluir un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 1-pentenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 3-pentenilo, un grupo 4-pentenilo, un grupo 1-metil-2-butenilo, un grupo 2-metil-2-butenilo, un grupo 1-hexenilo, un grupo 2-hexenilo, un grupo 3-hexenilo, un grupo 4-hexenilo y un grupo 5-hexenilo.

[0081]

Ejemplos del “grupo alquinilo C2-6” en G pueden incluir un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 1-metil-2-propinilo, un grupo 2-metil-3-butinilo, un grupo 1-pentinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo, un grupo 4-pentinilo, un grupo 1-metil-2-butinilo, un grupo 2-metil-3-pentinilo, un grupo 1-hexinilo y un grupo 1,1-dimetil-2-butinilo.

[0082]

Ejemplos del "grupo alcoxi C1-6" en G pueden incluir un grupo

metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo n-pentiloxi, un grupo n-hexiloxi, un grupo i-propoxi, un grupo i-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo t-butoxi y un grupo i-hexiloxi.

Ejemplos del "grupo alqueniloxi C2-6" en G pueden incluir un grupo viniloxi, un grupo aliloxi, un grupo propeniloxi y un grupo buteniloxi.

Ejemplos del "grupo alquiniloxi C2-6" en G pueden incluir un grupo etiniloxi y un grupo propargiloxi.

[0083]

Ejemplos del "grupo alquiltio C1-6" en G pueden incluir un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo n-propiltio, un grupo n-butiltio, un grupo n-pentiltio, un grupo n-hexiltio y un grupo i-propiltio.

Ejemplos del "grupo alquilsulfinilo C1-6" en G pueden incluir un grupo metilsulfinilo, un grupo etilsulfinilo y un grupo t-butilsulfinilo.

Ejemplos del "grupo alquilsulfonilo C1-6" en G pueden incluir un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo y un grupo t-butilsulfonilo.

[0084]

El sustituyente en el "grupo alquilo C1-6", el "grupo alquenilo C2-6", el "grupo alquinilo C2-6", el "grupo alcoxi C1-6", el "grupo alqueniloxi C2-6", el "grupo alquiniloxi C2-6", el "grupo alquiltio C1-6", el "grupo alquilsulfinilo C1-6" o el "grupo alquilsulfonilo C1-6" en G es preferiblemente un grupo halógeno tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo; un grupo hidroxi; un grupo alcoxi C1-6 tal como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi o un grupo t-butoxi; un grupo haloalcoxi C1-6 tal como un grupo 2-cloro-n-propoxi, un grupo 2,3-diclorobutoxi o un grupo trifluorometoxi; un grupo alquiltio C1-6 tal como un grupo metiltio o un grupo etiltio; un grupo alquilsulfinilo C1-6 tal como un grupo metilsulfinilo o un grupo etilsulfinilo; un grupo alquilsulfonilo C1-6 tal como un grupo metilsulfonilo o un grupo etilsulfonilo; un grupo cicloalquilo C3-6 tal como un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo o un grupo ciclohexilo; un grupo

arilo C6-10 tal como un grupo fenilo o un grupo naftilo; un grupo arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6, tal como un grupo 4-metilfenilo, grupo 4-metoxifenilo, grupo 4-clorofenilo, grupo 4-trifluorometilfenilo o grupo 4-trifluorometoxifenilo; un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxadiazolilo, grupo tiadiazolilo o un grupo tetrazolilo; un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros tal como un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo o un grupo triazinilo; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; o un grupo ciano.

[0085]

Ejemplos del "grupo cicloalquilo C3-6" en G pueden incluir un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo y un grupo ciclohexilo.

Ejemplos del "grupo cicloalquiloxi C3-6" en G pueden incluir un grupo ciclopropiloxi, un grupo ciclobutiloxi, un grupo ciclopentiloxi y un grupo ciclohexiloxi.

[0086]

Ejemplos del "grupo arilo C6-10" en G pueden incluir un grupo fenilo y un grupo naftilo.

Ejemplos del "grupo ariloxi C6-10" en G pueden incluir un grupo fenoxi y un grupo naftoxi.

[0087]

Ejemplos del "grupo ariltio C6-10" en G pueden incluir un grupo feniltio y un grupo naftiltio.

Ejemplos del "grupo arilsulfinilo C6-10" en G pueden incluir un grupo fenilsulfinilo y un grupo naftilsulfinilo.

Ejemplos del "grupo arilsulfonilo C6-10" en G pueden incluir un grupo fenilsulfonilo y un grupo naftilsulfonilo.

[0088]

El "grupo heterociclilo de anillo de 3 a 10 miembros" en G es un grupo que incluye 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre como átomo(s) constituyente(s) del anillo. Cuando se incluyen dos o más heteroátomos, los heteroátomos pueden ser iguales o diferentes. El grupo puede ser monocíclico o policíclico.

Ejemplos del "grupo heterociclilo de anillo de 3 a 10 miembros" pueden incluir un grupo heterociclilo saturado de anillo de 3 a 6 miembros, un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 10 miembros y un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 a 10 miembros.

[0089]

Ejemplos del grupo heterociclilo saturado de anillo de 3 a 6 miembros pueden incluir un grupo aziridinilo, un grupo epoxi, un grupo azetidinilo, un grupo oxetanilo, un grupo pirrolidinilo, un grupo tetrahidrofuranilo, un grupo tiazolidinilo, un grupo tetrahidro-2H-piranilo, un grupo piperidilo, un grupo piperazinilo, un grupo morfolinilo, un grupo dioxolanilo y un grupo dioxanilo.

Ejemplos del grupo heteroarilo de anillo de 5 a 10 miembros pueden incluir un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxadiazolilo, un grupo tiadiazolilo y un grupo tetrazolilo; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros tal como un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo

pirimidinilo, un grupo piridazinilo y un grupo triazinilo; un grupo heteroarilo de 9 miembros tal como un grupo indolilo, un grupo isoindolilo, un grupo benzofuranilo, un grupo benzotienilo, un grupo indazolilo, un grupo bencimidazolilo, un grupo benzoxazolilo, un grupo benzoisoxazolilo, un grupo benzotiazolilo y un grupo bencisotiazolilo; y un grupo heteroarilo de 10 miembros tal como un grupo quinolinilo, un grupo isoquinolinilo, un grupo cinolinilo, un grupo ftalazinilo, un grupo quinazolinilo y un grupo quinoxalinilo.

Ejemplos del grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 a 10 miembros pueden incluir un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolinilo, un grupo dihidrofuranilo, un grupo imidazolinilo, un grupo pirazolinilo y un grupo oxazolinilo; un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 6 miembros tal como un grupo isoxazolinilo y un grupo dihidropiranilo; un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 9 miembros tal como un grupo indolinilo, un grupo isoindolinilo, un grupo 2,3-dihidrobenzofuranilo y un grupo 1,3-dihidrobenzofuranilo; y un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 10 miembros tal como un grupo 1,2,3,4-tetrahidroquinolinilo.

[0090]

El "grupo heterocicliloxi de anillo de 3 a 10 miembros" en G tiene una estructura en la que un grupo heterociclilo de anillo de 3 a 10 miembros está unido a un grupo oxi. Ejemplos específicos del mismo pueden incluir un grupo tiazoliloxi y un grupo piridiloxi.

[0091]

El sustituyente en el "grupo cicloalquilo C3-6", el "grupo cicloalquiloxi C3-6", el "grupo arilo C6-10", el "grupo ariloxi C6-10", el "grupo ariltio C6-10", el "grupo arilsulfinilo C6-10", el "grupo arilsulfonilo C6-10", el "grupo heterociclilo de anillo de 3 a 10 miembros", o el "grupo heterocicliloxi de anillo de 3 a 10 miembros" en G es preferiblemente un grupo halógeno tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo

o un grupo yodo; un grupo alquilo C1-6 tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo o un grupo n-hexilo; un grupo haloalquilo C1-6 tal como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo o un grupo 1-fluoro-n-butilo; un grupo hidroxi; un grupo alcoxi C1-6 tal como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi o un grupo t-butoxi; un grupo haloalcoxi C1-6 tal como un grupo 2-cloro-n-propoxi, un grupo 2,3-diclorobutoxi o un grupo trifluorometoxi; un grupo cicloalquilo C3-6 alcoxi C1-6; un grupo arilo C6-10 alcoxi C1-6; un grupo (arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6) alcoxi C1-6; un grupo heteroaril-alcoxi C1-6 de anillo de 5 miembros; un grupo (heteroarilo de anillo de 5 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6) alcoxi C1-6; un grupo heteroaril-alcoxi C1-6 de anillo de 6 miembros; un grupo (heteroarilo de anillo de 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6) alcoxi C1-6; un grupo alquiltio C1-6 tal como un grupo metiltio o un grupo etiltio; un grupo alquilsulfinilo C1-6 tal como un grupo metilsulfinilo o un grupo etilsulfinilo; un grupo alquilsulfonilo C1-6 tal como un grupo metilsulfonilo o un grupo etilsulfonilo; un grupo haloalquiltio C1-6 tal como un grupo trifluorometiltio o un grupo 2,2,2-trifluoroetiltio; un grupo haloalquilsulfinilo C1-6 tal como un grupo trifluorometilsulfinilo o un grupo 2,2,2-trifluoroetilsulfinilo; un grupo haloalquilsulfonilo C1-6 tal como un grupo trifluorometilsulfonilo o un grupo 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo; un grupo cicloalquilo C3-6 tal como un grupo ciclopropilo o un grupo ciclobutilo; un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido con uno o más sustituyentes de un

grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6, un grupo haloalcoxi C1-6 o un grupo ciano; un grupo cicloalquenilo C3-6; un grupo arilo C6-10 tal como un grupo fenilo o un grupo naftilo; un grupo arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6, tal como un grupo 4-metilfenilo, grupo 4-metoxifenilo, grupo 4-clorofenilo, un grupo 4-trifluorometilfenilo o un grupo 4-trifluorometoxifenilo; un grupo heterociclilo saturado de anillo de 3 a 4 miembros tal como un grupo aziridinilo, un grupo epoxi, un grupo azetidinilo o un grupo oxetanilo; un grupo heterociclilo saturado de anillo de 3 a 4 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heterociclilo saturado de anillo de 5 a 6 miembros tal como un grupo pirrolidinilo, un grupo tetrahidrofuranilo, un grupo tiazolidinilo, un grupo tetrahidro-2H-piranilo, un grupo piperidilo, un grupo piperazinilo, un grupo morfolinilo, un grupo dioxolanilo o un grupo dioxanilo; un grupo heterociclilo saturado de anillo de 5 a 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxadiazolilo, grupo tiadiazolilo o grupo tetrazolilo; un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros tal como un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo o un grupo triazinilo; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi

C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolinilo, un grupo dihidrofuranilo, un grupo imidazolinilo, un grupo pirazolinilo o un grupo oxazolinilo; un grupo heterociclilo parcialmente saturado de anillo de 5 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 6 miembros tal como un grupo isoxazolinilo o un grupo dihidropiranilo; un grupo heterociclilo parcialmente saturado de anillo de 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6;

un grupo representado por R^{G1}-CO- (en donde R^{G1} representa un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo C1-6; un grupo alquilo C1-6 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo halógeno, un grupo alcoxi C1-6, un grupo haloalcoxi C1-6, un grupo cicloalquilo C3-6, un grupo fenilo, o un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros; un grupo (arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6, o un grupo haloalcoxi C1-6) alquilo C1-6; un grupo (heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6) alquilo C1-6; un grupo alquenilo C2-6, un grupo haloalquenilo C2-6; un grupo alquinilo C2-6; un grupo haloalquinilo C2-6; un grupo cicloalquilo C3-6; un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6, un grupo haloalcoxi C1-6 o un grupo ciano; un grupo arilo C6-10; un grupo arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6

miembros; o un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; lo mismo se aplica a R^{G1} a continuación.);

un grupo carboxi;

un grupo representado por R^{G2}-O-CO- (en donde R^{G2} representa un grupo alquilo C1-6; un grupo alquilo C1-6 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo halógeno, un grupo alcoxi C1-6, un grupo haloalcoxi C1-6, un grupo cicloalquilo C3-6, un grupo fenilo, o un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros; un grupo (arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6, o un grupo haloalcoxi C1-6) alquilo C1-6; un grupo (heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6) alquilo C1-6; un grupo alquenilo C2-6, un grupo haloalquenilo C2-6; un grupo alquinilo C2-6; un grupo haloalquinilo C2-6; un grupo cicloalquilo C3-6; un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido con un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6, un grupo haloalcoxi C1-6 o un grupo ciano; un grupo arilo C6-10; un grupo arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros; o un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; lo mismo se aplica a R^{G2} a continuación.);

un grupo representado por $R^{G1}R^{G1}N$- (en donde R^{G1} en la fórmula puede ser el mismo o diferente; R^{G1} juntos pueden formar un grupo trimetileno, un grupo tetrametileno, un grupo pentametileno o un grupo dimetilenoxidimetileno);

un grupo representado por $R^{G1}R^{G1}N$-CO- (en donde R^{G1} en la fórmula puede ser el mismo o diferente; R^{G1} juntos pueden formar un grupo trimetileno, un grupo tetrametileno, un grupo pentametileno o un grupo dimetilenoxidimetileno);

un grupo representado por R^{G1}-CO-O-; un grupo representado por R^{G1}-CO-NR^{G3}- (en donde R^{G3} representa un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo C1-6; un grupo alquilo C1-6 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo halógeno, un grupo alcoxi C1-6, un grupo haloalcoxi C1-6, un grupo cicloalquilo C3-6, un grupo fenilo o un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros; un grupo (arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6) alquilo C1-6; o un grupo (heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6) alquilo C1-6; lo mismo se aplica a R^{G3} a continuación.);

un grupo representado por R^{G2}-O-CO-O-; un grupo representado por R^{G2}-O-CO-NR^{G3}-; un grupo representado por $R^{G1}R^{G1}N$-CO-O- (en donde R^{G1} en la fórmula puede ser el mismo o diferente; R^{G1} juntos pueden juntos un grupo trimetileno, un grupo tetrametileno, un grupo pentametileno o un grupo dimetilenoxidimetileno.);

un grupo representado por $R^{G1}R^{G1}N$-CO-NR^{G3}- (en donde R^{G1} en la fórmula puede ser el mismo o diferente; R^{G1} juntos pueden formar un grupo trimetileno, un grupo tetrametileno, un grupo pentametileno o un grupo dimetilenoxidimetileno); un grupo representado por $R^{G2}SO_2$-NR^{G3}-; un grupo representado por $R^{G1}R^{G1}N$-SO_2- (en donde R^{G1} en la fórmula puede ser el mismo o diferente; R^{G1} juntos pueden formar un grupo trimetileno, un grupo tetrametileno, un grupo pentametileno o un grupo dimetilenoxidimetileno.);

un grupo representado por R^{G1}-O-N=C(R^{G4})- (en donde R^{G4} representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-6); un grupo

representado por $(R^{G1})_2C=N-O-$ (en donde R^{G1} en la fórmula puede ser el mismo o diferente; R^{G1} juntos pueden formar un grupo trimetileno, un grupo tetrametileno, un grupo pentametileno o un grupo dimetilenoxidimetileno.);

un grupo pentafluorosulfanilo, un grupo nitro o un grupo ciano.

Además, como sustituyente en el "grupo cicloalquilo C3-6", el "grupo cicloalquiloxi C3-6", el "grupo heterociclilo de anillo de 3 a 10 miembros", o el "grupo heterocicliloxi de anillo de 3 a 10 miembros", también se prefiere el grupo oxo.

[0092]

En el "grupo representado por R^a-CO-" en G, Ra representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 3 a 10 miembros sustituido o no sustituido.

[0093]

Ejemplos del "grupo alquilo C1-6" en R^a pueden incluir un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo n-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo n-hexilo, un grupo i-propilo, un grupo i-butilo, un grupo s-butilo, un grupo t-butilo, un grupo i-pentilo, un grupo neopentilo, un grupo 2-metilbutilo y un grupo i-hexilo.

Ejemplos del "grupo alquenilo C2-6" en R^a pueden incluir un grupo vinilo y un grupo 1-propenilo.

Ejemplos del "grupo alquinilo C2-6" en R^a pueden incluir un grupo etinilo y un grupo 1-propinilo.

El sustituyente en el "grupo alquilo C1-6", el "grupo alquenilo C2-6", o el "grupo alquinilo C2-6" en R^a es preferiblemente un grupo halógeno tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo; un grupo hidroxi; un grupo alcoxi C1-6 tal como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo

s-butoxi, un grupo i-butoxi o un grupo t-butoxi; un grupo haloalcoxi C1-6 tal como un grupo 2-cloro-n-propoxi, un grupo 2,3-diclorobutoxi o un grupo trifluorometoxi; un grupo alquiltio C1-6 tal como un grupo metiltio o un grupo etiltio; un grupo alquilsulfinilo C1-6 tal como un grupo metilsulfinilo o un grupo etilsulfinilo; un grupo alquilsulfonilo C1-6 tal como un grupo metilsulfonilo o un grupo etilsulfonilo; un grupo carboxi; un grupo alcoxicarbonilo C1-6 tal como un grupo metoxicarbonilo, un grupo etoxicarbonilo, un grupo n-propoxicarbonilo, un grupo i-propoxicarbonilo, un grupo n-butoxicarbonilo o un grupo t-butoxicarbonilo; un grupo cicloalquilo C3-6 tal como un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo o un grupo ciclohexilo; un grupo arilo C6-10 tal como un grupo fenilo o un grupo naftilo; un grupo arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6, tal como un grupo 4-metilfenilo, grupo 4-metoxifenilo, grupo 4-clorofenilo, grupo 4-trifluorometilfenilo o grupo 4-trifluorometoxifenilo; un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxadiazolilo, grupo tiadiazolilo o un grupo tetrazolilo; un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros tal como un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo o un grupo triazinilo; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; o un grupo ciano.

[0094]

Ejemplos del "grupo cicloalquilo C3-6" en R^a pueden incluir un

grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo y un grupo ciclohexilo.

Ejemplos del "grupo arilo C6-10" en R^a pueden incluir un grupo fenilo, un grupo naftilo, un grupo indenilo, un grupo indanilo y un grupo tetralinilo.

[0095]

El "grupo heterociclilo de anillo de 3 a 10 miembros" en R^a es un grupo que incluye 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre como átomo(s) constituyente(s) del anillo. Cuando se incluyen dos o más heteroátomos, los heteroátomos pueden ser iguales o diferentes. El grupo puede ser monocíclico o policíclico.

Ejemplos del "grupo heterociclilo de anillo de 3 a 10 miembros" pueden incluir un grupo heterociclilo saturado de anillo de 3 a 6 miembros, un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 10 miembros y un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 a 10 miembros.

Ejemplos del grupo heterociclilo saturado de anillo de 3 a 6 miembros pueden incluir un grupo aziridinilo, un grupo epoxi, un grupo azetidinilo, un grupo oxetanilo, un grupo pirrolidinilo, un grupo tetrahidrofuranilo, un grupo tiazolidinilo, un grupo tetrahidro-2H-piranilo, un grupo piperidilo, un grupo piperazinilo, un grupo morfolinilo, un grupo dioxolanilo y un grupo dioxanilo.

Ejemplos del grupo heteroarilo de anillo de 5 a 10 miembros pueden incluir un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxadiazolilo, un grupo tiadiazolilo y un grupo tetrazolilo; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros tal como un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo y un grupo triazinilo; un grupo heteroarilo de 9 miembros tal como un grupo indolilo, un grupo isoindolilo, un grupo

benzofuranilo, un grupo benzotienilo, un grupo indazolilo, un grupo bencimidazolilo, un grupo benzoxazolilo, un grupo benzoisoxazolilo, un grupo benzotiazolilo y un grupo bencisotiazolilo; y un grupo heteroarilo de 10 miembros tal como un grupo quinolinilo, un grupo isoquinolinilo, un grupo cinolinilo, un grupo ftalazinilo, un grupo quinazolinilo y un grupo quinoxalinilo.

Ejemplos del grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 a 10 miembros pueden incluir un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolinilo, un grupo dihidrofuranilo, un grupo imidazolinilo, un grupo pirazolinilo y un grupo oxazolinilo; un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 6 miembros tal como un grupo isoxazolinilo y un grupo dihidropiranilo; un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 9 miembros tal como un grupo indolinilo, un grupo isoindolinilo, un grupo 2,3-dihidrobenzofuranilo y un grupo 1,3-dihidrobenzofuranilo; y un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 10 miembros tal como un grupo 1,2,3,4-tetrahidroquinolinilo.

[0096]

El sustituyente en el "grupo cicloalquilo C3-6", el "grupo arilo C6-10", o el "grupo heterociclilo de anillo de 3 a 10 miembros" en R^a es preferiblemente un grupo halógeno tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo; un grupo alquilo C1-6 tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo o un grupo n-hexilo; un grupo haloalquilo C1-6 tal como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo o un grupo 1-fluoro-n-butilo; un grupo hidroxi; un grupo alcoxi C1-6 tal como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi o un grupo t-butoxi; un grupo haloalcoxi C1-6 tal como un grupo 2-cloro-n-propoxi, un grupo 2,3-diclorobutoxi o un grupo trifluorometoxi; un

grupo cicloalquilo C3-6 alcoxi C1-6; un grupo arilo C6-10 alcoxi C1-6; un grupo (arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6) alcoxi C1-6; un grupo heteroaril-alcoxi C1-6 de anillo de 5 miembros; un grupo (heteroarilo de anillo de 5 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6) alcoxi C1-6; un grupo heteroaril-alcoxi C1-6 de anillo de 6 miembros; un grupo (heteroarilo de anillo de 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6) alcoxi C1-6; un grupo alquiltio C1-6 tal como un grupo metiltio o un grupo etiltio; un grupo alquilsulfinilo C1-6 tal como un grupo metilsulfinilo o un grupo etilsulfinilo; un grupo alquilsulfonilo C1-6 tal como un grupo metilsulfonilo o un grupo etilsulfonilo; un grupo haloalquiltio C1-6 tal como un grupo trifluorometiltio o un grupo 2,2,2-trifluoroetiltio; un grupo haloalquilsulfinilo C1-6 tal como un grupo trifluorometilsulfinilo o un grupo 2,2,2-trifluoroetilsulfinilo; un grupo haloalquilsulfonilo C1-6 tal como un grupo trifluorometilsulfonilo o un grupo 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo; un grupo cicloalquilo C3-6 tal como un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, o un grupo ciclopentilo; un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6, un grupo haloalcoxi C1-6 o un grupo ciano; un grupo cicloalquenilo C3-6; un grupo arilo C6-10 tal como un grupo fenilo o un grupo naftilo; un grupo arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6, tal como un grupo 4-metilfenilo, grupo 4-metoxifenilo, grupo 4-clorofenilo, un grupo 4-trifluorometilfenilo o un grupo 4-trifluorometoxifenilo; un grupo heterociclilo saturado de anillo de 3 a 4 miembros tal como un grupo aziridinilo, un

grupo epoxi, un grupo azetidinilo o un grupo oxetanilo; un grupo heterociclilo saturado de anillo de 3 a 4 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heterociclilo saturado de anillo de 5 a 6 miembros tal como un grupo pirrolidinilo, un grupo tetrahidrofuranilo, un grupo tiazolidinilo, un grupo tetrahidro-2H-piranilo, un grupo piperidilo, un grupo piperazinilo, un grupo morfolinilo, un grupo dioxolanilo o un grupo dioxanilo; un grupo heterociclilo saturado de anillo de 5 a 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxadiazolilo, grupo tiadiazolilo o grupo tetrazolilo; un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros tal como un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo o un grupo triazinilo; un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolinilo, un grupo dihidrofuranilo, un grupo imidazolinilo, un grupo pirazolinilo o un grupo oxazolinilo; un grupo heterociclilo parcialmente saturado de anillo de 5 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 6 miembros tal como un grupo isoxazolinilo o un grupo dihidropiranilo; un grupo

heterociclilo parcialmente saturado de anillo de 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6;

un grupo representado por R^{q1}-CO- (en donde R^{q1} representa un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo C1-6; un grupo alquilo C1-6 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo halógeno, un grupo alcoxi C1-6, un grupo haloalcoxi C1-6, un grupo cicloalquilo C3-6, un grupo fenilo, o un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros; un grupo (arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6, o un grupo haloalcoxi C1-6) alquilo C1-6; un grupo (heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6) alquilo C1-6; un grupo alquenilo C2-6, un grupo haloalquenilo C2-6; un grupo alquinilo C2-6; un grupo haloalquinilo C2-6; un grupo cicloalquilo C3-6; un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6, un grupo haloalcoxi C1-6 o un grupo ciano; un grupo arilo C6-10; un grupo arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros; o un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; lo mismo se aplica a R^{q1} a continuación.);

un grupo carboxi;

un grupo representado por R^{q2}-O-CO- (en donde R^{q2} representa un grupo alquilo C1-6; un grupo alquilo C1-6 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo halógeno, un grupo alcoxi C1-6, un grupo haloalcoxi C1-6, un grupo cicloalquilo C3-6, un grupo fenilo, o un grupo

heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros; un grupo (arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6, o un grupo haloalcoxi C1-6) alquilo C1-6; un grupo (heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6) alquilo C1-6; un grupo alquenilo C2-6, un grupo haloalquenilo C2-6; un grupo alquinilo C2-6; un grupo haloalquinilo C2-6; un grupo cicloalquilo C3-6; un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6, un grupo haloalcoxi C1-6 o un grupo ciano; un grupo arilo C6-10; un grupo arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros; o un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6; lo mismo se aplica a R^{q2} a continuación.);

un grupo representado por $R^{q1}R^{q1}N$- (en donde R^{q1} en la fórmula puede ser el mismo o diferente; R^{q1} juntos pueden formar un grupo trimetileno, un grupo tetrametileno, un grupo pentametileno o un grupo dimetilenoxidimetileno);

un grupo representado por $R^{q1}R^{q1}N$-CO- (en donde R^{q1} en la fórmula puede ser el mismo o diferente; R^{q1} juntos pueden formar un grupo trimetileno, un grupo tetrametileno, un grupo pentametileno o un grupo dimetilenoxidimetileno);

un grupo representado por R^{q1}-CO-O-; un grupo representado por R^{q1}-CO-NR^{q3}- (en donde R^{q3} representa un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo C1-6; un grupo alquilo C1-6 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo halógeno, un grupo alcoxi C1-6, un grupo haloalcoxi C1-6, un

grupo cicloalquilo C3-6, un grupo fenilo o un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros; un grupo (arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6) alquilo C1-6; o un grupo (heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6) alquilo C1-6; lo mismo se aplica a R^{q3} a continuación.);

un grupo representado por R^{q2}-O-CO-O-; un grupo representado por R^{q2}-O-CO-NR^{q3}-; un grupo representado por $R^{q1}R^{q1}$N-CO-O- (en donde R^{q1} en la fórmula puede ser el mismo o diferente; R^{q1} juntos pueden juntos un grupo trimetileno, un grupo tetrametileno, un grupo pentametileno o un grupo dimetilenoxidimetileno.);

un grupo representado por $R^{q1}R^{q1}$N-CO-NR^{q3}- (en donde R^{q1} en la fórmula puede ser el mismo o diferente; R^{q1} juntos pueden formar un grupo trimetileno, un grupo tetrametileno, un grupo pentametileno o un grupo dimetilenoxidimetileno); un grupo representado por $R^{q2}SO_2$-NR^{q3}-; un grupo representado por $R^{q1}R^{q1}$N-SO_2- (en donde R^{q1} en la fórmula puede ser el mismo o diferente; R^{q1} juntos pueden formar un grupo trimetileno, un grupo tetrametileno, un grupo pentametileno o un grupo dimetilenoxidimetileno.);

un grupo representado por R^{q1}-O-N=C(R^{q4})- (en donde R^{q4} representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-6); un grupo representado por $(R^{q1})_2$C=N-O- (en donde R^{q1} en la fórmula puede ser el mismo o diferente; R^{q1} juntos pueden formar un grupo trimetileno, un grupo tetrametileno, un grupo pentametileno o un grupo dimetilenoxidimetileno.);

un grupo pentafluorosulfanilo, un grupo nitro o un grupo ciano.

Además, como sustituyente en el "grupo cicloalquilo C3-6" o el "grupo heterociclilo de anillo de 3 a 10 miembros", también se prefiere un grupo oxo.

[0097]

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^a-CO-" pueden incluir un grupo formilo, un grupo acetilo y un grupo i-propilcarbonilo.

[0098]

En el "grupo representado por R^b-O-CO-" en G, R^b representa un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido.

Ejemplos específicos del sustituyente en R^b pueden incluir los mismos que los ejemplificados para R^a.

[0099]

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^b-O-CO-" pueden incluir un grupo metoxicarbonilo, un grupo etoxicarbonilo, un grupo n-propoxicarbonilo, un grupo i-propoxicarbonilo, un grupo n-butoxicarbonilo y un grupo t-butoxicarbonilo.

[0100]

En el "grupo representado por R^cR^dN-" en G, R^c representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido, y R^d representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido.

Ejemplos específicos del sustituyente en R^c o R^d pueden incluir los mismos que los ejemplificados para R^a.

Ejemplos del "grupo alcoxi C1-6" en R^d pueden incluir un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo n-

pentiloxi, un grupo n-hexiloxi, un grupo i-propoxi, un grupo i-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo t-butoxi y un grupo i-hexiloxi.

El sustituyente del "grupo alcoxi C1-6" en R^d es preferiblemente un grupo halógeno tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo; un grupo hidroxi; un grupo alcoxi C1-6 tal como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi o un grupo t-butoxi; un grupo haloalcoxi C1-6 tal como un grupo 2-cloro-n-propoxi, un grupo 2,3-diclorobutoxi o un grupo trifluorometoxi; un grupo cicloalquilo C3-6 tal como un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo o un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo; un grupo arilo C6-10 tal como un grupo fenilo o un grupo naftilo; un grupo arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6, tal como un grupo 4-metilfenilo, un grupo 4-metoxifenilo, un grupo 4-clorofenilo, un grupo 4-trifluorometilfenilo o un grupo 4-trifluorometoxifenilo; o un grupo ciano.

[0101]

Aquí, R^c y R^d juntos pueden formar un grupo orgánico divalente.

Ejemplos del grupo orgánico divalente que se puede formar pueden incluir un grupo alquileno C2-5 sustituido o no sustituido, un grupo alquilenoxi C1-3 alquileno C1-3 sustituido o no sustituido, un grupo alquilentio C1-3 alquileno C1-3 sustituido o no sustituido, o un grupo alquilenimino C1-3 alquileno C1-3 sustituido o no sustituido.

Otros ejemplos pueden incluir un grupo hidrocarburo divalente que contiene silicio tal como $-CH_2CH_2-Si(CH_3)_2-CH_2CH_2-$.

Ejemplos del "grupo alquileno C2-5" pueden incluir un grupo dimetileno, un grupo trimetileno y un grupo tetrametileno.

Ejemplos del "grupo alquilenoxi C1-3 alquileno C1-3" pueden incluir un grupo dimetilenoxidimetileno.

Ejemplos del "grupo alquilentio C1-3 alquileno C1-3" pueden incluir un grupo dimetilentiodimetileno.

Ejemplos del “grupo alquilenimino C1-3 alquileno C1-3” pueden incluir un grupo dimetileniminodimetileno.

Aquí, el grupo imino del "grupo alquilenalquilenimino C1-3 alquileno C1-3" significa -NH-.

El sustituyente en el "grupo alquileno C2-5", el "grupo alquilenoxi C1-3 alquileno C1-3", el "grupo alquilentio C1-3 alquileno C1-3" y el "grupo alquilenimino C1-3 alquileno C1-3 "es preferiblemente un grupo halógeno tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo; un grupo alquilo C1-6 tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo o un grupo t-butilo; un grupo metilideno; o un grupo haloalquilo C1-6 tal como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo o un grupo 1-fluoro-n-butilo.

[0102]

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^cR^dN-" pueden incluir un grupo amino, un grupo metilamino, un grupo dimetilamino y un grupo i-propilamino.

[0103]

En el "grupo representado por R^cR^dN-CO-" en G, R^c y R^d tienen el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^cR^dN-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^cR^dN-CO-" pueden incluir un grupo carbamoílo, un grupo N,N-dimetilaminocarbonilo, un grupo N-(i-propil) aminocarbonilo y un grupo N-(i-propil)-N-metilaminocarbonilo.

[0104]

En el "grupo representado por R^cR^dN-NR^d-CO-" en G, R^c y R^d tienen el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^cR^dN-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^cR^dN-NR^d-CO-" pueden incluir un grupo 2,2-dimetilhidrazina-1-carbonilo.

[0105]

En el "grupo representado por R^a-CO-O-" en G, R^a representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^a-CO-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^a-CO-O-" pueden incluir un grupo acetiloxi.

[0106]

En el "grupo representado por R^a-CO-NR^e-" en G, R^a representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^a-CO-".

R^e representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido.

Ejemplos específicos del sustituyente en R^e pueden incluir los mismos que los ejemplificados para R^a.

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^a-CO-NR^e-" pueden incluir un grupo acetilamino, un grupo propionilamino, un grupo butirilamino y un grupo i-propilcarbonilamino.

[0107]

En el "grupo representado por R^a-CO-CO-NR^e-" en G, R^a representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^a-CO-". R^e representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^a-CO-NR^e-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^a-CO-CO-NR^e-" pueden incluir un grupo oxopropanamida.

[0108]

En el "grupo representado por R^a-CO-NR^e-NR^e-" en G, R^a representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^a-CO-". R^e representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^a-CO-NR^e-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^a-CO-NR^e-NR^e-" pueden incluir un grupo acetilhidrazinilo y un grupo i-propilcarbonilhidrazinilo.

[0109]

En el "grupo representado por R^a-CO-NR^e-NR^e-CO-" en G, R^a representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^a-CO-". R^e representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^a-CO-NR^e-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^a-CO-NR^e-NR^e-CO-" pueden incluir un grupo 2-acetilhidrazina-1-carbonilo.

[0110]

En el "grupo representado por R^b-O-CO-O-" en G, R^b representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^b-O-CO-".

Los ejemplos específicos del "grupo representado por R^b-O-CO-O-" pueden incluir un grupo metoxicarboniloxi y un grupo etoxicarboniloxi.

[0111]

En el "grupo representado por R^b-O-CO-NR^e-" en G, R^b representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^b-O-CO-". R^e representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^b-CO-NR^e-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^b-O-CO-NR^e-" pueden incluir un grupo metoxicarbonilamino.

[0112]

En el "grupo representado por R^cR^dN-CO-O-" en G, R^c y R^d tienen el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^cR^dN-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^cR^dN-CO-O-" pueden incluir un grupo carbamoiloxi y un grupo N,N-dimetilaminocarboniloxi.

[0113]

En el "grupo representado por R^cR^dN-CO-NR^e-" en G, R^c y R^d tienen el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^cR^dN-". R^e representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^a-CO-NR^e-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^cR^dN-CO-NR^e-"

pueden incluir un grupo carbamoilamino y un grupo N,N-dimetilaminocarbonilamino.

[0114]

En el "grupo representado por R^cR^dN-CO-CO-NR^e-" en G, R^c y R^d tienen el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^cR^dN-". R^e representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^a-CO-NR^e-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^cR^dN-CO-CO-NR^e-" pueden incluir un grupo 2-(metilamino)-2-oxoacetamida y un grupo 2-(t-butilamino)-2-oxoacetamida.

[0115]

En el "grupo representado por R^a-CS-NR^e-" en G, R^a representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^a-CO-". R^e representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^a-CO-NR^e-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^a-CS-NR^e-" pueden incluir un grupo etanotioamida, un grupo propanotioamida y un grupo 2-metilpropanotioamida.

[0116]

En el "grupo representado por R^cR^dN-CS-NR^e-" en G, R^c y R^d tienen el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^cR^dN-". R^e representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^a-CO-NR^e-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^cR^dN-CS-NR^e-" pueden incluir un grupo 3,3-dimetiltioureido.

[0117]

En el "grupo representado por R^bSO_2-NR^e-" en G, R^b representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^b-O-CO-". R^e representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^a-CO-NR^e-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^bSO_2-NR^e-"

pueden incluir un grupo metanosulfonilamino.

[0118]

En el "grupo representado por $R^cR^dN\text{-}SO_2\text{-}$" en G, R^c y R^d tienen el mismo significado que en el anterior "grupo representado por $R^cR^dN\text{-}$".

Ejemplos específicos del "grupo representado por $R^cR^dN\text{-}SO_2\text{-}$" pueden incluir un grupo N,N-dimetilaminosulfonilo.

[0119]

En el "grupo representado por $R^aR^aO\text{-}N{=}CR^f\text{-}$" en G, R^a representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por $R^a\text{-}CO\text{-}$".

R^f representa un átomo de hidrógeno, un grupo amino o un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido.

Ejemplos específicos del sustituyente en R^f pueden incluir los mismos que los ejemplificados para R^a.

Ejemplos específicos del "grupo representado por $R^aO\text{-}N{=}CR^f\text{-}$" pueden incluir un grupo (hidroxiimino)metilo y un grupo (etoxiimino)metilo.

[0120]

En el "grupo representado por $R^a\text{-}C(=NR^g)\text{-}NR^e\text{-}$" en G, R^a representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por $R^a\text{-}CO\text{-}$". R^e representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por $R^a\text{-}CO\text{-}NR^e\text{-}$".

Cada R^g representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido.

Ejemplos específicos del sustituyente en R^g pueden incluir los mismos que los ejemplificados para R^a.

[0121]

En el "grupo representado por $R^cR^dN\text{-}C(=NR^g)\text{-}$" en G, R^c y R^d tienen el mismo significado que en el anterior "grupo representado por $R^cR^dN\text{-}$". R^g representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por $R^a\text{-}C(=NR^g)\text{-}NR^e\text{-}$".

[0122]

En el "grupo representado por $R^hR^iS(=O)=N-CO-$" en G, cada R^h representa independientemente un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, y cada R^i representa independientemente un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido.

Ejemplos específicos del sustituyente en R^h o R^i pueden incluir los mismos que los ejemplificados para R^a.

[0123]

Aquí, R^h y R^i juntos pueden formar un grupo orgánico divalente.

Ejemplos del grupo orgánico divalente que se puede formar pueden incluir un grupo alquileno C2-5 sustituido o no sustituido o un grupo alquileneoxi C1-3 alquileno C1-3 sustituido o no sustituido.

Ejemplos del "grupo alquileno C2-5" pueden incluir un grupo dimetileno, un grupo trimetileno y un grupo tetrametileno.

Ejemplos del "grupo alquilenoxi C1-3 alquileno C1-3" pueden incluir un grupo dimetilenoxidimetileno.

El sustituyente en el "grupo alquileno C2-5" o en el "grupo alquilenoxi C1-3 alquileno C1-3" es preferiblemente un grupo halógeno, tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo; un grupo alquilo C1-6 tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo o un grupo t-butilo; o un grupo haloalquilo C1-6 tal como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo, o un grupo 1-fluoro-n-butilo.

[0124]

En el "grupo representado por $R^hR^iS=N-CO-$" en G, R^h o R^i representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por $R^hR^iS(=O)=N-CO-$".

[0125]

En el "grupo representado por $R^hR^jC=N-O-$" en G, R^h y R^j tienen el mismo significado que en el anterior "grupo representado por $R^hR^jS=N-O-$

".

Ejemplos específicos del "grupo representado por $R^hR^jC=N-O-$" pueden incluir un grupo (propan-2-ilidenamino)oxi.

[0126]

Cuando dos o más sustituyentes (G) están presentes, los ejemplos de un grupo orgánico divalente que pueden formarse juntos por dos de los sustituyentes pueden incluir un grupo alquileno C1-5 sustituido o no sustituido, un grupo oxi-alquileno C1-4 sustituido o no sustituido, un grupo oxi-alquilenoxi C2-3 sustituido o no sustituido, o un grupo alquilenoxi C1-3 alquileno C1-3 sustituido o no sustituido.

Ejemplos del "grupo alquileno C1-5" pueden incluir un grupo metileno, un grupo dimetileno, un grupo trimetileno y un grupo tetrametileno.

Ejemplos del "grupo oxi-alquileno C1-4" pueden incluir un grupo oximetileno y un grupo oxidimetileno.

Ejemplos del "grupo oxi-alquilenoxi C2-3" pueden incluir un grupo oxidimetilenoxi.

Ejemplos del "grupo alquilenoxi C1-3 alquileno C1-3" pueden incluir un grupo dimetilenoxidimetileno.

El sustituyente en el "grupo alquileno C1-5", el "grupo oxi-alquileno C1-4", el "grupo oxi-alquilenoxi C2-3" y el "grupo alquilenoxi C1-3 alquileno C1-3" es preferiblemente un grupo halógeno tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo; un grupo alquilo C1-6 tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo o un grupo t-butilo; o un grupo haloalquilo C1-6 tal como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo o un grupo 1-fluoro-n-butilo.

[0127]

En la presente invención, los ejemplos de G preferidos pueden incluir un grupo halógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido,

un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiltio C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfinilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfonilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo heterociclilo de anillo de 3 a 10 miembros sustituido o no sustituido, un grupo representado por R^b-O-CO-, un grupo representado por R^cR^dN-, un grupo representado por R^cR^dN-CO-, un grupo representado por R^a-CO-O-, un grupo representado por R^a-CO-NR^e-, un grupo representado por R^b-O-CO-NR^e-, un grupo representado por R^cR^dN-CO-O-, un grupo representado por R^cR^dN-CO-NR^e-, un grupo representado por R^cR^dN-CS-NR^e-, un grupo representado por R^bSO_2-NR^e-, un grupo representado por R^aO-N=CR^f-, o un grupo representado por R^hR^iC=N-O-.

[0128]

[A]

A representa un grupo alquileno C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenileno C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinileno C2-6 sustituido o no sustituido, o un grupo cicloalquileno C3-6 sustituido o no sustituido.

[0129]

Ejemplos del "grupo alquileno C1-6" en A pueden incluir un grupo metileno, un grupo dimetileno, un grupo trimetileno y un grupo tetrametileno.

Ejemplos del "grupo alquenileno C2-6" en A pueden incluir un grupo vinileno (-CH=CH-), un grupo divinileno (-CH=CH-CH=CH-) y un grupo propenileno (-CH=CH-CH_2-, -CH_2-CH=CH-).

Ejemplos del "grupo alquinileno C2-6" en A pueden incluir un grupo etinileno (-C≡C-) y un grupo propinileno (-CH_2-C≡C-, -C≡C-CH_2-).

Ejemplos del "grupo cicloalquileno C3-6" en A pueden incluir un grupo 1,2-ciclopropileno, un grupo 1,2-ciclobutanodiilo y un grupo 1,3-ciclobutanodiilo.

[0130]

En la presente invención, los ejemplos de A preferidos pueden incluir un grupo alquileno C1-6 sustituido o no sustituido o un grupo alquenileno C2-6 sustituido o no sustituido.

Ejemplos de un sustituyente en el grupo alquileno C1-6 o el grupo alquenileno C2-6 pueden incluir uno o más sustituyentes seleccionados del siguiente grupo de sustituyentes a (a continuación, este sustituyente puede indicarse con el símbolo "Ga").

Cuando están presentes dos o más sustituyentes (Ga), dos de los sustituyentes juntos pueden formar un grupo orgánico divalente. El grupo de sustituyentes se muestra a continuación:

un grupo halógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo hidroxi, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alqueniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo mercapto, un grupo alquiltio C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfinilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfonilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquiloxi C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo ariloxi C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo ariltio C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo arilsulfinilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo arilsulfonilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo heterociclilo de anillo de 3 a 6 miembros sustituido o no sustituido, un grupo heterocicliloxi de anillo de 3 a 6 miembros sustituido o no sustituido, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo representado por R^{a1}-CO-, un grupo carboxi, un grupo representado por R^{b1}-O-CO-, un grupo representado por $R^{c1}R^{d1}$N-, un grupo representado por $R^{c1}R^{d1}$N-CO-, un grupo representado por R^{a1}-CO-O-, un grupo representado por R^{a1}-CO-NR^{e1}-, un grupo representado por R^{b1}-O-CO-O-, un grupo representado por R^{b1}-O-CO-NR^{e1}-, un grupo representado por

$R^{c1}R^{d1}N$-CO-O-, un grupo representado por $R^{c1}R^{d1}N$-CO-NR^{e1}-, un grupo representado por $R^{b1}SO_2$-NR^{e1}-, un grupo representado por $R^{c1}R^{d1}N$-SO_2-, un grupo representado por $R^{a1}O$-N=CR^{f1}-, un grupo representado por $R^{g1}R^{h1}C$=N-O-, un grupo oxo (O=), un grupo tioxo (S=), un grupo divalente representado por R^{a1}-N=, un grupo divalente representado por $R^{a1}O$-N=, un grupo divalente representado por $R^{c1}R^{d1}N$-N=, un grupo divalente representado por R^{a1}-CO-NR^{e1}-N=, un grupo divalente representado por R^{b1}-O-CO-NR^{e1}-N=, y un grupo divalente representado por $R^{b1}SO_2$-NR^{e1}-N=.

[0131]

En el grupo de sustituyentes descrito anteriormente, cada R^{a1} representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^{b1} representa independientemente un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^{c1} representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido, y

cada R^{d1} representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10

sustituido o no sustituido, donde R^{c1} y R^{d1} juntos pueden formar un grupo orgánico divalente.

Cada R^{e1} representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido,

R^{f1} representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido,

R^{g1} representa independientemente un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido, y

R^{h1} representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, donde R^{g1} y R^{h1} juntos pueden formar un grupo orgánico divalente.

[0132]

Ejemplos del "grupo halógeno" en Ga pueden incluir un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo y un grupo yodo.

[0133]

El "grupo alquilo C1-6" en Ga puede ser una cadena lineal o puede ser una cadena ramificada. Ejemplos del "grupo alquilo C1-6" en Ga pueden incluir un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo n-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo n-hexilo, un grupo i-propilo, un grupo i-butilo, un grupo s-butilo, un grupo t-butilo, un grupo i-pentilo, un grupo neopentilo, un grupo 2-metilbutilo y un grupo i-hexilo.

[0134]

Ejemplos del “grupo alquenilo C2-6” en Ga pueden incluir un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 1-pentenilo, un grupo 2-pentenilo, un

grupo 3-pentenilo, un grupo 4-pentenilo, un grupo 1-metil-2-butenilo, un grupo 2-metil-2-butenilo, un grupo 1-hexenilo, un grupo 2-hexenilo, un grupo 3-hexenilo, un grupo 4-hexenilo y un grupo 5-hexenilo.

[0135]

Ejemplos del “grupo alquinilo C2-6” en Ga pueden incluir un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 1-metil-2-propinilo, un grupo 2-metil-3-butinilo, un grupo 1-pentinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo, un grupo 4-pentinilo, un grupo 1-metil-2-butinilo, un grupo 2-metil-3-pentinilo, un grupo 1-hexinilo y un grupo 1,1-dimetil-2-butinilo.

[0136]

Ejemplos del "grupo alcoxi C1-6" en Ga pueden incluir un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo n-pentiloxi, un grupo n-hexiloxi, un grupo i-propoxi, un grupo i-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo t-butoxi y un grupo i-hexiloxi.

Ejemplos del "grupo alqueniloxi C2-6" en Ga pueden incluir un grupo viniloxi, un grupo aliloxi, un grupo propeniloxi y un grupo buteniloxi.

Ejemplos del "grupo alquiniloxi C2-6" en Ga pueden incluir un grupo etiniloxi y un grupo propargiloxi.

[0137]

Ejemplos del "grupo alquiltio C1-6" en Ga pueden incluir un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo n-propiltio, un grupo n-butiltio, un grupo n-pentiltio, un grupo n-hexiltio y un grupo i-propiltio.

Ejemplos del "grupo alquilsulfinilo C1-6" en Ga pueden incluir un grupo metilsulfinilo, un grupo etilsulfinilo y un grupo t-butilsulfinilo.

Ejemplos del "grupo alquilsulfonilo C1-6" en Ga pueden incluir un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo y un grupo t-butilsulfonilo.

[0138]

El sustituyente en el "grupo alquilo C1-6", el "grupo alquenilo C2-6", el "grupo alquinilo C2-6", el "grupo alcoxi C1-6", el "grupo alqueniloxi C2-6", el "grupo alquiniloxi C2-6", el "grupo alquiltio C1-6", el "grupo

alquilsulfinilo C1-6" o el "grupo alquilsulfonilo C1-6" en Ga es preferiblemente un grupo halógeno tal como un grupo fluoro, un grupo cloro , un grupo bromo o un grupo yodo; un grupo hidroxi; un grupo alcoxi C1-6 tal como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi o un grupo t-butoxi; un grupo haloalcoxi C1-6 tal como un grupo 2-cloro-n-propoxi, un grupo 2,3-diclorobutoxi o un grupo trifluorometoxi; un grupo cicloalquilo C3-6 tal como un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo o un grupo ciclohexilo; un grupo arilo C6-10 tal como un grupo fenilo y un grupo naftilo; un grupo arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6, tal como un grupo 4-metilfenilo, un grupo 4-metoxifenilo, un grupo 4-clorofenilo, un grupo 4-trifluorometilfenilo o un grupo 4-trifluorometoxifenilo; o un grupo ciano.

[0139]

Ejemplos del "grupo cicloalquilo C3-6" en Ga pueden incluir un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo y un grupo ciclohexilo.

Ejemplos del "grupo cicloalquiloxi C3-6" en Ga pueden incluir un grupo ciclopropiloxi, un grupo ciclobutiloxi, un grupo ciclopentiloxi y un grupo ciclohexiloxi.

[0140]

Ejemplos del "grupo arilo C6-10" en Ga pueden incluir un grupo fenilo, un grupo naftilo, un grupo indenilo, un grupo indanilo y un grupo tetralinilo.

Ejemplos del "grupo ariloxi C6-10" en Ga pueden incluir un grupo fenoxi y un grupo naftoxi.

[0141]

Ejemplos del "grupo ariltio C6-10" en Ga pueden incluir un grupo feniltio y un grupo naftiltio.

Ejemplos del "grupo arilsulfinilo C6-10" en Ga pueden incluir un grupo fenilsulfinilo y un grupo naftilsulfinilo.

Ejemplos del "grupo arilsulfonilo C6-10" en Ga pueden incluir un grupo fenilsulfonilo y un grupo naftilsulfonilo.

[0142]

El "grupo heterociclilo de anillo de 3 a 6 miembros" en Ga es un grupo que incluye 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre como átomo(s) constituyente(s) del anillo. Cuando se incluyen dos o más heteroátomos, los heteroátomos pueden ser iguales o diferentes. Ejemplos del "grupo heterociclilo de anillo de 3 a 6 miembros" incluyen un grupo heterociclilo saturado de anillo de 3 a 6 miembros, un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros y un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 a 6 miembros.

[0143]

Ejemplos del grupo heterociclilo saturado de anillo de 3 a 6 miembros pueden incluir un grupo aziridinilo, un grupo epoxi, un grupo azetidinilo, un grupo oxetanilo, un grupo pirrolidinilo, un grupo tetrahidrofuranilo, un grupo tiazolidinilo, un grupo tetrahidro-2H-piranilo, un grupo piperidilo, un grupo piperazinilo, un grupo morfolinilo, un grupo dioxolanilo y un grupo dioxanilo.

Ejemplos del grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros pueden incluir un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxadiazolilo, un grupo tiadiazolilo y un grupo tetrazolilo; y un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros tal como un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo y un grupo triazinilo.

Ejemplos del grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 a 6 miembros pueden incluir un grupo heterociclilo parcialmente

insaturado de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolinilo, un grupo dihidrofuranilo, un grupo imidazolinilo, un grupo pirazolinilo y un grupo oxazolinilo; y un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 6 miembros tal como un grupo isoxazolinilo o un grupo dihidropiranilo.

[0144]

El "grupo heterocicliloxi de anillo de 3 a 6 miembros" en Ga tiene una estructura en la que un grupo heterociclilo de anillo de 3 a 6 miembros está unido a un grupo oxi. Ejemplos específicos del mismo pueden incluir un grupo tiazoliloxi y un grupo piridiloxi.

[0145]

El sustituyente en el "grupo cicloalquilo C3-6", el "grupo cicloalquiloxi C3-6", el "grupo arilo C6-10", el "grupo ariloxi C6-10", el "grupo ariltio C6-10", el "grupo arilsulfinilo C6-10", el "grupo arilsulfonilo C6-10", el "grupo heterociclilo de anillo de 3 a 6 miembros" o el "grupo heterocicliloxi de anillo de 3 a 6 miembros" en Ga es preferiblemente un grupo halógeno tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo; un grupo alquilo C1-6 tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo o un grupo n-hexilo; un grupo haloalquilo C1-6 tal como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo o un grupo 1-fluoro-n-butilo; un grupo hidroxi; un grupo alcoxi C1-6 tal como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi o un grupo t-butoxi; un grupo haloalcoxi C1-6 tal como un grupo 2-cloro-n-propoxi, un grupo 2,3-diclorobutoxi o un grupo trifluorometoxi; un grupo arilo C6-10 tal como un grupo fenilo o un grupo naftilo; un grupo arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6, tal como un grupo 4-metilfenilo, un grupo 4-metoxifenilo, un grupo 4-clorofenilo, un grupo 4-trifluorometilfenilo o un grupo 4-

trifluorometoxifenilo; o un grupo ciano.

[0146]

En el "grupo representado por R^{a1}-CO-" en G, R^{a1} representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido.

[0147]

Ejemplos del "grupo alquilo C1-6" en R^{a1} pueden incluir un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo n-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo n-hexilo, un grupo i-propilo, un grupo i-butilo, un grupo s-butilo, un grupo t-butilo, un grupo i-pentilo, un grupo neopentilo, un grupo 2-metilbutilo y un grupo i-hexilo.

Ejemplos del "grupo alquenilo C2-6" en R^{a1} pueden incluir un grupo vinilo y un grupo 1-propenilo.

Ejemplos del "grupo alquinilo C2-6" en R^{a1} pueden incluir un grupo etinilo y un grupo 1-propinilo.

El sustituyente en el "grupo alquilo C1-6", el "grupo alquenilo C2-6" o el "grupo alquinilo C2-6" en R^{a1} es preferiblemente un grupo halógeno tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo, o un grupo yodo; un grupo hidroxi; un grupo alcoxi C1-6 tal como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi o un grupo t-butoxi; un grupo haloalcoxi C1-6 tal como un grupo 2-cloro-n-propoxi, un grupo 2,3-diclorobutoxi o un grupo trifluorometoxi; un grupo cicloalquilo C3-6 tal como un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo o un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo; un grupo arilo C6-10 tal como un grupo fenilo o un grupo naftilo; un grupo arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6, tal como un grupo 4-clorofenilo, un grupo 4-trifluorometilfenilo o un grupo 4-

trifluorometoxifenilo; o un grupo ciano.

[0148]

Ejemplos del "grupo cicloalquilo C3-6" en R^{a1} pueden incluir un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo y un grupo ciclohexilo.

Ejemplos del "grupo arilo C6-10" en R^{a1} pueden incluir un grupo fenilo y un grupo naftilo.

[0149]

El "grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros" en R^{a1} es un grupo que incluye 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre como átomo(s) constituyente(s) del anillo. Cuando se incluyen dos o más heteroátomos, los heteroátomos pueden ser iguales o diferentes. Ejemplos del "grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros" pueden incluir un grupo heterociclilo saturado de anillo de 5 a 6 miembros, un grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros y un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 a 6 miembros.

Ejemplos del grupo heterociclilo saturado de anillo de 5 a 6 miembros pueden incluir un grupo pirrolidinilo, un grupo tetrahidrofuranilo, un grupo tiazolidinilo, un grupo tetrahidro-2H-piranilo, un grupo piperidilo, un grupo piperazinilo, un grupo morfolinilo, un grupo dioxolanilo y un grupo dioxanilo.

Ejemplos del grupo heteroarilo de anillo de 5 a 6 miembros pueden incluir un grupo heteroarilo de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxadiazolilo, un grupo tiadiazolilo y un grupo tetrazolilo; y un grupo heteroarilo de anillo de 6 miembros tal como un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo y un grupo triazinilo.

Ejemplos del grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo

de 5 a 6 miembros pueden incluir un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 5 miembros tal como un grupo pirrolinilo, un grupo dihidrofuranilo, un grupo imidazolinilo, un grupo pirazolinilo y un grupo oxazolinilo; y un grupo heterociclilo parcialmente insaturado de anillo de 6 miembros tal como un grupo isoxazolinilo y un grupo dihidropiranilo.

[0150]

El sustituyente en el "grupo cicloalquilo C3-6", el "grupo arilo C6-10" o el "grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros" en R^{a1} es preferiblemente un grupo halógeno tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo; un grupo alquilo C1-6 tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo o un grupo n-hexilo; un grupo haloalquilo C1-6 tal como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo o un grupo 1-fluoro-n-butilo; un grupo hidroxi; un grupo alcoxi C1-6 tal como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi o un grupo t-butoxi; un grupo haloalcoxi C1-6 tal como un grupo 2-cloro-n-propoxi, un grupo 2,3-diclorobutoxi o un grupo trifluorometoxi; un grupo arilo C6-10 tal como un grupo fenilo o un grupo naftilo; un grupo arilo C6-10 sustituido con uno o más sustituyentes de un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un grupo halógeno, un grupo haloalquilo C1-6 o un grupo haloalcoxi C1-6, tal como un grupo 4-metilfenilo, un grupo 4-metoxifenilo, un grupo 4-clorofenilo, un grupo 4-trifluorometilfenilo o un grupo 4-trifluorometoxifenilo; o un grupo ciano.

[0151]

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^{a1}-CO-" pueden incluir un grupo formilo y un grupo acetilo.

[0152]

En el "grupo representado por R^{b1}-O-CO-" en G, R^{b1} representa un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6

sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido.

Ejemplos específicos del sustituyente en R^{b1} pueden incluir aquellos ejemplificados para R^{a1}.

[0153]

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^{b1}-O-CO-" pueden incluir un grupo metoxicarbonilo, un grupo etoxicarbonilo y un grupo t-butoxicarbonilo.

[0154]

En el "grupo representado por $R^{c1}R^{d1}N$-" en Ga, R^{c1} representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido, y R^{d1} representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido.

Ejemplos específicos del sustituyente en R^{c1} o R^{d1} pueden incluir los mismos que los ejemplificados para R^{a1}.

Aquí, R^{c1} y R^{d1} juntos pueden formar un grupo orgánico divalente. Ejemplos del grupo orgánico divalente que se puede formar pueden incluir un grupo alquileno C2-5 sustituido o no sustituido o un grupo alquileneoxi C1-3 alquileno C1-3 sustituido o no sustituido.

Ejemplos del "grupo alquileno C2-5" pueden incluir un grupo dimetileno, un grupo trimetileno y un grupo tetrametileno.

Ejemplos del "grupo alquilenoxi C1-3 alquileno C1-3" pueden incluir un grupo dimetilenoxidimetileno.

El sustituyente en el "grupo alquileno C2-5" o en el "grupo alquilenoxi C1-3 alquileno C1-3" es preferiblemente un grupo halógeno, tal

como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo; un grupo alquilo C1-6 tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo o un grupo t-butilo; o un grupo haloalquilo C1-6 tal como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo, o un grupo 1-fluoro-n-butilo.

[0155]

Ejemplos específicos del "grupo representado por $R^{c1}R^{d1}N$-" pueden incluir un grupo amino, un grupo metilamino y un grupo dimetilamino.

[0156]

En el "grupo representado por $R^{c1}R^{d1}N$-" en G, R^{c1} y R^{d1} tienen el mismo significado que en el anterior "grupo representado por $R^{c1}R^{d1}N$-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por $R^{c1}R^{d1}N$-CO-" pueden incluir un grupo carbamoílo, un grupo N,N-dimetilaminocarbonilo, un grupo N-(i-propil) aminocarbonilo y un grupo N-(i-propil)-N-metilaminocarbonilo.

[0157]

En el "grupo representado por R^{a1}-CO-O-" en G, R^{a1} representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^{a1}-CO-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^{a1}-CO-O-" pueden incluir un grupo acetiloxi.

[0158]

En el "grupo representado por R^{a1}-CO-NR^{e1}-" en G, R^{a1} representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^{a1}-CO-".

R^{e1} representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido.

Ejemplos específicos del sustituyente en R^{e1} pueden incluir aquellos ejemplificados para R^{a1}.

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^{a1}-CO-NR^{e1}-" pueden incluir un grupo acetilamino.

[0159]

En el "grupo representado por R^{b1}-O-CO-O-" en G, R^{b1} representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^{b1}-O-CO-".

Los ejemplos específicos del "grupo representado por R^{b1}-O-CO-O-" pueden incluir un grupo metoxicarboniloxi y un grupo etoxicarboniloxi.

[0160]

En el "grupo representado por R^{b1}-O-CO-NR^{e1}-" en G, R^{b1} representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^{b1}-O-CO-". R^{e1} representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^{b1}-CO-NR^{e1}-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por R^{b1}-O-CO-NR^{e1}-" pueden incluir un grupo metoxicarbonilamino.

[0161]

En el "grupo representado por $R^{c1}R^{d1}$N-CO-O-" en G, R^{c1} y R^{d1} tienen el mismo significado que en el anterior "grupo representado por $R^{c1}R^{d1}$N-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por $R^{c1}R^{d1}$N-CO-O-" pueden incluir un grupo carbamoiloxi y un grupo N,N-dimetilaminocarboniloxi.

[0162]

En el "grupo representado por $R^{c1}R^{d1}$N-CO-NR^{e1}-" en G, R^{c1} y R^{d1} tienen el mismo significado que en el anterior "grupo representado por $R^{c1}R^{d1}$N-". R^{e1} representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^{a1}-CO-NR^{e1}-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por $R^{c1}R^{d1}$N-CO-NR^{e1}-" pueden incluir un grupo carbamoilamino y un grupo N,N-dimetilaminocarbonilamino.

[0163]

En el "grupo representado por $R^{b1}SO_2$-NR^{e1}-" en G, R^{b1} representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^{b1}-O-

CO-". R^{e1} representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^{a1}-CO-NR^{e1}-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por $R^{b1}SO_2$-NR^{e1}-" pueden incluir un grupo metanosulfonilamino.

[0164]

En el "grupo representado por $R^{c1}R^{d1}N$-SO_2-" en G, R^{c1} y R^{d1} tienen el mismo significado que en el anterior "grupo representado por $R^{c1}R^{d1}N$-".

Ejemplos específicos del "grupo representado por $R^{c1}R^{d1}N$-SO_2-" pueden incluir un grupo N,N-dimetilaminosulfonilo.

[0165]

En el "grupo representado por $R^{a1}O$-N=CR^{f1}-" en G, R^{a1} representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^{a1}-CO-".

R^{f1} representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido.

Ejemplos específicos del sustituyente en R^{f1} pueden incluir los mismos que los ejemplificados para R^a.

Ejemplos específicos del "grupo representado por $R^{a1}O$-N=CR^{f1}-" pueden incluir un grupo (hidroxiimino)metilo y un grupo (etoxiimino)metilo.

[0166]

En el "grupo representado por $R^{g1}R^{h1}C$=N-O-" en Ga, R^{g1} representa un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido, y R^{h1} representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido.

Ejemplos específicos del sustituyente en R^{g1} o R^{h1} pueden incluir los mismos que los ejemplificados para R^{a1}.

Aquí, R^{g1} y R^{h1} juntos pueden formar un grupo orgánico divalente.

Ejemplos del grupo orgánico divalente que se puede formar pueden

incluir un grupo alquileno C2-5 sustituido o no sustituido o un grupo alquileneoxi C1-3 alquileno C1-3 sustituido o no sustituido.

Ejemplos del "grupo alquileno C2-5" pueden incluir un grupo dimetileno, un grupo trimetileno y un grupo tetrametileno.

Ejemplos del "grupo alquilenoxi C1-3 alquileno C1-3" pueden incluir un grupo dimetilenoxidimetileno.

El sustituyente en el "grupo alquileno C2-5" o en el "grupo alquilenoxi C1-3 alquileno C1-3" es preferiblemente un grupo halógeno, tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo; un grupo alquilo C1-6 tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo o un grupo t-butilo; o un grupo haloalquilo C1-6 tal como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo, o un grupo 1-fluoro-n-butilo.

Ejemplos específicos del "grupo representado por $R^{g1}R^{h1}C=N-O-$" pueden incluir un grupo (propan-2-ilidenamino)oxi.

[0167]

En el "grupo divalente representado por $R^{a1}-N=$" en G, R^{a1} representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por $R^{a1}-CO-$".

Los ejemplos específicos del "grupo divalente representado por $R^{a1}-N=$" pueden incluir un grupo imino (HN=) y un grupo metilimino.

[0168]

En el "grupo divalente representado por $R^{a1}O-N=$" en Ga, R^{a1} representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por $R^{a1}-CO-$".

Ejemplos específicos del "grupo divalente representado por $R^{a1}O-N=$" pueden incluir un grupo N-hidroxiimino y un grupo N-metoxiimino.

[0169]

En el "grupo divalente representado por $R^{c1}R^{d1}N-N=$" en G, R^{c1} y R^{d1} tienen el mismo significado que en el anterior "grupo representado por

$R^{c1}R^{d1}N$-".

Ejemplos específicos del "grupo divalente representado por $R^{c1}R^{d1}N$-N=" pueden incluir un grupo 2,2-dimetilhidrazinilideno.

[0170]

En el "grupo divalente representado por R^{a1}-CO-NR^{e1}-N=" en G, R^{a1} representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^{a1}-CO-". R^{e1} representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^{a1}-CO-NR^{e1}-".

[0171]

En el "grupo divalente representado por R^{b1}-O-CO-NR^{e1}-N=" en G, R^{b1} representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^{b1}-O-CO-". R^{e1} representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^{a1}-CO-NR^{e1}-".

[0172]

En el "grupo divalente representado por $R^{b1}SO_2$-NR^{e1}-N=" en G, R^{b1} representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^{b1}-O-CO-". R^{e1} representa el mismo significado que en el anterior "grupo representado por R^{a1}-CO-NR^{e1}-".

[0173]

Cuando dos o más sustituyentes (Ga) están presentes, los ejemplos de un grupo orgánico divalente que pueden formarse juntos por dos de los sustituyentes pueden incluir un grupo alquileno C1-5 sustituido o no sustituido, un grupo oxi-alquileno C1-4 sustituido o no sustituido, un grupo oxi-alquilenoxi C2-3 sustituido o no sustituido, o un grupo alquilenoxi C1-3 alquileno C1-3 sustituido o no sustituido.

Ejemplos del "grupo alquileno C1-5" pueden incluir un grupo metileno, un grupo dimetileno, un grupo trimetileno y un grupo tetrametileno.

Ejemplos del "grupo oxi-alquileno C1-4" pueden incluir un grupo oximetileno y un grupo oxidimetileno.

Ejemplos del "grupo oxi-alquilenoxi C2-3" pueden incluir un grupo

oxidimetilenoxi.

Ejemplos del "grupo alquilenoxi C1-3 alquileno C1-3" pueden incluir un grupo dimetilenoxidimetileno.

El sustituyente en el "grupo alquileno C1-5", el "grupo oxi-alquileno C1-4", el "grupo oxi-alquilenoxi C2-3" o el "grupo alquilenoxi C1-3 alquileno C1-3" es preferiblemente un grupo halógeno tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo; un grupo alquilo C1-6 tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo o un grupo t-butilo; o un grupo haloalquilo C1-6 tal como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo o un grupo 1-fluoro-n-butilo.

[0174]

En la presente invención, los ejemplos de Ga preferidos pueden incluir un grupo hidroxi, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alqueniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquiloxi C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo ariloxi C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo heterocicliloxi de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido, un grupo representado por R^{a1}-CO-O-, un grupo oxo (O=), o un grupo divalente grupo representado por R^{a1}O-N=.

En este caso, los ejemplos preferidos del grupo heterocicliloxi de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido pueden incluir un grupo tetrahidro-2H-piran-4-ilo.

[0175]

En la presente invención, los ejemplos de Ga más preferidos pueden incluir un grupo hidroxi, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alqueniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo representado por R^{a1}-CO-O-, un grupo oxo (O=), o un grupo divalente representado por R^{a1}O-N=.

[0176]

Sal

Las sales del compuesto (II) no están particularmente limitadas siempre que las sales sean sales agrícolas y hortícolamente aceptables. Ejemplos de los mismos pueden incluir una sal de un ácido inorgánico tal como ácido clorhídrico y ácido sulfúrico; una sal de un ácido orgánico tal como ácido acético y ácido láctico; una sal de un metal alcalino tal como litio, sodio y potasio; una sal de un metal alcalinotérreo tal como calcio y magnesio; una sal de un metal de transición tal como hierro y cobre; una sal de una base orgánica tal como trietilamina, tributilamina, piridina e hidrazina; y amoniaco.

[0177]

Método de producción

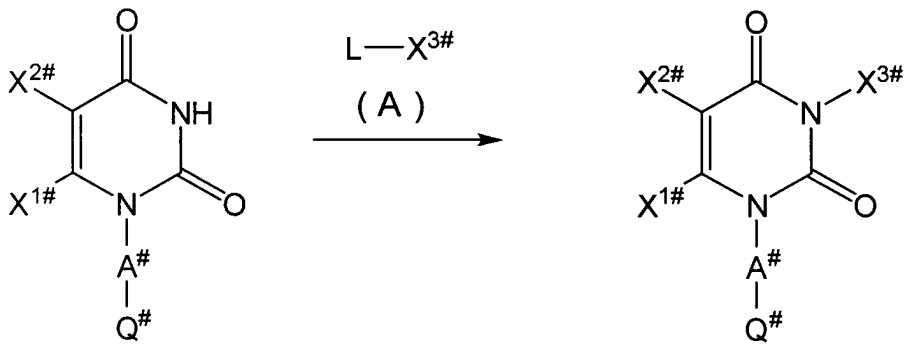
Un método para producir el compuesto (II) o una sal del compuesto (II) no está limitado. Por ejemplo, el compuesto (II) o una sal del compuesto (II) de la presente invención se puede obtener mediante un método conocido descrito en los ejemplos y similares. La sal del compuesto (II) se puede obtener también mediante un método conocido a partir del compuesto (II).

[0178]

Esquema de reacción 1

Por ejemplo, entre los compuestos (II), el compuesto de la Fórmula (I-1) que se muestra a continuación se puede preparar condensando un compuesto de la Fórmula (III-1) y un compuesto de la Fórmula (A), como se muestra en el siguiente esquema reacción 1.

[0179]



(III-1) (I-1)

[0180]

En la Fórmula(I-1), $X^{1\#}$ representa el mismo significado que X^1 en la Fórmula (II) o representa una estructura que puede derivarse en X^1 mediante un método común. $X^{2\#}$ representa el mismo significado que X^2 en la Fórmula (II) o representa una estructura que puede derivarse en X^2 mediante un método común. $X^{3\#}$ representa el mismo significado que X^3 en la Fórmula (II) o representa una estructura que puede derivarse en X^3 mediante un método común. $Q^{\#}$ representa el mismo significado que Q en la Fórmula (II) o representa una estructura que puede derivarse en Q mediante un método común. $A^{\#}$ representa el mismo significado que A en la Fórmula (II) o representa una estructura que puede derivarse en A mediante un método común.

Los símbolos en la Fórmula (III-1) tienen el mismo significado que los de la Fórmula (I-1).

$X^{3\#}$ en la Fórmula (A) tiene el mismo significado que en la Fórmula (I-1). L representa un grupo saliente.

Por ejemplo, cuando se usa un compuesto de la Fórmula (A) que tiene un grupo saliente tal como un grupo metanosulfonilo como L, el compuesto de la Fórmula (I-1) puede prepararse mediante una reacción en presencia de una base inorgánica.

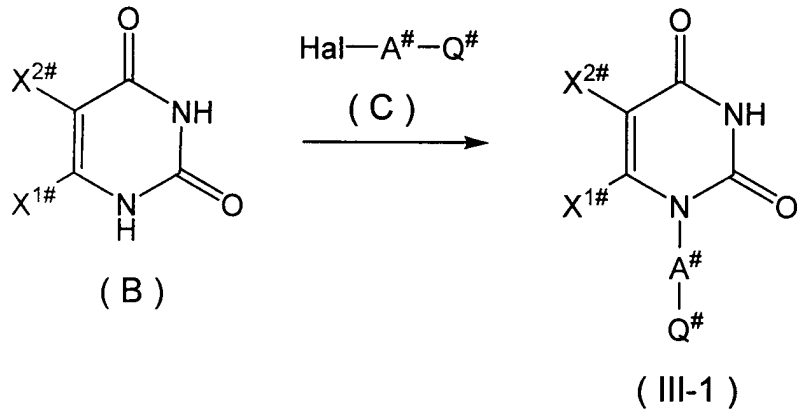
Por ejemplo, cuando se usa un compuesto de la Fórmula (A) en la que L es un grupo hidroxi, el compuesto de la Fórmula (I-1) puede prepararse mediante el uso de una reacción de Mitsunobu.

[0181]

Esquema de reacción 2

El compuesto de la Fórmula (III-1) se puede preparar condensando un compuesto de la Fórmula (B) y un compuesto de la Fórmula (C), como se muestra en el siguiente esquema de reacción 2.

[0182]



[0183]

Los símbolos en la Fórmula (B) tienen el mismo significado que los de la Fórmula (I-1). Los símbolos en la Fórmula (C) tienen el mismo significado que los de la Fórmula (I-1). Hal representa un grupo halógeno.

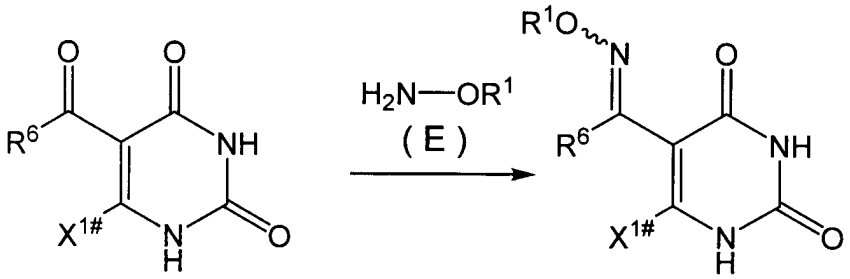
Por ejemplo, el compuesto de la Fórmula (III-1) se puede preparar haciendo reaccionar el compuesto de la Fórmula (B) con el compuesto de la Fórmula (C) en presencia de una base inorgánica.

[0184]

Esquema de reacción 3

Entre los compuestos de la Fórmula (B), un compuesto de la Fórmula (B-1), en el que un resto X^2 es un grupo representado por R^1O-N=CR^6-, se puede preparar condensando un compuesto de la Fórmula (D) y un compuesto de la Fórmula (E), como se muestra en el siguiente esquema de reacción 3.

[0185]



(D) (B-1)

[0186]

R^1 y R^6 en la Fórmula (B-1) tienen el mismo significado que los de la Fórmula (II). $X^{1\#}$ tiene el mismo significado que en la Fórmula (I-1).

R^6 en la Fórmula (D) tiene el mismo significado que en la Fórmula (II). $X^{1\#}$ tiene el mismo significado que en la Fórmula (I-1).

R^1 en la Fórmula (E) tiene el mismo significado que en la Fórmula (II). Como compuesto de la Fórmula (E), se puede usar un clorhidrato del compuesto.

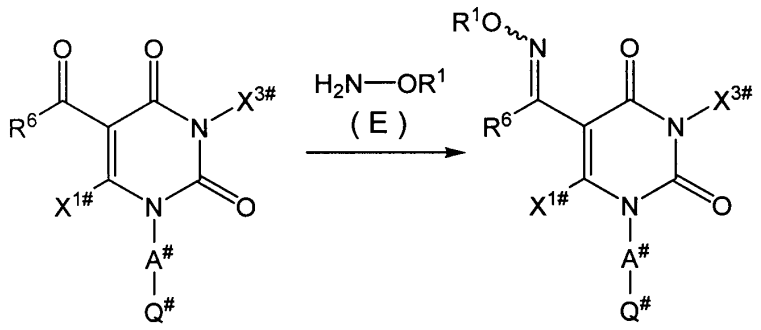
Por ejemplo, el compuesto de la Fórmula (B-1) se puede preparar haciendo reaccionar el compuesto de la Fórmula (D) con el compuesto de la Fórmula (E) en un disolvente alcohólico.

[0187]

Esquema de reacción 4

Entre los compuestos de la Fórmula (I-1), un compuesto de la Fórmula (I-2), en el que un resto X^2 es un grupo representado por R^1O-N=CR^6-, se puede preparar condensando un compuesto de la Fórmula (F) y un compuesto de la Fórmula (E), como se muestra en el siguiente esquema de reacción 4.

[0188]



(F) (I-2)

[0189]

R^1 y R^6 en la Fórmula (I-2) tienen el mismo significado que los de la Fórmula (II). Otros símbolos tienen el mismo significado que los de la Fórmula (I-1).

R^6 en la Fórmula (F) tiene el mismo significado que en la Fórmula (II). Otros símbolos tienen el mismo significado que los de la Fórmula (I-1).

R^1 en la Fórmula (E) tiene el mismo significado que en la Fórmula (II). Como compuesto de la Fórmula (E), se puede usar un clorhidrato del compuesto.

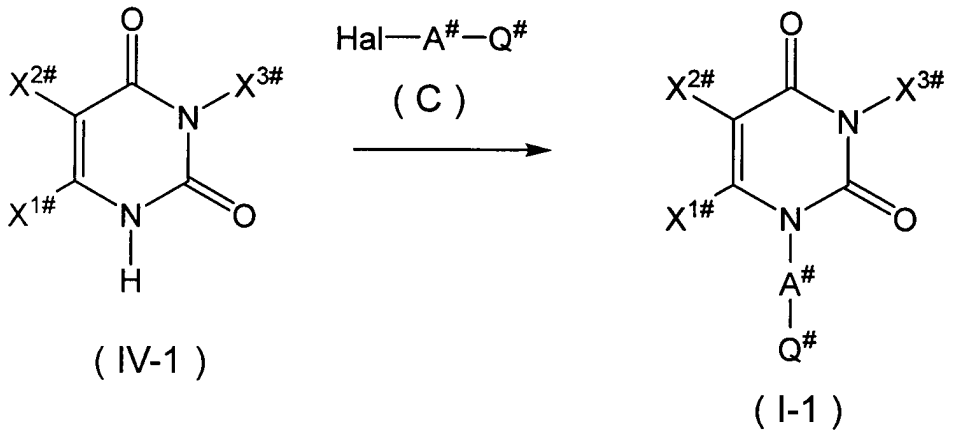
Por ejemplo, el compuesto de la Fórmula (I-2) se puede preparar haciendo reaccionar el compuesto de la Fórmula (F) con el compuesto de la Fórmula (E) en un disolvente alcohólico.

[0190]

Esquema de reacción 5

El compuesto de la Fórmula (I-1) también se puede preparar condensando un compuesto de la Fórmula (IV-1) y un compuesto de la Fórmula (C), como se muestra en el siguiente esquema de reacción 5.

[0191]



[0192]

Los símbolos en la Fórmula (IV-1) tienen el mismo significado que los de la Fórmula (I-1). Los símbolos en la Fórmula (C) tienen el mismo significado que los de la Fórmula (I-1). Hal representa un grupo halógeno.

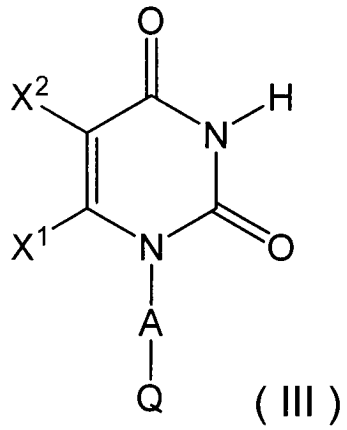
Por ejemplo, el compuesto de la Fórmula (I-1) se puede preparar haciendo reaccionar el compuesto de la Fórmula (IV-1) con el compuesto de la Fórmula (C) en presencia de una base inorgánica.

[0193]

Intermedio de producción

Un compuesto representado por la siguiente Fórmula (III) o una sal del mismo puede usarse como un intermedio de producción para producir un compuesto de la fórmula (II).

[0194]



[0195]

En la Fórmula (III), X^1 representa un átomo de hidrógeno, un grupo halógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo hidroxi, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alqueniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiltio C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfinilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfonilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquiloxi C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo ariloxi C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo ariltio C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo arilsulfinilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo arilsulfonilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido, un grupo heterocicliloxi de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo representado por R^1-CO-, un grupo carboxi, un grupo representado por R^2-O-CO-, un grupo representado por R^3R^4N-, un grupo representado por R^3R^4N-CO-, un grupo representado por R^1-CO-O-, un grupo representado por R^1-CO-NR^5-, un grupo representado por R^2-O-CO-O-, un grupo representado por R^2-O-CO-NR^5-, un grupo representado por R^3R^4N-CO-O-, un grupo representado por R^3R^4N-CO-NR^5-, un grupo representado por R^2SO_2-NR^5-, un grupo representado por R^3R^4N-SO_2-, o un grupo representado por R^1O-N=CR^6-;

cada R^1 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^2 representa independientemente un grupo alquilo C1-6

sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^3 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^4 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido,

donde R^3 y R^4 juntos pueden formar un grupo orgánico divalente,

cada R^5 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido,

R^6 representa un átomo de hidrógeno, un grupo halógeno, un grupo amino, un grupo mono-alquilamino C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo di-alquilamino C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiltio C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido;

X^2 representa un grupo representado por $R^1O\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, un grupo representado por $R^1CO\text{-}O\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, un grupo representado por $R^3R^4N\text{-}CO\text{-}O\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, un grupo representado por $R^3R^4N\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, o un grupo representado por $R^7\text{-}N{=}CR^6\text{-}$; R^1, R^3, R^4, y R^6 tienen el mismo significado que aquellos en X^1; R^7 representa un grupo heterociclilo de anillo de 5 miembros sustituido o no sustituido;

A representa un grupo alquileno C1-6 sustituido o no sustituido, un

grupo alquenileno C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinileno C2-6 sustituido o no sustituido, o un grupo cicloalquileno C3-6 sustituido o no sustituido; y

Q representa un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 10 miembros sustituido o no sustituido.

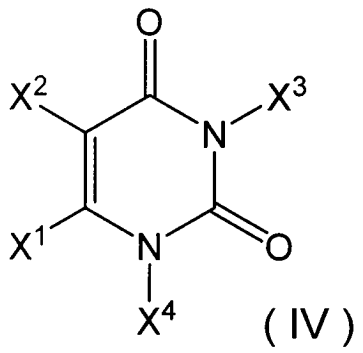
[0196]

Los símbolos de la Fórmula (III) tienen el mismo significado que los de la Fórmula (II).

[0197]

Un compuesto representado por la siguiente Fórmula (IV) o una sal del mismo puede usarse como un intermedio de producción para producir un compuesto de la fórmula (II).

[0198]



(IV)

[0199]

En la Fórmula (IV), X^1 representa un átomo de hidrógeno, un grupo halógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo hidroxi, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alqueniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiltio C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfinilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilsulfonilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquiloxi C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no

sustituido, un grupo ariloxi C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo ariltio C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo arilsulfinilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo arilsulfonilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido, un grupo heterocicliloxi de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo representado por R^1-CO-, un grupo carboxi, un grupo representado por R^2-O-CO-, un grupo representado por R^3R^4N-, un grupo representado por R^3R^4N-CO-, un grupo representado por R^1-CO-O-, un grupo representado por R^1-CO-NR^5-, un grupo representado por R^2-O-CO-O-, un grupo representado por R^2-O-CO-NR^5-, un grupo representado por R^3R^4N-CO-O-, un grupo representado por R^3R^4N-CO-NR^5-, un grupo representado por R^2SO_2-NR^5-, un grupo representado por R^3R^4N-SO_2-, o un grupo representado por R^1O-N=CR^6-;

cada R^1 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^2 representa independientemente un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^3 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de

5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

cada R^4 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido,

donde R^3 y R^4 juntos pueden formar un grupo orgánico divalente,

cada R^5 representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido,

R^6 representa un átomo de hidrógeno, un grupo halógeno, un grupo amino, un grupo mono-alquilamino C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo di-alquilamino C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiltio C1-6 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido;

X^2 representa un grupo representado por $R^1O\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, un grupo representado por $R^1CO\text{-}O\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, un grupo representado por $R^3R^4N\text{-}CO\text{-}O\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, un grupo representado por $R^3R^4N\text{-}N{=}CR^6\text{-}$, o un grupo representado por $R^7\text{-}N{=}CR^6\text{-}$; R^1, R^3, R^4, y R^6 tienen el mismo significado que aquellos en X^1; R^7 representa un grupo heterociclilo de anillo de 5 miembros sustituido o no sustituido;

X^3 representa independientemente un grupo alquilo C1-6 lineal sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 lineal sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 lineal sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterociclilo de anillo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido; y

X^4 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alcoximetilo C1-6.

[0200]

Los símbolos distintos de X^4 en la Fórmula (IV) tienen el mismo significado que los de la Fórmula (II).

Ejemplos del "grupo alcoxi C1-6" del "grupo alcoximetilo C1-6" en

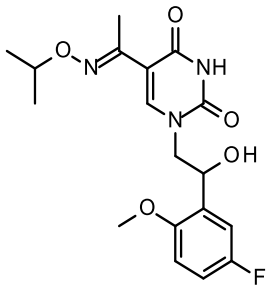
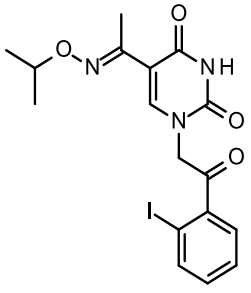
X^4 pueden incluir un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo n-pentiloxi, un grupo n-hexiloxi, un grupo i-propoxi, un grupo i-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo t-butoxi y un grupo i-hexiloxi.

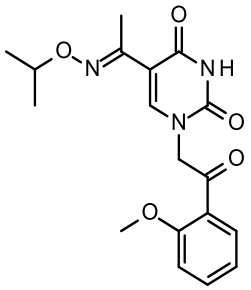
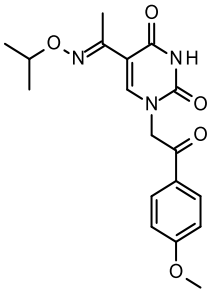
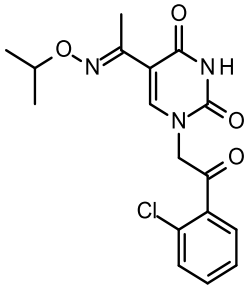
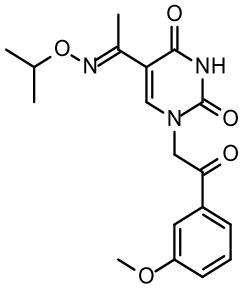
[0201]

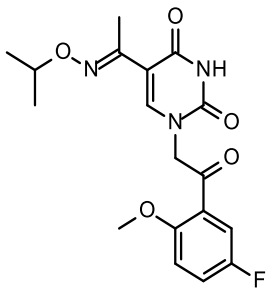
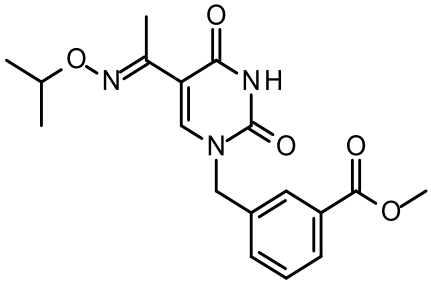
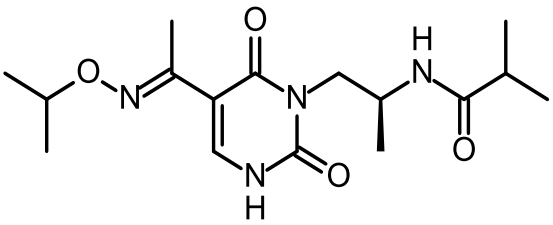
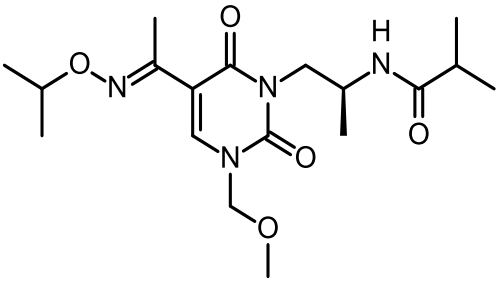
En la siguiente Tabla 1 se muestran ejemplos del intermedio de producción para su uso en la producción del compuesto (II) de la presente invención. En la tabla, el punto de fusión (p.f.) también se muestra como propiedades físicas de cada compuesto.

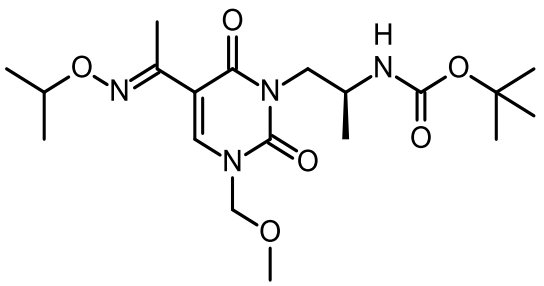
[0202]

Tabla 1

Número de compuesto	Fórmula estructural	Propiedades físicas
1		p.f. 198-200°C
2		p.f. 186-187°C

3		p.f. 185-186°C
4		p.f. 182-183°C
5		p.f. 157-158°C
6		p.f. 124-125°C

7		p.f. 199-202°C
8		p.f. 128-129°C
9		p.f. 205-206°C
10		p.f. 125-126°C

11		aceite viscoso

[0203]

Entre los compuestos descritos en la Tabla 1, para el compuesto que tiene una propiedad de aceite amorfo o viscoso, los datos de NMR de ^{1}H del mismo se muestran a continuación.

Compuesto 11: RMN de ^{1}H (CDCl3) 7,49 (1 H, s), 5,21-3,70 (7 H, m), 3,43 (3 H, s), 2,16 (3 H, s), 1,35-1,20 (9 H, m).

[0204]

Fungicida agrícola y hortícola

El fungicida agrícola y hortícola de la presente invención contiene al menos uno seleccionado del compuesto (II) y una sal del mismo como ingrediente activo. La cantidad del compuesto (II) o una sal del mismo incluida en el fungicida agrícola y hortícola de la presente invención no está particularmente limitada siempre que muestre el efecto bactericida.

[0205]

El fungicida agrícola y hortícola de la presente invención puede usarse para controlar enfermedades de las plantas derivadas de una amplia variedad de hongos filamentosos, por ejemplo, hongos pertenecientes a hongos de algas (*Oomycetes*), ascomicetos (*Ascomycetes*), hongos imperfectos (*Deuteromycetes*), hongos Basidiomycete (*Basidiomycetes*) u hongos de conjugación (*Zygomycetes*).

[0206]

A continuación se muestran ejemplos de enfermedades de las plantas (patógenos) que deben controlarse:

Remolacha azucarera: Mancha foliar por Cercospora (*Cercospora*

beticola), pudrición de la raíz por Aphanomyces (A*phanomyces cochlioides*), pudrición de la raíz (*Thanatephorus cucumeris*), tizón de la hoja (*Thanatephorus cucumeris*), roya (*Uromyces betae*), oidio (*Oidium sp.*), Mancha foliar por Ramularia (*Ramularia beticola*) y marchitamiento fúngico *(Aphanomyces cochlioides, Pythium ultimum).*

Cacahuete: mancha foliar marrón (*Mycosphaerella arachidis*), moho foliar (*Ascochyta sp.*), roya (*Puccinia arachidis*), marchitamiento fúngico (*Pythium debaryanum*), mancha foliar por Alternaria (*Alternaria alternata*), tizón sureño (*Sclerotium rolfsii*), mancha foliar (*Mycosphaerella berkeleyi*) y necrosis de vainas y raíces (*Calonectria ilicicola*).

Pepino: oidio (*Sphaerotheca fuliginea*), mildíu (*Pseudoperonospora cubensis*), tizón del tallo gomoso (*Mycosphaerella melonis*), marchitez por Fusarium (*Fusarium oxysporum*), pudrición por Sclerotinia (*Sclerotinia sclerotiorum*), moho gris (*Botrytracnose orbicina*), antracnosis (*Colletotrichum orbiculare*), sarna (*Cladosporium cucumerinum*), mancha foliar por Corynespora (*Corynespora cassiicola*), marchitamiento fúngico (*Pythium debaryanum*, *Rhizoctonia solani Kuhn*), pudrición de la raíz por Phomopsis (*Phomopsis* sp.), y mancha bacteriana (*Pseudomonas syringae* pv. *Lachrymans*).

Tomate: moho gris (*Botrytis cinerea*), moho foliar (*Cladosporium fulvum*), tizón tardío (*Phytophthora infestans*), marchitez por verticillium (*Verticillium albo-atrum, Verticillium dahliae*), mildíu (*Oidium neolycopersici*), tizón temprano (*Alternaria solani*), moho foliar por Cercospora (*Pseudocercospora fuligena*), marchitez bacteriana (*Ralstonia solanacearum*), y pudrición del tallo (*Sclerotinia sclerotiorum*).

Berenjena: moho gris (*Botrytis cinerea*), tizón negro (*Corynespora melongenae*), mildíu (*Erysiphe cichoracearum*), moho foliar (*Mycovellosiella nattrassii*), pudrición del tallo (*Sclerotinia sclerotiorum*), marchitez por verticillium (*Verticillium dahliae*), y mancha marrón (*Phomopsis vexans*).

Pimiento: tizón por phytophthora (*Phytophthora capsici*), moho gris

(*Botrytis cinerea*), pudrición por Esclerotinia (*Sclerotinia sclerotiorum*), antracnosis (*Colletotrichum aenigma, Colletotrichum capsici, Colletotrichum fructicola, Colletotrichum jiangyilliedewica*), y mildíu (*Leveillula taurica*).

Fresa: moho gris (*Botrytis cinerea*), mildíu (*Sphaerotheca humuli*), antracnosis (*Colletotrichum acutatum*, *Colletotrichum fragariae*), pudrición por phytophthora (*Phytophthora cactorum*), pudrición blanda del fruto (*Rhizopus stolonifer*), marchitez por Fusarium (*Fusarium oxysporum*), marchitez por Verticillium (*Verticillium dahliae*), y pudrición de la corona (*Sclerotinia sclerotiorum*).

Cebolla: pudrición del cuello por moho gris (*Botrytis allii*), moho gris (*Botrytis cinerea*), pudrición del cuello por moho gris (*Botrytis squamosa*), mildíu (*Peronospora destructor*), tizón de la hoja (*Phytophthora porri*), tizón de la hoja (*Ciborinia allii*), pequeña pudrición esclerótica (*Botrytis squamosa*), pudrición basal por fusarium (*Fusarium oxysporum*), pudrición de la raíz rosada (*Pyrenochaeta terrestris*), pudrición blanca (*Sclerotium cepivorum*), roya (*Puccinia allii*), y tizón sureño (*Sclerotium rolfsii*).

Cebolla galesa: pudrición blanda bacteriana (*Pectobacterium carotovorum*), mildíu (*Peronospora destructor*), tizón de la hoja (*Pleospora allii*), pudrición blanca (*Sclerotium cepivorum*), roya (*Puccinia allii*), tizón de la hoja (*Botrytis squamosa*), tizón sureño (*Sclerotium rolfsii*), y pudrición de la raíz rosada (*Pyrenochaeta terrestris*).

Repollo: hernia (*Plasmodiophora brassicae*), pudrición blanda bacteriana (*Erwinia carotovora*), pudrición negra (*Xanthomonas campesrtis* pv. *campestris*), mancha bacteriana de la hoja (*Pseudomonas syringae* pv. *maculicola*, *P. s.* pv. *alisalensis*), mildíu (*Peronospora parasitica*), pudrición por esclerotinia (*Sclerotinia sclerotiorum*), Mancha de hollín por Alternaria (*Alternaria brassicicola*), moho gris (*Botrytis cinerea*), pie negro (*Phoma lingam*), pudrición por Pythium (*Pythium aphanidermatum*, *Pythium ultimum*), y roya blanca (*Albugo macrospora*).

Lechuga: pudrición bacteriana (*Pseudomonas cichorii,*

Pseudomonas marginalis), pudrición blanda (*Pectobacterium carotovorum*), mildiú (*Bremia lactucae*), moho gris (*Botrytis cinerea*), pudrición del tallo (*Sclerotinia sclerotiorum*), enfermedad de las venas grandes (*ofiovirus de vena grande de la lechuga mirafiori*), pudrición de la raíz (*Fusarium oxysporum*), pudrición del fondo (*Rhizoctonia solani*) y mildiú (G*olovinomyces orontii*).

Haba común: pudrición del tallo (*Sclerotinia sclerotiorum*), moho gris (*Botrytis cinerea*), antracnosis (*Colletotrichum lindemuthianum*) y mancha angular de la hoja (*Phaeoisariopsis griseola*).

Guisante: tizón de mycosphaerella (*tizón de Mycosphaerella*), moho gris (*Botrytis cinerea*), pudrición por Sclerotinia (*Sclerotinia sclerotiorum*) y mildiú (*Erysiphe pisi*).

[0207]

Manzana: mildiú (*Podosphaera leucotricha*), sarna (*Venturia inaequalis*), tizón de la hoja de Monilia (*Monilinia mali*), mancha del fruto (*Mycosphaerella pomi*), chancro de Valsa (*Valsa mali*), mancha por Alternaria (*Alternaria mali*), roya (*Gymnosporangium yamadae*), pudrición anular (*Botryosphaeria berengeriana*), pudrición amarga (*Glomerella cingulata, Colletotrichum acutatum*), mancha (*Diplocarpon mali*), mancha de mosca (*Zygophiala jamaicensis*), mancha de hollín (*Gloeodes pomigena*), pudrición violeta de la raíz (*Helicobasidium mompa*), pudrición blanca de la raíz (*Rosalia necatrix*), moho gris (*Botrytis cinerea*), fuego bacteriano (*Erwinia amylovora*), hoja de plata (*Chondrostereum purpureum*) y agalla de corona (*Rhizobium radiobacter, Rhizobium rhizogenes*).

Damasco japonés: sarna (*Cladosporium carpophilum*), moho gris (*Botrytis cinerea*), pudrición marrón (*Monilinia mumecola*), mancha de hollín (*Peltaster sp.*), hoyo (*Taphrina pruni*) y cribado marrón de las hojas (*Phloeosporella padi*).

Caqui: mildiú (*Phyllactinia kakicola*), antracnosis (*Gloeosporium kaki*), mancha angular de la hoja (*Cercospora kaki*), mancha circular de la

hoja (*Mycosphaerella nawae*), moho gris (*Botrytis cinerea*) y mancha de mosca (*Zygophiala jamaicensis*).

Durazno: pudrición marrón (*Monilinia fructicola, Monilia fructigena*), sarna (*Cladosporium carpophilum*), pudrición por Phomopsis (*Phomopsis sp.*), agujero bacteriano (*Xanthomonas campestris pv. Pruni*), enrollamiento de la hoja (*Taphrina deformans*), antracnosis (*Colletotrichum gloeosporioides*), mancha foliar por Cylindrosporium (*Phloeosporella padi*) y pudrición del tallo por Coriolus (*Coriolus versicolor*).

Almendra: pudrición marrón (*Monilinia laxa*), mancha (*Stigmina carpophila*), sarna (*Cladosporium carpophilum*), mancha foliar roja (*Polystigma rubrum*), mancha de Alternaria (*Alternaria alternata*) y antracnosis (*Colletotrichum gloeospoides*).

Durazno amarillo: pudrición marrón (*Monilinia fructicola*), antracnosis (*Colletotrichum acutatum*), mancha negra (*Alternaria sp.*), pudrición del fruto joven (*Monilinia kusanoi*), mancha foliar por Cylindrosporium (*Mycosphaerella cerasella*) y mildiú (*Podosphaera tridactyla*).

Uva: moho gris (*Botrytis cinerea*), mildiú (*Uncinula necator*), pudrición madura (*Glomerella cingulata, Colletotrichum acutatum*), mildiú (*Plasmopara viticola*), pudrición ocular de pájaro (*Elsinoe ampelina*), mancha foliar por isariopsis (*Pseudocercospora vitisis*), pudrición negra (*Guignardia bidwellii*), pudrición blanca (*Coniella castaneicola*), roya de la hoja (*Phakopsora ampelopsidis*), racimo algodonoso (patógeno no identificado) y agalla de corona (*Rhizobium radiobacter, Rhizobium vitis*).

Pera: sarna (*Venturia nashicola*), roya(*Gymnosporangium asiaticum*), mancha negra (*Alternaria kikuchiana*), pudrición anular (*Botryosphaeria berengeriana*), mildiú (*Phyllactinia mali*), chancro de Phomopsis (*Phomopsis fukushii*), mancha marrón (*Stemphylium vesicarium*) y antracnosis (*Glomerella cingulata*).

Té: tizón gris (*Pestalotiopsis longiseta, P. theae*), antracnosis

(*Colletotrichum theae-sinensis*), tizón ampollar neto (*Exobasidium reticulatum*), tizón bacteriano de los brotes (*Pseudomonas syringae*) y tizón ampolla (*Exobasidium vexans*).

Frutos cítricos: sarna (*Elsinoe fawcettii*), moho azul (*Penicillium italicum*), moho verde (*Penicillium digitatum*), moho gris (*Botrytis cinerea*), mancha negra (*Diaporthe citri*), chancro (*Xanthomonas campestris pv*. *Citri*), mildiú (*Oidium sp*.), tizón tardío (*Phytophthora citrophthora*) y antracnosis (*Colletotrichum fioriniae*).

Kiwi: tizón bacteriano de la flor (*Pseudomonas marginalis*, *Pseudomonas syringae, Pseudomonas viridiflava*), chancro bacteriano (*Pseudomonas syringae*), moho gris (*Botrytis cinerea*), pudrición blanda (*Botryosphaeria dothidea*, *Diaporthe* sp., *Lasiodiplodia theobromae*), y mancha de hollín (*Pseudocercospora actinidiae*).

Olivo: antracnosis (*Colletotrichum acutatum, Colletotrichum gloeosporioides*) y mancha de pavo real (*Spilocaea oleaginea*).

Castaña: antracnosis (*Colletotrichum gloeosporioides*).

[0208]

Trigo: mildiú (*Blumeria graminis f. Sp. Tritici*), tizón por Fusarium (*Gibberella zeae, Fusarium avenaceum, Fusarium culmorum, Fusarium crookwellense, Microdochium nivale*), roya marrón (*Puccinia recondita*), roya rayada (*Puccinia Striiformis*) pudrición de raíz por pardeamiento (*Pythium iwayamai*), moho de la nieve (*Monographella nivalis*), mancha ocular (*Pseudocercosporella herpotrichoides*), mancha foliar moteada (*Septoria tritici*), mancha de la gluma (*Leptosphaeria nodorum*), tizón de la nieve Typhula (*Typhula incarnata*), tizón de la nieve por Sclerotinia (*Myriosclerotinia borealis*), añublo (*Gaeumannomyces graminis*), cornezuelo (*Claviceps purpurea*), añublo del trigo (*Tilletia caries*), carbón desnudo (*Ustilago nuda*), anublo (*Pyricularia grisea*), marchitamiento fúngico (*Pythium spp., Fusarium spp., Rhizoctonia spp.*) y tizón de las plántulas (*Pythium spp., Fusarium spp., Rhizoctonia spp.*).

Cebada: franja (*Pyrenophora graminea*), mancha en red

(*Pyrenophora teres*), escaladura (*Rhynchosporium secalis*), carbón desnudo (*Ustilago tritici, U. nuda*), marchitamiento fúngico (*Pythium spp., Fusarium spp., Rhizoctonia spp.*), y tizón de las plántulas (*Pythium* spp., *Fusarium* spp., *Rhizoctonia* spp.).

Arroz: anublo (*Pyricularia oryzae*), tizón de la vaina (*Rhizoctonia solani*), enfermedad de "Bakanae" (*Gibberella fujikuroi*), mancha marrón (*Cochliobolus miyabeanus*), tizón de las plántulas (*Pythium graminicola*), tizón bacteriano de las hojas (*Xanthomonas oryzae*), tizón bacteriano de las plántulas (*Burkholderia plantarii*), raya marrón bacteriana (*Acidovorax avenae*), pudrición bacteriana del grano (*Burkholderia glumae*), mancha foliar por Cercospora (*Cercospora oryzae*), tizón falso (*Ustilaginoidea virens*), granos de arroz descoloridos (*Alternaria alternata, Curvularia intermedia*), decoloración del grano (*Alternaria padwickii*) y coloración rosada de los granos de arroz (*Epicoccum purpurascens*).

Tabaco: Pudrición del tallo por Sclerotinia (*Sclerotinia sclerotiorum*), mildiú (*Erysiphe cichoracearum*) y tallo negro (*Phytophthora nicotianae*).

Tulipán: moho gris (*Botrytis cinerea*), tizón de Botrytis (*Botrytis tulipae*), pudrición de la hoja (*Rhizoctonia solani*), pudrición del bulbo (*Fusarium oxysporum*) y pudrición de la carcasa del bulbo (*Rhizoctonia solani*).

Rosa: mancha negra (*Diplocarpon rosae*), mildiú (*Erysiphe simulans, Podosphaera pannosa*) y tizón de Botrytis (*Botrytis cinerea*).

Crisantemo: Tizón por Botrytis (*Botrytis cinerea*), roya (*Puccinia horiana*), mildiú (*Paraperonospora minor, Peronospora danica*), tizón por Pythium (*Pythium aphanidermatum*, *Pythium dissotocum*, *Pythium helicoides*, *Pythium oedochilum*, *Pythium sylvaticum*), pudrición de raíz y tallo (*Rhizoctonia solani*), y tizón por Fusarium (*Fusarium solani*).

Gerbera: moho gris (*Botrytis cinerea*) y mildiú (*Podosphaera xanthii*).

Lirio: Tizón por Botrytis (*Botrytis elliptica, Pestalotiopsis sp.*) y moho gris (*Botrytis cinerea*).

Girasol: mildiú (*Plasmopara halstedii*), pudrición por Sclerotinia (*Sclerotinia sclerotiorum*) y moho gris (*Botrytis cinerea*).

Agrostis: Tizón de la nieve por Sclerotinia (*Sclerotinia borealis*), mancha grande (*Rhizoctonia solani*), mancha marrón (*Rhizoctonia solani*), mancha del dólar (*Sclerotinia homoeocarpa*), anublo (*Pyricularia sp.*), *tizón rojo por Pythium* (*Pythium aphanidermatum*) y antracnosis (*Colletotrichum graminicola*).

hierba Orchard: mildiú (*Erysiphe graminis*).

Soja: mancha púrpura (*Cercospora kikuchii*), mildiú (*Peronospora manshurica*), pudrición del tallo (*Phytophthora sojae*), roya (*Phakopsora pachyrhizi*), pudrición por Sclerotinia (*Sclerotinia sclerotiorum*), antracnosis (*Colletotrichum truncatum*), moho gris (*Botrytis cinerea*) sarna por Sphaceloma (*Elsinoe glycines*), tizón de la vaina y del tallo (*Diaporthe phaseolorum var. sojae*), marchitamiento fúngico (*Pythium spp., Fusarium spp., Rhizoctonia spp.*), y tizón de las plántulas (*Pythium* spp., *Fusarium* spp., *Rhizoctonia* spp.).

Patata: tizón tardío (*Phytophthora infestans*), tizón temprano (*Alternaria solani*), viruela de la patata (*Thanatephorus cucumeris*), marchitez por Verticillium (*Verticillium albo-atrum, V. dahliae, V. nigrescens*), pie negro (*Pectobacterium atrosepticum*), pudrición blanda bacteriana (*Pectobacterium carotovorum*), moho gris (*Botrytis cinerea*), sarna común (*Streptomyces spp.*) y pudrición esclerótica (*Sclerotinia sclerotiorum*).

Ñame: mancha foliar (*Cylindrosporium dioscoreae*), antracnosis (*Colletotrichum gloeosporioides*) y moho azul (*Penicillium sclerotigenum*).

Boniato: pudrición de la raíz violeta (*Helicobasidium mompa*) y pudrición del tallo (*Fusarium oxysporum*).

Taro: Tizón por Phytophthora (*Phytophthora colocasiae*) y pudrición del tallo (*Rhizoctonia solani*).

Jengibre: pudrición de la raíz (*Pythium ultimum, Pythium myriotylum*) y mancha foliar (*Phyllosticta zingiberis*).

Plátano: Enfermedad de Panamá (*Fusarium oxysporum*) y enfermedad de Sigatoka (*Mycosphaerella fijiensis, M. musicola*).

Mango: antracnosis (*Colletotrichum aenigma*), chancro bacteriano (*Xanthomonas campestris*), pudrición del extremo del tallo (*Diaporthe pseudophoenicicola*, *Lasiodiplodia theobromae*, *Lasiodiplodia* spp., *Neofusicoccum parvum*, *Neofusicoccum* sp.), y moho gris (*Botrytis cinerea*).

Colza: Pudrición por Sclerotinia (*Sclerotinia sclerotiorum*), pudrición de la raíz (*Phoma lingam*), mancha gris de la hoja (*Alternaria brassicae*), mildiú (*Erysiphe cruciferarum*, *Erysiphe cichoracearum*, *Oidium matthiolae*), y mildiú (*Peronospora parasitica*).

Café: roya (*Hemileia vastatrix*), antracnosis (*Colletotrichum coffeanum*) y mancha foliar (*Cercospora coffeicola*).

Caña de azúcar: roya parda (*Puccinia melanocephala*).

Maíz: mancha foliar zonada (*Gloeocercospora sorghi*), roya (*Puccinia sorghi*), roya del sur (*Puccinia polysora*), tizón (*Ustilago maydis*), mancha foliar del sur (*Cochliobolus heterostrophus*), tizón foliar (*Setosphaeria turcica*), marchitamiento fúngico (*Pythium* spp., *Fusarium* spp., *Rhizoctonia* spp.), y tizón de las plántulas (*Pythium* spp., *Fusarium* spp., *Rhizoctonia* spp.).

Algodón: tizón de las plántulas (*Pythium sp.*), roya (*Phakopsora gossypii*), mildiú (*Mycosphaerella areola*) y antracnosis (*Glomerella gossypii*).

Lúpulo: mildiú (*Pseudoperonospora humuli*), mildiú (*Oidium sp., Podosphaera macularis*) y moho gris (*Botrytis cinerea*).

[0209]

Nematicida

El compuesto de dihidropirimidina de la presente invención tiene un excelente efecto de control sobre varios nematodos que afectan el crecimiento de las plantas.

El nematicida de la presente invención contiene al menos uno

seleccionado del compuesto (II) y una sal del mismo como ingrediente activo. La cantidad del compuesto (II) o una sal del mismo incluida en el nematicida de la presente invención no está particularmente limitada siempre que muestre el efecto de control sobre los nematodos.

[0210]

A continuación se muestran ejemplos específicos de nematodos parásitos de plantas que pueden ser controlados por el nematicida de la presente invención: (1) Orden *Tylenchida*

(a) nematodos de la familia *Anguinidae*, por ejemplo, especies pertenecientes al género *Anguina (Anguina spp.)* tales como *Anguina funesta* y *Anguina tritici*; y especies pertenecientes al género *Ditylenchus (Ditylenchus spp.)* tales como *Ditylenchus destructor, Ditylenchus dipsaci* y *Ditylenchus myceliophagus;*

(b) nematodos de la familia *Aphelenchoididae*, por ejemplo, especies pertenecientes al género *Aphelenchoides (Aphelenchoides spp.)* tales como *Aphelenchoides besseyi*, *Aphelenchoides fragariae* y *phelenchoides ritzemabosi*; y especies pertenecientes al género *Bursaphelenchus (Bursaphelenchus spp.)* tales como *Bursaphelenchus xylophilus;*

(c) nematodos de la familia *Belonolaimidae*, por ejemplo, especies pertenecientes al género *Belonolaimus (Belonolaimus spp.)* tales como *Belonolaimus longicaudatus*; y especies pertenecientes al género *Tylenchorhynchus (Tylenchorhynchus spp.)* tales como T*ylenchorhynchus claytoni* y *Tylenchorhynchus dubius;*

(d) nematodos de la familia *Criconematidae* tales como *Criconema mutabile;*

(e) nematodos de la familia *Dolichodoridae* tales como *Dolichodorus mediterraneus;*

(f) nematodos de la familia *Ecphyadophoridae* tales como *Ecphyadophora tenuissima;*

(g) nematodos de la familia *Hemicycliophoridae* tales como *Loofia*

thienemanni;

(h) nematodos de la familia *Heteroderidae*, por ejemplo, especies pertenecientes al género *Globodera (Globodera spp.)* tales como *Globodera rostochiensis, Globodera pallida* y *Globodera tabacum*; y especies pertenecientes al género *Heterodera (Heterodera spp.)* tales como *Heterodera avenae, Heterodera cruciferae, Heterodera glycines, Heterodera schachtii* y *Heterodera trifolii*;

(i) nematodos de la familia *Hoplolaimidae*, por ejemplo, especies pertenecientes al género *Helicotylenchus (Helicotylenchus spp.)* tales como *Helicotylenchus dihystera* y *Helicotylenchus multicinctus*; especies pertenecientes al género *Hoplolaimus (Hoplolaimus spp.)* tales como *Hoplolaimus columbus* y *Hoplolaimus galeatus*; y otras tales como *Rotylenchus robustus* y *Rotylenchulus reniformis;*

(j) nematodos de la familia *Meloidogynidae*, por ejemplo, especies pertenecientes al género *Meloidogyne (Meloidogyne spp.)* tales como *Meloidogyne arenaria, Meloidogyne chitwoodi, Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloidogyne javanica* y *Meloidogyne thamesi;*

(k) nematodos de la familia *Nothotylenchidae* tales como *Nothotylenchus acris;*

(l) nematodos de la familia *Paratylenchidae*, por ejemplo, especies pertenecientes al género *Paratylenchus (Paratylenchus spp.)* tales como *Paratylenchus curvitatus* y *Paratylenchus elachistus*; y

(m) nematodos de la familia *Pratylenchidae*, por ejemplo, especies pertenecientes al género *Pratylenchus (Pratylenchus spp.)* tales como *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus coffeae*, *Pratylenchus curvitatus*, *Pratylenchus fallax*, *Pratylenchus goodeyi*, *Pratylencus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylencus scribneri*, *Pratylenchus vulnus*, and *Pratylenchus zeae*; y otras tales como *Nacobbus aberrans*, *Radopholus similis*, *Tylenchulus semipenetrans* y *Radopholus citrophilus*.

[0211]

(2) Orden *Dorylaimida*

(a) nematodos de la familia *Longidoridae*, por ejemplo, especies pertenecientes al género *Longidorus (Longidorus spp.)* tales como Longidorus alargados; y especies pertenecientes al género *Xiphinema (Xiphinema spp.)* tales como *Xiphinema americanum, Xiphinema brevicolle, Xiphinema index* y *Xiphinema diversicaudatum.*

[0212]

(3) Orden *Triplonchida*

(a) nematodos de la familia *Trichodoridae* tales como *Trichodorus primitivus* y *Paratrichodorus minor*.

[0213]

Método de aplicación y agente de mezcla

El fungicida agrícola y hortícola o el nematicida de la presente invención se utilizan preferiblemente para cereales; verduras; hortalizas de raíz; papas; árboles tales como frutales, té, café y cacao; pastos; céspedes; y plantas tales como el algodón.

[0214]

El fungicida agrícola y hortícola de la presente invención se puede aplicar a cada parte de plantas tales como hojas, troncos, tallos, flores, capullos, frutos, semillas, brotes, raíces, tubérculos, raíces tuberosas, brotes y esquejes. El nematicida se puede aplicar a raíces, tubérculos, raíces tuberosas y similares. El nematicida se puede aplicar también a variedades mejoradas/variedades modificadas, cultivares, así como a mutantes, híbridos y organismos genéticamente modificados (OGM) de estas plantas.

[0215]

El fungicida agrícola y hortícola de la presente invención se puede usar para el tratamiento de semillas, aplicación de follaje, aplicación al suelo, aplicación de superficie de agua y similares para controlar diversas enfermedades que ocurren en plantas de cultivos agrícolas y hortícolas, incluidas flores, céspedes y pastos. El nematicida se puede usar para el tratamiento de semillas, aplicación al suelo y similares.

[0216]

El fungicida agrícola y hortícola o el nematicida de la presente invención puede contener otros ingredientes además del compuesto de dihidropirimidina de la presente invención. Ejemplos de los otros ingredientes pueden incluir un portador conocido convencionalmente que se utilizará para la formulación. Ejemplos adicionales de los otros ingredientes pueden incluir un fungicida, un insecticida/acaricida, un nematicida, un pesticida para el suelo, un regulador de plantas, un sinergista, un fertilizante, un acondicionador del suelo y un pienso para conocido convencionalmente. Contener estos otros ingredientes puede causar un efecto sinérgico.

Es decir, un aspecto de la presente invención puede incluir un fungicida agrícola y hortícola que incluya uno o más fungicidas adicionales.

[0217]

A continuación se muestran ejemplos específicos de fungicidas que se pueden mezclar o usar en combinación con el fungicida agrícola y hortícola o el nematicida de la presente invención:

(1) Inhibidores de la biosíntesis de ácido nucleico:

(a) inhibidores de ARN polimerasa I: benalaxil, benalaxil-M, furalaxil, metalaxil, metalaxil-M; oxadixil; clozilacon, ofurace;

(b) inhibidores de adenosina deaminasa: bupirimato, dimetirimol, etirimol;

(c) inhibidores de la síntesis de ADN/ARN: himexazol, octilinona;

(d) Inhibidores de ADN topoisomerasa II: ácido oxolínico.

[0218]

(2) Agentes antimitóticos e inhibidores de la división celular:

(a) inhibidores de polimerización de β-tubulina: benomilo, carbendacima, clorfenazol, fuberidazol, tiabendazol; tiofanato, tiofanato de metilo; dietofencarb; zoxamida; etaboxam;

(b) inhibidores de división celular: pencicurona;

(c) inhibidores de deslocalización de la proteína similar a espectrina: fluopicolida, fluopimomida.

[0219]

(3) Inhibidores de la respiración:

(a) inhibidores del complejo I de oxidorreductasa de NADH: diflumetorim; tolfenpirad;

(b) inhibidores del complejo II de succinato de deshidrogenasa: benodanil, flutolanil, mepronil; isofetamid; fluopiram; fenfuram, furmeciclox; carboxin, oxicarboxin; tifluzamida; benzovindiflupir, bixafén, fluxapiroxad, furametpir, isopirazam, penflufén, pentiopirad, sedaxano; boscalid, pidiflumetofén, isoflucipram, piraziflumid, inpirfluxam;

(c) inhibidores del complejo III de ubiquinol oxidasa Qo: azoxistrobin, coumoxistrobin, coumetoxistrobin, enoxastrobin, flufenoxistrobin, picoxistrobin, piraoxistrobin; pyraclostrobin, pirametostrobin, triclopiricarb; kresoxim-metil, trifloxistrobin; dimoxistrobin, fenaminstrobin, metominostrobin, orisastrobin; famoxadona; fluoxastrobin; fenamidona; piribencarb; metiltetraprole; mandestrobin;

(d) inhibidores del complejo III de ubiquinol reductasa Qi: ciazofamida; amisulbrom; fenpicoxamid;

(e) desacopladores de fosforilación oxidativa: binapacrilo, meptildinocap, dinocap; fluazinam; ferimzona;

(f) inhibidores de la fosforilación oxidativa (inhibidores de ATP sintasa): acetato de fentina, cloruro de fentina, hidróxido de fentina;

(g) inhibidor de la producción de ATP: siltiofam;

(h) complejo III: inhibidor Qx (desconocido) del citocromo bc1 (ubiquinona reductasa): ametoctradin.

[0220]

(4) Inhibidores de la síntesis de aminoácidos y proteínas:

(a) inhibidores de la biosíntesis de metionina: andoprim, ciprodinil, mepanipirim, pirimetanil;

(b) inhibidores de la síntesis de proteínas: blasticidina-S,

kasugamicina, clorhidrato de kasugamicina, estreptomicina, oxitetraciclina.

[0221]

(5) Inhibidores de transducción de señales:

(a) Inhibidores de la transducción de señales: quinoxifen, proquinazid;

(b) inhibidores de MAP/histidina quinasa en la transducción de señales osmóticas: fenpiclonil, fludioxonil; clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolina.

[0222]

(6) Inhibidores de la síntesis de lípidos y membranas celulares:

(a) inhibidores de biosíntesis de fosfolípidos y metiltransferasa: edifenfós, iprobenfós, pirazofós; isoprotiolano;

(b) agentes de peroxidación lipídica: bifenilo, cloroneb, dicloran, quintoceno, tecnaceno, tolclofós-metilo; etridiazol;

(c) agentes que actúan sobre membranas celulares: yodocarb, propamocarb, hidrocloruro de propamocarb, propamocarb-fosetilato, protiocarb;

(d) microorganismos que alteran las membranas celulares patógenas: Bacillus subtilis, Bacillus subtilis cepa QST713, Bacillus subtilis cepa FZB24, Bacillus subtilis cepa MBI600, Bacillus subtilis cepa D747;

(e) agentes que alteran membranas celulares: extractos de Melaleuca alternifolia (árbol de té).

[0223]

(7) Inhibidores de la biosíntesis de esteroles de membranas celulares:

(a) Inhibidores de la desmetilación de la posición C14 en la biosíntesis de esteroles: triforina, pirifenox, pirisoxazol, fenarimol, flurprimidol, nuarimol; imazalil, imazalil-sulfato, oxpoconazol, pefurazoato, procloraz, triflumizol, viniconazol, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M,

epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, fluconazol, fluconazol-cis, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanil, penconazol, propiconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefón, triadimenol, triticonazol, protioconazol, voriconazol, mefentrifluconazol;

(b) inhibidores de Δ14 reductasa y Δ8 $\rightarrow$ Δ7-isomerasa en la biosíntesis de esteroles: aldimorf, dodemorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tridemorf; fenpropidina, piperalina; espiroxamina;

(c) inhibidores de 3-ceto reductasa en la desmetilación en posición C4 en el sistema de biosíntesis de esteroles: fenhexamida; fenpirazamina;

(d) inhibidores de escualeno epoxidasa en el sistema de biosíntesis de esteroles: piributicarb; naftifina, terbinafina.

[0224]

(8) Inhibidores de la síntesis de la pared celular:

(a) inhibidor de trehalasa: validamicina;

(b) inhibidores de quitina sintetasa: polioxina, polioxorim;

(c) inhibidores de la celulosa sintetasa: dimetomorf, flumorf, pirimorf; bentiavalicarb, iprovalicarb, valifenalato; mandipropamid.

[0225]

(9) inhibidores de la biosíntesis de melanina

(a) inhibidores de reductasa en la biosíntesis de melanina: ftalida; piroquilon; triciclazol;

(b) inhibidores de anhidrasa en la biosíntesis de melanina: carpropamida; diclocimet; fenoxanil;

(c) Inhibidores de síntesis de policétidos en la biosíntesis de melanina: tolprocarb.

[0226]

(10) Inductores de resistencia de plantas huésped:

(a) agentes que actúan sobre la vía sintética del ácido salicílico: acibenzolar-S-metil;

(b) otros agentes: probenazol; tiadinil; isotianil; diclobentiazox,

ipfentrifluconazol, laminarina; líquido de extracción de *Fallopia sachalinensis*.

[0227]

(11) Agentes con acciones desconocidas: cimoxanil, fosetil-aluminio, ácido fosfórico (fosfatos), tecloftalam, triazóxido, flusulfamida, diclomecina, metasulfocarb, ciflufenamid, metrafenona, piriofenona, dodina, base libre de dodina, flutianil.

[0228]

(12) Agentes que tienen múltiples puntos de acción: cobre (sales de cobre), caldo bordelés, hidróxido de cobre, naftalato de cobre, óxido de cobre, oxicloruro de cobre, sulfato de cobre, azufre, productos de azufre, polisulfuro de calcio; ferbam, mancozeb, maneb, mancopper, metiram, policarbamato, propineb, tiram, zineb, ziram; captan, captafol, folpet; clorotalonil; diclofluanida, tolilfluanida; guazatina, acetato de guazatina, acetatos de iminoctadina (triacetato de iminoctadina), albesilatos de iminoctadina (trialbesilato de iminoctadina); anilazina; ditianón; quinometionato; fluoroimida.

[0229]

(13) Otros agentes: DBEDC, flúor folpet, bis(8-quinolinolato) cobre (II), propamidina, cloropicrina, ciprofuram, agrobacterium, betoxazin, difenilamina, isotiocianato de metilo (MITC), mildiomicin, capsaicina, cufraneb, ciprosulfamida, dazomet, debacarb, diclorofén, difenzoquat, metilsulfonato de difenzoquat, flumetover, fosetil calcio, fosetil sodio, irumamicina, natamicina, nitrotal-isopropil, oxamocarb, pirrolnitrina, tebufloquin, tolnifanida, zarilamid, algofase, amicartiazol, oxatiapiprolin, fluoxapiprolina, metiram zinc, bentiazol, triclamida, uniconazol, oxifentin, picarbutrazox, quinofumelina, florilpicoxamid, pirapropoina, fluindapir, aminopirifén, piridaclometil, ipflufenoquina, dipimetitrona.

[0230]

A continuación se muestran ejemplos específicos de un insecticida/acaricida, un nematicida, un pesticida para el suelo y un

antihelmíntico que se pueden mezclar o usar en combinación con el fungicida agrícola y hortícola o el nematicida de la presente invención:

(1A) Inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE) (basados en carbamato):

alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbaril, carbofurano, carbosulfán, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamil, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC, xililcarb.

[0231]

(1B) Inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE) (basados en organofosforados):

acefato, azametifós, azinfos-etilo, azinfos-metilo, cadusafós, cloretoxifós, clorfenvinfós, clormefós, clorpirifós, clorpirifós-metilo, cumafós, cianofós, demetón-S-metilo, diazinón, diclorvós,

dicrotofós, dimetoato, dimetilvinfós, disulfotón, EPN, etión, etoprofós, famfur, fenamifós, fenitrotión, fentión, fostiazato, heptenofós, imiciafós, isofenfós, isopropil=O-(metoxiaminotiofosforil)salicilato, isoxatión, malatión, mecarbam, metamidofós, metidatión, mevinfós, monocrotofós, naled, ometoato, oxidemetón-metilo, paratión, paratión-metilo, fenoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidón, foxim, pirimifos-metilo, profenofós, propetamfós, protiofós, piraclofós, piridafentión, quinalfós, sulfotep, tebupirimfós, temefós, terbufós, tetraclorvinfós, tiometón, triazofós, triclorfón, vamidotión.

[0232]

(2) Bloqueadores de canales de iones de cloruro (iones de cloro) accionados por GABA:

clordano, endosulfán; etiprol, fipronil.

flufiprol.

(3A) Moduladores de los canales de sodio (basados en piretroides):

acrinatrina, aletrina, d-cis/trans aletrina, d-trans aletrina, bifentrina,

bioaletrina, isómeros de bioaletrina-S-ciclopentenilo, biorresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, β-ciflutrina, cihalotrina, λ-cihalotrina, γ-cihalotrina cipermetrina, α-cipermetrina, β-cipermetrina, θ-cipermetrina, ζ-cipermetrina, cifenotrina [(1R)-trans isómeros], deltametrina, empentrina [(EZ)(1R)-isómeros], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, τ-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, kadetrina, permetrina, fenotrina [(1R)-trans isómeros], praletrina, piretrina, resmetrina, silafluofén, teflutrina, tetrametrina, tetrametrina [(1R)-isómeros], tralometrina, transflutrina.

κ-bifentrina, cloropraleturina, heptaflutrina, meperflutrina, ε-metoflutrina, momfluorotrina, ε-momfluorotrina, κ-teflutrina, tetrametilflutrina; bioetanometrina.

(3B) Moduladores de canal de sodio (DDT):

DDT, metoxiclor.

[0233]

(4) Moduladores competitivos del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR):

acetamiprid, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid, tiametoxam; nicotina; sulfoxaflor; flupiradifurona; triflumezopirim.

dicloromezotiaz, flupirimina.

(5) Moduladores alostéricos del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR):

spinetoram, spinosad.

(6) Moduladores alostéricos del canal de ion cloruro glutamatérgico (ion cloro) (GluCl):

abamectina, emamectina, benzoato de emamectina, lepimectina, milbemectina.

doramectina, eprinomectina, ivermectina, moxidectina, selamectina.

(7) Agentes análogos de hormonas juveniles:

hidropreno, kinopreno, metopreno; fenoxicarb; piriproxifeno.

(8) Otros inhibidores inespecíficos (multisitio):

bromuro de metilo, alquilos halogenados; cloropicrina; fluoruro de aluminio y sodio, fluoruro de sulfurilo; bórax, ácido bórico, octaborato de disodio, borato de sodio, metaborato de sodio; emético tártaro; dazomet, metam, metam-potasio, metam-sodio.

(9) Moduladores de los canales TRPV de los órganos cordotonales:

pimetrozina, pirifluquinazon; afidopiropen.

[0234]

(10) Inhibidores del crecimiento de ácaros:

clofentezina, diflovidazina, hexitiazox, etoxazol.

(11) Agentes disruptores de la membrana interna del intestino medio de insectos derivados de microorganismos:

B. t. subsp. israelensis, B. t. subesp. aizawai, B.t. subsp. kurstaki, B.t. subsp. tenebrionis; proteínas contenidas en B. t. cultivos: CrY1Ab, CrY1Ac, CrY1Fa, CrY1A.105, CrY2Ab, Vip3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34Ab1/Cry35Ab1; Bacillus sphaericus.

(12) Inhibidores de la enzima biosintética del ATP mitocondrial:

diafentiurón, azociclotina, cihexatina, óxido de fenbutatina, propargita, tetradifón.

(13) Agentes desacopladores de la fosforilación oxidativa que interrumpen el gradiente de protones:

clorfenapir, DNOC, sulfluramida.

(14) Bloqueador del canal del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR):

bensultap, hidrocloruro de cartap, tiociclam, sal monosódica de tiosultap.

(15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0:

bistriflurón, clorfluazurón, diflubenzurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, teflubenzurón, triflumurón.

(16) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1:

buprofezina.

(17) Inhibidores de la muda:

ciromazina.

(18) Agonistas del receptor de la hormona de la muda (ecdisona):

cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida.

(19) Agonistas del receptor de octopamina:

amitraz.

[0235]

(20) Inhibidores del complejo III del sistema de transporte de electrones mitocondriales:

hidrametilnon; acequinocilo; fluacripirim; bifenazato.

(21) Inhibidores del complejo I del sistema de transporte de electrones mitocondriales (METI):

fenazaquin, fenpiroximato, piridaben, pirimidifeno, tebufenpirad, tolfenpirad; rotenona.

(22) Bloqueadores del canal de sodio dependientes del voltaje:

indoxacarb, metaflumizona.

(23) Inhibidores de la acetil CoA carboxilasa:

espirodiclofeno, espiromesifeno, espirotetramat.

espiropidión.

(24) Inhibidores del complejo IV del sistema de transporte de electrones mitocondriales:

fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfuro de zinc, fosfina; cianuro de calcio, cianuro de sodio, cianuro de potasio.

(25) Inhibidores del complejo II del sistema de transporte de electrones mitocondriales:

cienopirafén, ciflumetofén, piflubumida.

(28) Moduladores del receptor de rianodina:

clorantraniliprol, ciantraniliprol, ciclaniliprol, flubendiamida.

ciclodiamida, tetraclorantraniliprol, tetraniliprol.

(29) Modulador de órganos cordotonales, sitio objetivo no identificado:

flonicamid.

(30) Moduladores alostéricos del canal de iones cloruro (iones cloro) accionados por GABA:

broflanilida, fluxametamida.

isocicloseram; afoxolaner, fluralaner, lotilaner, sarolanar.

Otros insecticidas/acaricidas:

azadiractina, benzoximato, bromopropilato, quinometionato, dicofol, cal de azufre, mancozeb, piridalilo, azufre.

acinonapir, benzpirimoxan, flometoquin, fluhexafón, oxazosulfil, ticlopirazoflor.

[0236]

Antihelmínticos:

(a) Antihelmínticos basados en bencimidazol: fenbendazol, albendazol, triclabendazol, oxibendazol, mebendazol, oxfendazol, parbendazol, flubendazol; febantel, netobimina, tiofanato; tiabendazol, cambendazol;

(b) Antihelmínticos basados en salicilanilida: closantel, oxiclozanida, rafoxanida, niclosamida;

(c) Antihelmínticos basados en fenol sustituido: nitroxinil, nitroscanato;

(d) Antihelmínticos basados en pirimidina: pirantel, morantel;

(e) Antihelmínticos basados en imidazotiazol: levamisol, tetramisol;

(f) Antihelmínticos basados en tetrahidropirimidina: prazicuantel, epsiprantel;

(g) Otros antihelmínticos: ciclodieno, riania, clorsulón, metronidazol, demiditraz; piperazina, dietilcarbamazina, diclorofeno, monepantel, tribendimidina, amidantel; tiacetarsamida, melarsomina, arsenamida.

[0237]

A continuación se muestran ejemplos específicos de reguladores de plantas que se pueden mezclar o usar en combinación con el fungicida agrícola y hortícola o el nematicida de la presente invención:

Ácido abscísico, quinetina, bencilaminopurina, 1,3-difenilurea, forclorfenurón, tidiazurón, clorfenurón, dihidroseatina, giberelina A, giberelina A4, giberelina A7, giberelina A3, 1-metilciclopropano, N-acetil aminoetoxivinil glicina (también conocido como aviglicina), ácido aminooxiacético, nitrato de plata, cloruro de cobalto, IAA, 4-CPA, cloroprop, 2,4-D, MCPB, ácido indol-3-butírico, diclorprop, fenotiol, 1-naftilacetamida, eticlozato, croxifonac, hidracida maléica, ácido 2,3,5-triiodobenzoico, ácido salicílico, salicilato de metilo, ácido (-)-jasmónico, jasmonato de metilo, (+)-estrigol, (+)-deoxistrigol, (+)-orobancol, (+)-sorgolactona, 4-oxo-4-(2-feniletil) amino ácido butírico; etefón, clormequat, cloruro de mepiquat, bencil adenina, ácido 5-aminolevulínico.

[0238]

Formulación

El fungicida agrícola y hortícola o el nematicida de la presente invención no están particularmente en formas de dosificación. Ejemplos de la forma de dosificación pueden incluir un polvo humectable, una emulsión, un polvo, un gránulo, un agente soluble en agua, una suspensión, un polvo humectable granular y una tableta. No existe una limitación particular sobre un método de preparación de una formulación, y se puede usar un método de preparación conocido dependiendo de la forma de dosificación.

A continuación se muestran varios ejemplos de formulación. Las formulaciones farmacéuticas que se muestran a continuación son meramente ejemplares y pueden modificarse sin desviarse del concepto de la presente invención. La presente invención no está limitada en modo alguno por los siguientes ejemplos de formulación. "Partes" representan "partes en peso" a menos que se indique lo contrario.

[0239]

Ejemplo de formulación 1: Polvo humectable

Se mezclaron de manera uniforme 40 partes del compuesto de dihidropirimidina de la presente invención, 53 partes de tierra de

diatomeas, 4 partes de un éster de ácido sulfúrico de un alcohol superior y 3 partes de un sulfonato de alquilnaftaleno y se pulverizan finamente para obtener un polvo humectable que contenía el 40 % del ingrediente activo.

Ejemplo de formulación 2: emulsión

Se mezclaron y disolvieron 30 partes del compuesto de dihidropirimidina de la presente invención, 33 partes de xileno, 30 partes de dimetilformamida y 7 partes de un éter de alquilalilo de polioxietileno para obtener una emulsión que contiene el 30 % del ingrediente activo.

Ejemplo de formulación 3: gránulo

Se mezclaron de manera uniforme y se pulverizaron finamente 5 partes del compuesto de dihidropirimidine de la presente invención, 40 partes de talco, 38 partes de arcilla, 10 partes de bentonita y 7 partes de un alquilsulfato de sodio, y luego se granularon con un diámetro de 0,5 a 1,0 mm para obtener un gránulo que contenía 5 % del ingrediente activo.

Ejemplo de formulación 4: gránulo

Se mezclaron y pulverizaron de manera uniforme 5 partes del compuesto de dihidropirimidina de la presente invención, 73 partes de arcilla, 20 partes de bentonita, 1 parte de dioctilsulfosuccinato de sodio y 1 parte de fosfato de potasio. Se le añadió agua y se mezcló a fondo, seguido de granulación y secado para obtener un gránulo que contenía un 5 % del ingrediente activo.

Ejemplo de formulación 5: suspensión

Se mezclaron 10 partes del compuesto de dihidropirimidina de la presente invención, 4 partes de un éter de alquilalilo de polioxietileno, 2 partes de una sal de sodio de ácido policarboxílico, 10 partes de glicerina, 0,2 partes de goma xantano y 73,8 partes de agua, y se sometieron a molienda en húmedo hasta que el tamaño de partícula se convirtió en 3 micras o menos para obtener una suspensión que contenía 10 % del ingrediente activo.

Ejemplo de formulación 6: polvo humectable granular

Se mezclaron uniformemente 40 partes del compuesto de

dihidropirimidina de la presente invención, 36 partes de arcilla, 10 partes de cloruro de potasio, 1 parte de alquilbencenosulfonato de sodio, 8 partes de lignosulfonato de sodio y 5 partes de un producto de condensación de formaldehído de alquilbencenosulfonato de sodio y se pulverizaron finamente seguido de la adición de una cantidad adecuada de agua y amasando para formar un producto similar a la arcilla. El producto similar a la arcilla se granuló y se secó para obtener un polvo humectable granular que contenía 40 % del ingrediente activo.

[0240]

Agente antifúngico médico/animal (vererinario)

El compuesto de dihidropirimidina de la presente invención puede usarse como un agente profiláctico o terapéutico destinado a controlar patógenos dañinos, en particular hongos, que infectan a seres humanos o animales.

El agente antifúngico para uso en medicina/animales de la presente invención contiene al menos uno seleccionado del compuesto (II) y una sal del mismo como ingrediente activo. La cantidad del compuesto (II) o una sal del mismo incluida en el agente antifúngico para uso en medicina de la presente invención no está particularmente limitada siempre que muestre el efecto antifúngico.

[0241]

Los "animales" en la presente significa vertebrados que incluyen animales de compañía, ganado y aves de corral, animales expuestos que se crían en zoológicos o acuarios, animales salvajes cautivos, otros animales de laboratorio/experimentales y similares.

[0242]

Ejemplos de los mismos incluyen los animales a continuación, pero los ejemplos específicos de los animales no se limitan solo a estos:

un mamífero tal como una oveja, una cabra, un cerdo, un caballo, una vaca, un búfalo, un burro, una mula, un camello, una llama, una alpaca, un jabalí, un reno, un venado, un visón, un elefante, un oso, un

canguro, un zorro, un perro, un gato, una ardilla, un conejo, un ratón, una rata, un conejillo de indias, un hámster, un mono y un hurón;

un pájaro tal como una paloma, un periquito, un loro, un gorrión de Java, un manón, un canario, un pollo, un pato, un pavo, un pato salvaje, un faisán, un pavo real, un avestruz, un cisne, un gorrión, una codorniz, un búho, un águila, un halcón y un cormorán japonés;

un reptil tal como un camaleón, una iguana, un lagarto, una serpiente, una tortuga, un caimán y un gecko;

un anfibio como una rana y un tritón; y

un pez como una carpa, un pez dorado, una medaka, un pez tropical, un jurel, un jurel joven, un dentón común, un pez limón, un salmón, una caballa, una lubina, un mero de dientes largos, un atún, un chicharros, una platija y pez globo.

[0243]

Como patógenos a los que se puede aplicar el agente antifúngico para uso en medicina/animales de la presente invención, se muestran a continuación ejemplos de hongos (moho). Los ejemplos específicos de los mismos no se limitan solo a ellos.

Por ejemplo, el género *Absidia* tal como *absidia corymbifera*; el género *Acremonium*; el género *Alternaria* tal como *Alternaria alternata*; el género *Aspergillus* tal como *Aspergillus flavus*, *Aspergillus fumigatus*, *Aspergillus nidulans*, *Aspergillus niger*, *Aspergillus parasiticus*, y *Aspergillus terreus*; el género *Bipolaris*; el género *Blastomyces* tal como *Blastomyces dermatitidis*; el género *Blumeria* tal como *Blumeria graminis*; el género *Candida* tal como *Candida albicans*, *Candida glabrata*, *Candida krusei*, *Candida parapsilosis*, y *Candida tropicalis*; el género *Cladosporium* tal como *Cladosporium cladosporoides* y *Cladosporium herbarium*; el género *Coccidioides* tal como *Coccidioides immitis* y *Coccidioides posadasii*; el género *Colletotrichium* tal como *Colletotrichium trifolii*; el género *Cryptococcus* tal como *Cryptococcus neoformans*; el género *Curvularia* tal como *Curvularia lunata*; el género *Encephalitozoon* tal como

Encephalitozoon cuniculi; el género *Epicoccum* tal como *Epicoccum nigrum*; el género *Epidermophyton* tal como *Epidermophyton floccosum*; el género *Exophiala*; el género *Exserohilum* tal como *Exserohilum rostratum*; el género *Fusarium* tal como *Fusarium graminarium*, *Fusarium solani*, y *Fusarium sporotrichoides*; el género *Fonsecaea* tal como *Fonsecaea monophora*; el género *Histoplasma* tal como *Histoplasma capsulatum*; el género *Leptosphaeria* tal como *Leptosphaeria nodorum*; el género *Malassezia* tal como *Malassezia globosa*; el género *Microsporum* tal como *Microsporum canis*; el género *Mycosphaerella* tal como *Mycosphaerella graminicola*; el género *Neurospora*; el género *Paecilomyces* tal como *Paecilomyces lilanicus* y *Paecilomyces varioti*; el género *Penicillium* tal como *Penicillium chrysogenum*; el género *Phytophthora* tal como *Phytophthora capsici* y *Phytophthora infestans*; el género *Plasmopara* tal como *Plasmopara viticola*; el género *Pneumocystis* tal como *Pneumocystis jirovecii*; el género *Pyricularia* tal como *Pyricularia oryzae*; el género *Pythium* tal como *Pythium ultimum*; el género *Puccinia* tal como *Puccinia coronata* y *Puccinia graminis*; el género *Rhizoctonia* tal como *Rhizoctonia solani*; el género *Rhizomucor*; el género *Scedosporium* tal como *Fusarium apiospermum* y *Scedosporium prolificans*; el género *Scopulariopsis* tal como *Scopulariopsis brevicaulis*; el género *Sporothrix* tal como *Sporothrix schenckii*; el género *Talaromyces* tal como *Talaromyces marneffei*; el género *Trichophyton* tal como *Trichophyton mentagrophytes*, *Trichophyton interdigitale*, *Trichophyton rubrum*, *Trichophyton tonsurans*, y *Trichophyton verrucosum*; el género *Trichosporon* tal como *Trichosporon asahii* y *Trichosporon beigelii*, y; el género *Ustilago*.

Entre estos, el agente antifúngico de la presente invención es adecuado para el género *Aspergillus*, el género *Trichophyton* o el género *Candida*, y particularmente adecuado para *Aspergillus fumigatus* o *Trichophyton tonsurans.*

[0244]

Como infecciones a las que se puede aplicar el agente antifúngico para uso en medicina/animales de la presente invención, a continuación se muestran ejemplos de micosis. Los ejemplos específicos de los mismos no se limitan solo a ellos.

[0245]

El agente antifúngico para uso en medicina/animales de la presente invención se puede aplicar a cualquiera de las infecciones micóticas sistémicas, infecciones micóticas superficiales y similares. Ejemplos específicos de infecciones micóticas pueden incluir aspergilosis (*Aspergillus*) tales como aspergilosis pulmonar y aspergilosis sistémica (que probablemente ocurra en pacientes inmunosuprimidos como receptores de médula ósea y pacientes con SIDA), candidiasis (*Candida*) tales como candidiasis sistémica, meningitis por Cryptococcus (*Cryptococcus*) mucormicosis rinocerebral, mucormicosis pulmonar, blastomicosis, histoplasmosis, coccidiomicosis, paracoccidiomicosis, lobomicosis, queratomicosis, esporotricosis, cromoblastomicosis, cromomicosis, feofomicosis, cigomicosis, criptococosis, esporotricosis diseminada, tinea (gusano del anillo), tinea capitis (Trichophytia capitis), tinea corporis (jock itch), tinea cruris (pudrición de la entrepierna), tinea pedis (pie de atleta), tinea unguium (tinea de uña), candidiasis cutánea, oral o vaginal, infección por Malassezia, candidiasis mucocutánea crónica, neumonía por Pneumocystis y Penicillium marneffei.

El agente antifúngico de la presente invención también se puede aplicar a enfermedades alérgicas causadas por hongos, tales como asma broncopulmonar alérgica (ABPA); asma, rinosinusitis, sinusitis o similares.

[0246]

El agente antifúngico para uso en medicina/animales de la presente invención puede comprender aditivos farmacéuticamente aceptables. Los aditivos no están particularmente limitados siempre que se utilicen en agentes médicos conocidos. Estos son naturalmente estériles y apirógenos. Los aditivos pueden seleccionarse adecuadamente según la

forma de dosificación y el método de administración del agente antifúngico.

[0247]

La forma de dosificación que se puede adoptar para el agente antifúngico para uso en medicina/animales de la presente invención no está particularmente limitada, y en sus ejemplos pueden incluir un agente sólido tal como una tableta, un polvo, una partícula, un gránulo, una cápsula, una pastilla (caramelo) y una bolita; un agente líquido tal como un jarabe, una emulsión, una suspensión, una solución, un agente de vertido y un agente de aplicación puntual; una preparación semisólida tal como una pomada y un gel; un agente gaseoso tal como aerosol y vapor; y una formulación de nanopartículas.

El agente antifúngico para uso en medicina de la presente invención puede administrarse mediante métodos conocidos. Ejemplos del método de administración pueden incluir infusión (inyección) subcutánea, intravenosa, intramuscular o intraesternal; inserción en el ano o la vagina, administración transdérmica tal como aplicación, pulverización o gota a la superficie de la piel; administración oral tal como ingestión por la boca y administración nasal por aspiración.

[0248]

En el caso de un agente sólido para administración oral, los ejemplos de aditivos que pueden usarse para el agente antifúngico para uso en medicamentos/animales de la presente invención pueden incluir un auxiliar de disolución tal como ciclodextrina o ciclodextrina modificada; un diluyente tal como lactosa, dextrosa, sacarosa, celulosa, almidón de maíz o almidón de patata; un lubricante tal como sílice, talco, ácido esteárico, estearato de magnesio o estearato de calcio y polietilenglicol; un agente aglutinante tal como almidón, goma arábiga, gelatina, metilcelulosa, carboximetilcelulosa o polivinilpirrolidona; un agente disgregante tal como almidón, ácido algínico, alginato o glicolato de almidón de sodio; una mezcla efervescente; un pigmento un edulcorante;

un humectante tal como lecitina, polisorbato y lauril sulfato; o una sustancia no tóxica y farmacológicamente inactiva comúnmente utilizada en formulaciones farmacéuticas. Estos aditivos pueden incluirse en el agente antifúngico para uso en medicina de la presente invención de maneras conocidas, por ejemplo, mediante procesos de mezcla, granulación, formación de tabletas, recubrimiento con azúcar o recubrimiento con película.

[0249]

En el caso de un agente líquido para administración oral, los ejemplos de aditivos que pueden usarse para el agente antifúngico para uso en medicamentos animales de la presente invención pueden incluir un auxiliar de disolución tal como ciclodextrina o ciclodextrina modificada, sacarosa, glicerina, manitol, sorbitol, goma natural, agar, alginato de sodio, pectina, metilcelulosa, carboximetilcelulosa o alcohol polivinílico.

[0250]

En el caso de un agente líquido para inyección intramuscular, los ejemplos de aditivos que pueden usarse para el agente antifúngico para uso en medicina/animales de la presente invención pueden incluir agua estéril, aceite de oliva, oleato de etilo, un glicol tal como propilenglicol, y un auxiliar de disolución tal como ciclodextrina o ciclodextrina modificada. Además, también se puede incluir una cantidad adecuada de hidrocloruro de lidocaína, según se requiera.

[0251]

En el caso de un agente líquido para inyección intravenosa, los ejemplos de aditivos que pueden usarse para el agente antifúngico para uso en medicamentos animales de la presente invención pueden incluir un portador tal como agua estéril; y un auxiliar de disolución tal como ciclodextrina o ciclodextrina modificada. Estos pueden incluirse también en forma de solución salina fisiológica isotónica esterilizada.

[0252]

El contenido del compuesto (II) o una sal del mismo contenido en el

agente antifúngico para uso en medicina/animales de la presente invención es preferiblemente 8 5% en peso o menos, y más preferiblemente 50 % en peso o menos basado en el peso de la agente antifúngico.

La dosis del agente antifúngico para uso en medicina/animales de la presente invención se puede seleccionar adecuadamente según el método de administración, el tipo de hongo que causó la infección, la edad, el peso corporal y los síntomas del paciente, y similares. Por ejemplo, en el caso de la administración oral o parenteral (inyección, infusión o similar) para un adulto, se puede administrar una dosis de 0,1 a 100 mg/kg de peso corporal una o varias veces al día.

El agente antifúngico para uso en medicina/animales de la presente invención también se puede usar en combinación con un agente distinto del compuesto (II).

[0253]

A continuación, se muestran los ejemplos de síntesis y la presente invención se describirá más concretamente. Sin embargo, la presente invención ninguna manera se encuentra limitada por los siguientes ejemplos de síntesis.

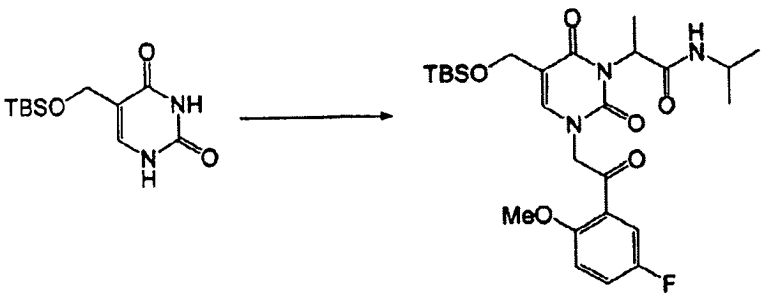
Ejemplo 1

Síntesis de 2-(3-(2-(2-cianoetoxi)-2-(5-fluoro-2-metoxifenil)etil)-5-((isopropoxiimino)metil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidina-1(2H)-il)-N-isopropilpropanamida (número de compuesto A-14)

Paso 1

Síntesis de 2-(5-(((terc-butildimetilsilil)oxi)metil)-3-(2-(5-fluoro-2-metoxifenil)-2-oxoetil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidina-1(2H)-il)-N-isopropilpropanamida

[0254]



[0255]

Se disolvió 5-(((terc-butildimetilsilil)oxi)metil)pirimidina-2,4(1H,3H)-diona (1,50g) en N,N-dimetilformamida (60 ml), se añadieron carbonato de potasio (0,81 g) y 2-bromo-5'-fluoro-2'-metoxiacetofenona (1,45 g) enfriando con hielo, y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas. Se añadió agua a la solución de reacción y se filtró el sólido resultante.

El sólido obtenido se disolvió en N,N-dimetilformamida (60 ml), se añadieron carbonato de potasio (0,98 g) y 2-bromo-N-isopropilpropanamida (1,40 g) y la mezcla resultante se agitó a 45°C durante la noche.

Se añadió agua a la solución de reacción. La solución se extrajo con acetato de etilo, se lavó con agua y salmuera saturada y luego se secó con sulfato de sodio anhidro. El disolvente se eliminó mediante destilación al vacío y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo) para obtener 2,13 g del compuesto objetivo. Rendimiento: 68 %

La RMN de ^{1}H del producto objetivo obtenido se muestra a continuación.

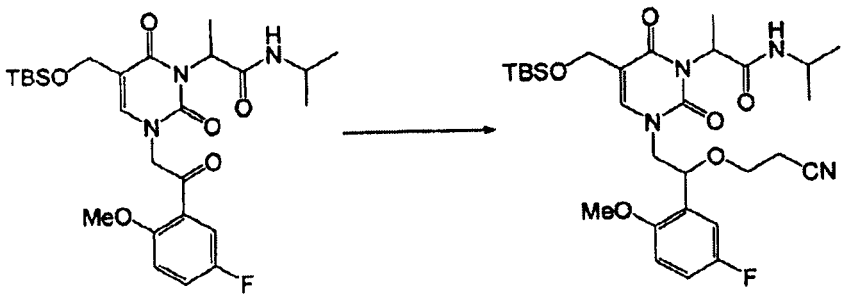
RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,63-6,97 (3H, m), 7,08 (1H, s), 5,47-5,01 (4H, m), 4,54 (2H,s), 4,10-4,03 (1H, m), 3,98 (3H, s), 1,61(3H, d), 1,12 (6H, d), 0,91(9H, s), 0,12(6H, s)

Paso 2

Síntesis de 2-(5-(((terc-butildimetilsilil)oxi)metil)-3-(2-(2-cianoetoxi)-2-(5-fluoro-2-metoxifenil)etil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)-N-

isopropilpropanamida

[0256]



[0257]

Se disolvió 2-(5-(((terc-butildimetilsilil)oxi)metil)-3-(2-(5-fluoro-2-metoxifenil)-2-oxoetil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)-N-isopropilpropanamida (0,15 g) en metanol (1,5 ml) y tetrahidrofurano (1,5 ml), se añadió borohidruro de sodio (12 mg) enfriando con hielo y la mezcla resultante se agitó durante una hora.

Se añadió una solución acuosa saturada de cloruro de amonio a la solución de reacción. La solución se extrajo con acetato de etilo, se lavó con agua y salmuera saturada y luego se secó con sulfato de sodio anhidro. El disolvente se eliminó mediante destilación al vacío, el residuo obtenido se disolvió en tetrahidrofurano (1,5 ml), se añadieron acrilonitrilo (0,2 g) y una solución acuosa de hidróxido de potasio al 40 % (0,1 ml) y la solución se agitó a temperatura ambiente durante la noche.

Se añadió agua a la solución de reacción. La solución se extrajo con cloroformo y luego se secó con sulfato de sodio anhidro. El disolvente se eliminó mediante destilación al vacío y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo) para obtener 0,08 g del compuesto objetivo. Rendimiento: 48%

La RMN de ^{1}H del producto objetivo obtenido se muestra a continuación.

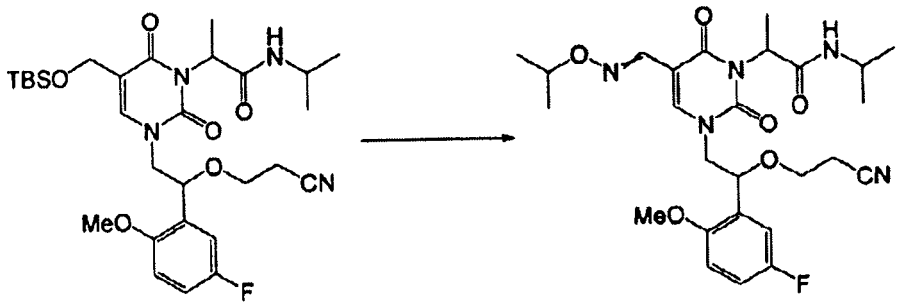
RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,19-6,82 (4H, m), 5,82-5,07 (3H, m), 4,49 (2H, s), 4,20-3,41 (5H, m), 3,82 (3H, s), 2,53 (2H, t), 1,55 (3 H, d), 1,12 (6

H, d), 0,91 (9 H, s), 0,12 (6 H, s)

Paso 3

Síntesis de 2-(3-(2-(2-cianoetoxi)-2-(5-fluoro-2-metoxifenil)etil)-5-((isopropoxiimino)metil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidina-1(2H)-il)-N-isopropilpropanamida

[0258]



[0259]

Se disolvió 2-(5-(((terc-butildimetilsilil)oxi)metil)-3-(2-(2-cianoetoxi)-2-(5-fluoro-2-metoxifenil)etil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)-N-isopropilpropanamida (2,00 g) en tetrahidrofurano (8 ml) y agua (8 ml), se añadió ácido acético (20 ml) y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 7 horas.

Se añadió agua a la solución de reacción. La solución se extrajo con acetato de etilo, se lavó con una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato de sodio y salmuera saturada y luego se secó con sulfato de sodio anhidro. El disolvente se eliminó mediante destilación al vacío, el residuo obtenido se disolvió en cloroformo (80 ml), se añadió dióxido de manganeso (2,00 g) y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas.

La solución de reacción se filtró y el residuo obtenido por concentración del licor madre se disolvió en cloroformo (20 ml) y etanol (20 ml). A temperatura ambiente, se añadieron piridina (0,40 g) y clorhidrato de isopropoxiamina (0,6 g) y la mezcla resultante se agitó durante 30 minutos.

La solución de reacción se concentró a presión reducida y el

residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo) para obtener 1,26 g del compuesto objetivo (E:Z = 1:1). Rendimiento: 70%

La RMN de ^{1}H del producto objetivo obtenido se muestra a continuación.

RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,84-7,51(2H, m) 7,14-6,80(3H, m), 5,85-5,07 (3H, m), 4,40-3,41 (6H, m), 3,82 (3H, s), 2,65-2,51(2H, m), 1,55(3H, d), 1,29-1,13(12H, m)

[0260]

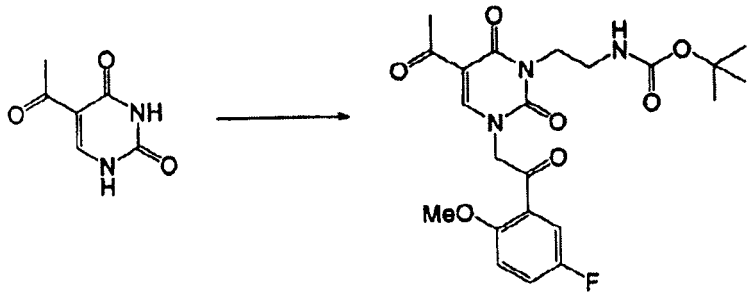
Ejemplo 2

Síntesis de N-(2-(3-(2-(2-cianoetoxi)-2-(5-fluoro-2-metoxifenil)etil)-5-(1-(etoxiimino)etil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)etil)isobutiramida (compuesto número A-38)

Paso 1

Síntesis de (2-(5-acetil-3-(2-(5-fluoro-2-metoxifenil)-2-oxoetil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)etil)carbamato de terc-butilo

[0261]



[0262]

Se disolvió 5-acetiluracilo (2,50 g) en N,N-dimetilformamida (80 ml), se añadieron carbonato de potasio (2,20 g) y 2-bromo-5'-fluoro-2'-metoxiacetofenona (4,00 g) enfriando con hielo, y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas. Se añadió agua a la solución de reacción y se filtró el sólido resultante.

El sólido obtenido se disolvió en N,N-dimetilformamida (120 ml), se añadieron carbonato de potasio (2,40 g) y n-(2-bromoetil)carbamato de

terc-butilo (4,80 g) y la mezcla resultante se agitó a 80°C durante 5 horas.

Se añadió agua a la solución de reacción. La solución se extrajo con acetato de etilo, se lavó con agua y salmuera saturada y luego se secó con sulfato de sodio anhidro. El disolvente se eliminó mediante destilación al vacío y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: cloroformo/acetato de etilo) para obtener 4,60 g del compuesto objetivo. Rendimiento: 61%

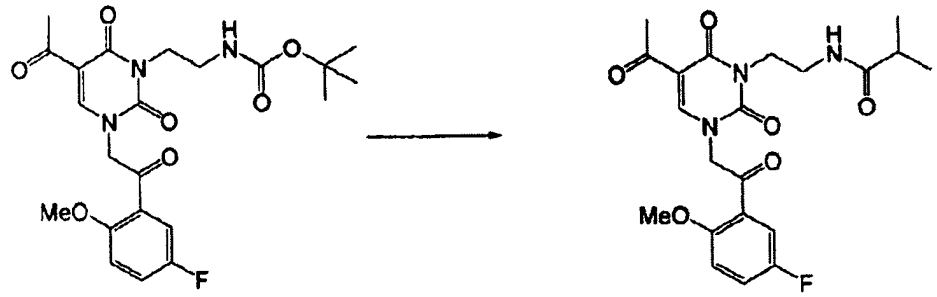
La RMN de ^{1}H del producto objetivo obtenido se muestra a continuación.

RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,09 (1H, s), 7,64-6,99 (3H, m), 5,21 (2H, s), 4,87 (1H, m), 4,17-3,42 (4H, m), 4,00 (3H, s), 2,65(3H, s), 1,40 (9H, s)

Paso 2

Síntesis de N-(2-(5-acetil-3-(2-(5-fluoro-2-metoxifenil)-2-oxoetil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)etil)isobutiramida

[0263]



[0264]

Se disolvió (2-(5-acetil-3-(2-(5-fluoro-2-metoxifenil)-2-oxoetil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)etil)carbamato de terc-butilo (1,60 g) en 1,4-dioxano (50 ml), se añadió una solución 4 N de cloruro de hidrógeno/1,4-dioxano (15 ml) y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 8 horas.

La solución de reacción se concentró, el residuo obtenido se disolvió en cloruro de metileno (50 ml), se añadieron trietilamina (1,5 ml) y cloruro de isobutirilo (0,7 ml) y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas.

La solución de reacción se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: cloroformo/acetato de etilo) para obtener 0,95 g del compuesto objetivo. Rendimiento: 64%

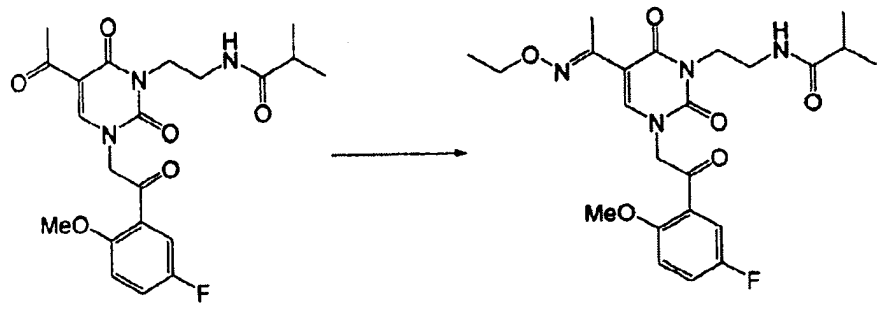
La RMN de ^{1}H del producto objetivo obtenido se muestra a continuación.

RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,10 (1H, s), 7,64-7,00 (3H, m), 6,00 (1H, m), 5,21(2H, s), 4,22-3,57 (4H, m), 4,00 (3H, s), 2,64(3H, s), 2,34-2,27(1H, m), 1,10 (6H, d)

Paso 3

Síntesis de N-(2-(5-(1-(etoxiimino)etil)-3-(2-(5-fluoro-2-metoxifenil)-2-oxoetil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidina-1(2H)-il)etil)isobutiramida (número de compuesto A-36)

[0265]



[0266]

Se disolvió N-(2-(5-acetil-3-(2-(5-fluoro-2-metoxifenil)-2-oxoetil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)etilo)isobutiramida (0,50 g) en cloroformo (8 ml) y se añadieron etanol (8 ml), piridina (0,10 g) e hidrocloruro de etoxiamina (0,12 g) a temperatura ambiente y la mezcla resultante se agitó durante 3 horas.

La solución de reacción se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo) para obtener 0,45 g del compuesto objetivo. Rendimiento: 82%

La RMN de ^{1}H del producto objetivo obtenido se muestra a

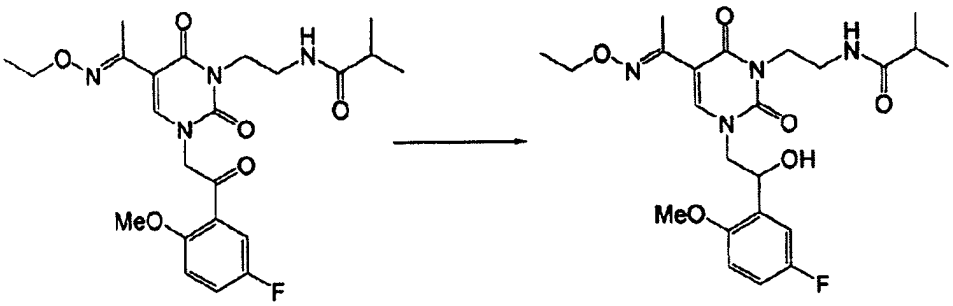
continuación.

RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,64-7,00 (3H, m), 7,33(1H, s), 6,15 (1H, m),5,13 (2H, s), 4,20-3,53 (6H, m), 3,99 (3H, s), 2,34-2,27(1H, m), 2,19(3H, s), 1,27(3H, t), 1,10 (6H, d)

Paso 4

Síntesis de N-(2-(5-(1-(etoxiimino)etil)-3-(2-(5-fluoro-2-metoxifenil)-2-hidroxietil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidina-1(2H)-il)etil)isobutiramida (número de compuesto A-37)

[0267]



[0268]

Se disolvió N-(2-(5-(1-(etoxiimino)etil)-3-(2-(5-fluoro-2-metoxifenil)-2-oxoetil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)etil)isobutiramida (0,25 g) en metanol (4 ml) y tetrahidrofurano (4 ml), se añadió borohidruro de sodio (20 mg) enfriando con hielo y la mezcla resultante se agitó durante 30 minutos.

Se añadió una solución acuosa saturada de cloruro de amonio a la solución de reacción. La solución se extrajo con acetato de etilo, se lavó con agua y salmuera saturada y luego se secó con sulfato de sodio anhidro. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo) para obtener 0,25 g del compuesto objetivo. Rendimiento: 99%

La RMN de ^{1}H del producto objetivo obtenido se muestra a continuación.

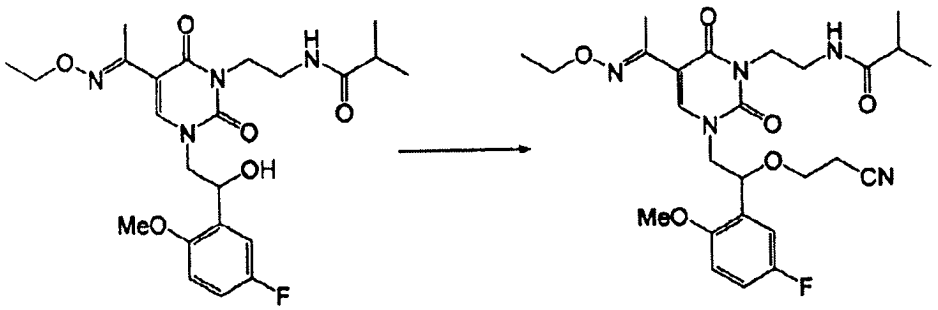
RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,40(1H, s),7,35-6,80 (3H, m), 5,90-5,48 (2H, m), 4,44-3,24 (9H, m), 3,85 (3H, s), 2,34-2,27(1H, m), 2,14(3H, s),

1,27(3H, t), 1,10 (6H, d)

Paso 5

Síntesis de N-(2-(3-(2-(2-cianoetoxi)-2-(5-fluoro-2-metoxifenil)etil)-5-(1-(etoxiimino)etil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)etil)isobutiramida

[0269]



[0270]

Se disolvió N-(2-(5-(1-(etoxiimino)etil)-3-(2-(5-fluoro-2-metoxifenil)-2-hidroxietil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)etil)isobutiramida(0,23 g) en tetrahidrofurano (4 ml), se añadieron acrilonitrilo y (0,27 g) y una solución acuosa de hidróxido de potasio al 40 % (0,3 ml) y la mezcla resultante se agitó temperatura ambiente durante la noche.

Se añadió agua a la solución de reacción. La solución se extrajo con cloroformo y luego se secó con sulfato de sodio anhidro. El disolvente se eliminó mediante destilación al vacío y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo) para obtener 0,12 g del compuesto objetivo. Rendimiento: 47%

La RMN de ^{1}H del producto objetivo obtenido se muestra a continuación.

RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,46(1H, s),7,15-6,83 (3H, m), 6,28-5,18 (2H, m), 4,32-3,48 (10H, m), 3,84 (3H, s), 2,64(2H, t), 2,34-2,27(1H, m), 2,16(3H, s), 1,30(3H, t), 1,10 (6H, d)

[0271]

Ejemplo 3

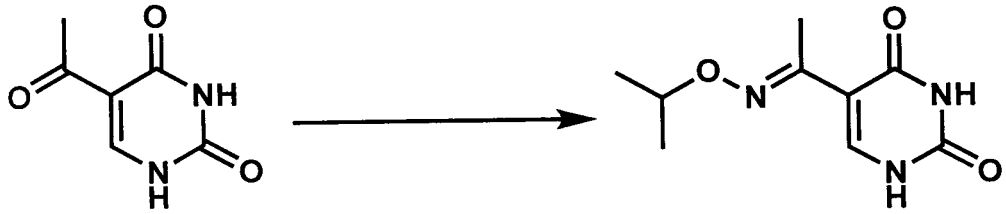
Síntesis de N-((2S)-1-(3-(2-(5-fluoro-2-metoxifenil)-2-hidroxietil)-5-

((E)-1-(isopropoxiimino)etil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)propan-2-il)isobutiramida (números de compuesto A-74 y A-75)

Paso 1

Síntesis de (E)-5-(1-(isopropoxiimino)etil)pirimidina-2,4(1H,3H)-diona

[0272]



[0273]

Se disolvió 5-acetilpirimidin-2,4(1H,3H)-diona (15,4 g) en etanol (200 ml) y cloroformo (100 ml), se añadió hidrocloruro de 2-(aminooxi)propano (14,0 g) y el resultado la mezcla se agitó a 45°C durante 3 horas.

Se añadió agua a la solución de reacción. La solución se extrajo con cloruro de metileno y luego se secó con sulfato de sodio anhidro. El disolvente se eliminó mediante destilación al vacío para obtener 20,6 g del compuesto objetivo. Rendimiento: 98%

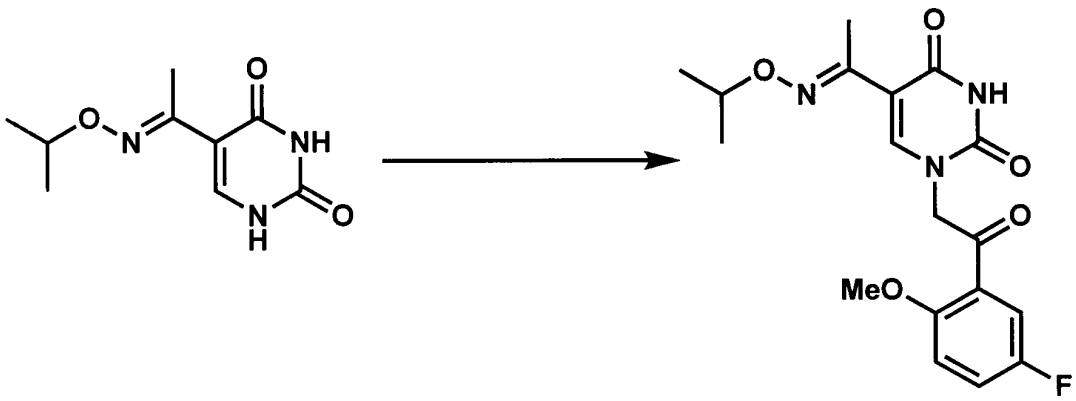
La RMN de ^{1}H del producto objetivo obtenido se muestra a continuación.

RMN de ^{1}H (DMSO-d_6) δ: 11,26 (1H, s), 11,11 (1H, d, J = 5,9 Hz), 7,42 (1H, d, J = 5,9 Hz), 4,31-4,25 (1H, m), 1,99 (3H, s), 1,20 (6H, d, J= 6,3 Hz).

Paso 2

Síntesis de (E)-1-(2-(5-fluoro-2-metoxifenil)-2-oxoetil)-5-(1-(isopropoxiimino)etil)pirimidina-2,4(1H,3H)-diona(intermedio de producción 7)

[0274]



[0275]

Se disolvió (E)-5-(1-(isopropoxiimino)etil)pirimidin-2,4(1H,3H)-diona (2,11 g) en N,N-dimetilformamida (30 ml), se añadieron carbonato de potasio (1,50 g) y 2-bromo-5'-fluoro-2'-metoxiacetofenona (2,55 g) y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas. Se añadió agua a la solución de reacción y se filtró el sólido resultante para obtener 3,39 g del producto objetivo. Rendimiento: 90%

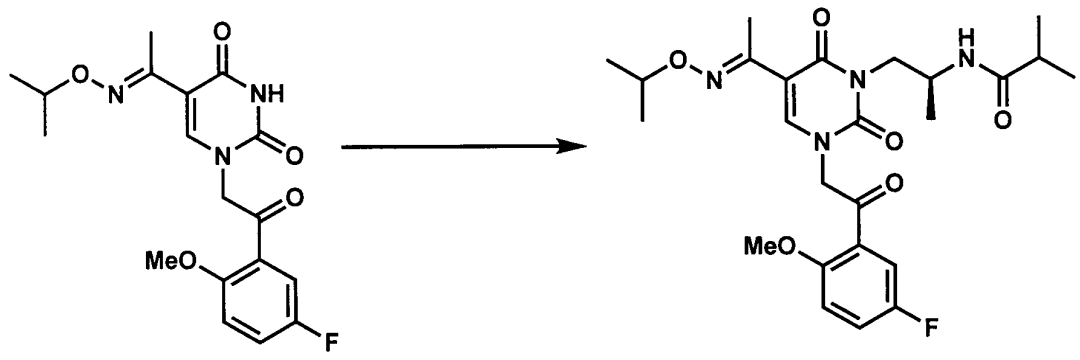
La RMN de ^{1}H del producto objetivo obtenido se muestra a continuación.

RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,23 (1H, s), 7,67-6,98(3H, m), 7,34(1H, s), 5,13(2H, s), 4,35-4,32 (1H, m), 3,98(3H, s), 2,19 (3H, s), 1,25 (6H, d, J = 6,3 Hz).

Paso 3

Síntesis de (S,E)-N-(1-(3-(2-(5-fluoro-2-metoxifenil)-2-oxoetil)-5-(1-(isopropoxiimino)etil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)propan-2-il)isobutiramida (número de compuesto C-221)

[0276]



[0277]

Se disolvió (E)-1-(2-(5-fluoro-2-metoxifenil)-2-oxoetil)-5-(1-(isopropoxiimino)etil)pirimidina-2,4(1H,3H)-diona (0,56g) en tetrahidrofurano (7 ml), se añadieron (S)-(1-hidroxipropan-2-il)carbamato de terc-butilo (0,38g),trifenilfosfina (0,58g)y bis(2-metoxietil)azodicarboxilato (0,52 g), y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas.

La solución de reacción se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo), el producto obtenido se disolvió en 1,4-dioxano (7 ml), se añadió una solución de 4 N de cloruro de hidrógeno/1,4-dioxano (7 ml), y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 4 horas. La solución de reacción se concentró, el residuo obtenido se disolvió en cloruro de metileno (7 ml), se añadieron trietilamina (3 ml) y cloruro de isobutanoílo (0,1 ml) bajo enfriamiento con hielo y la mezcla resultante se agitó durante 30 minutos. La solución de reacción se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: cloroformo/acetato de etilo) para obtener 0,45 g del compuesto objetivo. Rendimiento: 60%

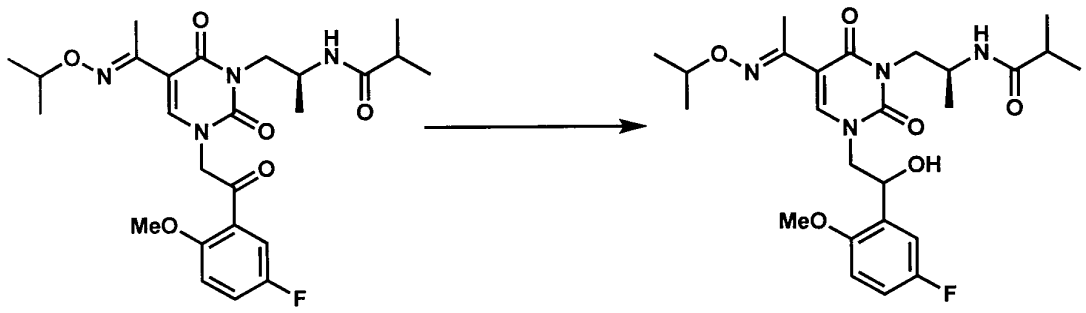
La RMN de ^{1}H del producto objetivo obtenido se muestra a continuación.

RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,62-6,99 (3H, m), 7,30(1H, s), 6,08-2,20(8H, m), 3,98 (3H, s), 2,15(3H, s), 1,25-1,03 (15H, m)

Paso 4

Síntesis de N-((2S)-1-(3-(2-(5-fluoro-2-metoxifenil)-2-hidroxietil)-5-((E)-1-(isopropoxiimino)etil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)propan-2-il)isobutiramida (números de compuesto A-74 y A-75)

[0278]



[0279]

Se disolvió (S,E)-N-(1-(3-(2-(5-Fluoro-2-metoxifenil)-2-oxoetil)-5-(1-(isopropoxiimino)etil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)propan-2-il)isobutiramida (0,25 g) en metanol (2 ml) y tetrahidrofurano (2 ml), se añadió borohidruro de sodio (18 mg) enfriando con hielo, y la mezcla resultante se agitó durante 20 minutos.

Se añadió una solución acuosa saturada de cloruro de amonio a la solución de reacción. La solución se extrajo con acetato de etilo, se lavó con agua y salmuera saturada y luego se secó con sulfato de sodio anhidro. El disolvente se eliminó mediante destilación al vacío y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo) para obtener los compuestos objetivo A-74 (0,11 g) y A-75 (0,11 g). Rendimiento: 44 % cada uno

La RMN de ^{1}H de los productos objetivos obtenidos se muestra a continuación.

Número de compuesto A-75: RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,38(1H, s),7,36-6,79 (3H, m), 5,64-4,22 (7H, m), 3,84 (3H, s), 3,80-3,11(2H, m), 2,25-2,16(1H, m), 2,12(3H, s), 1,24-1,02(15H, m)

Número de compuesto A-74: RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,42(1H, s),7,39-6,79 (3H, m), 5,72-2,16 (10H, m), 3,84 (3H, s), 2,14(3H, s), 1,27-1,02(15H, m)

[0280]

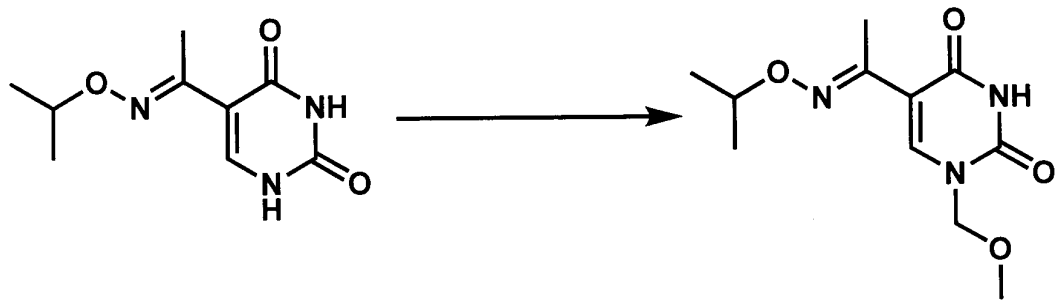
Ejemplo 4

Síntesis de N-((2S)-1-(3-(2-hidroxi-2-(2-(trifluorometoxi)fenil)etil)-5-((E)-1-(isopropoxiimino)etil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)propan-2-il)isobutiramida (números de compuesto C-193 y C-194)

Paso 1

Síntesis de (E)-5-(1-(isopropoxiimino)etil)-1-(metoximetil)pirimidin-2,4(1H,3H)-diona

[0281]



[0282]

Se disolvió (E)-5-(1-(isopropoxiimino)etil)pirimidin-2,4(1H,3H)-diona(2,50 g) en cloruro de metileno (140 ml), se añadió N,O-bis(trimetilsilil)acetamida (10 ml) y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante una hora. Luego, se añadió clorometilmetiléter (1,3 ml) y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante la noche.

La solución de reacción se purificó mediante cromatografía en gel de sílice (eluyente: hexano - acetato de etilo) para obtener 3,00 g del producto objetivo. Rendimiento: 99%

La RMN de ^{1}H del producto objetivo obtenido se muestra a continuación.

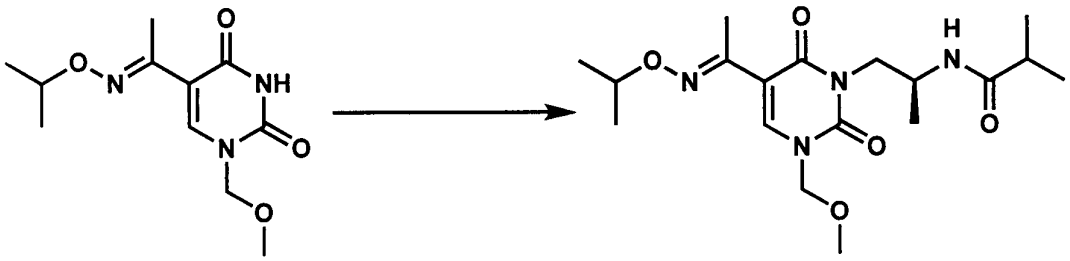
RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,32 (1H, s), 7,53 (1H, s), 5,15 (2H, s), 4,40-4,34 (1H, m), 3,44 (3H, s), 2,16 (3H, s), 1,27 (6H, d, J = 15,2 Hz).

Paso 2

Síntesis de (S,E)-N-(1-(5-(1-(isopropoxiimino)etil)-3-(metoximetil)-

2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)propan-2-il)isobutiramida (intermedio de producción 10)

[0283]



[0284]

Se disolvió (E)-5-(1-(isopropoxiimino)etil)-1-(metoximetil)pirimidina-2,4(1H,3H)-diona (2,50 g) en tetrahidrofurano (25 ml), se añadieron (S)-(1-hidroxipropan-2-il)carbamato de terc-butilo (2,50 g), trifenilfosfina (3,80 g) y bis(2-metoxietil)azodicarboxilato (3,40 g) y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 7 horas.

La solución de reacción se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo), el producto obtenido se disolvió en 1,4-dioxano (20 ml), se añadió una solución de 4 N de cloruro de hidrógeno/1,4-dioxano (12 ml), y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas. La solución de reacción se concentró, el residuo obtenido se disolvió en cloruro de metileno (40 ml), se añadieron trietilamina (3 ml) y cloruro de isobutanoílo (1,3 ml) bajo enfriamiento con hielo y la mezcla resultante se agitó durante 30 minutos. La solución de reacción se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: cloroformo/acetato de etilo) para obtener 2,90 g del compuesto objetivo. Rendimiento: 77%

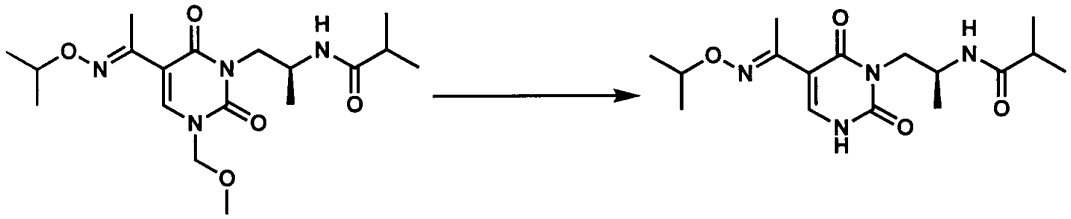
La RMN de ^{1}H del producto objetivo obtenido se muestra a continuación.

RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,49 (1H, s), 5,93 (1H, d, J = 8,2 Hz), 5,19-5,13 (2H, m), 4,42-4,32 (2H, m), 4,15-3,87 (2H, m), 3,43 (3H, s), 2,30-2,18 (1H, m), 2,14 (3H, s), 1,37-0,93 (15H, m).

Paso 3

Síntesis de (S,E)-N-(1-(5-(1-(isopropoxiimino)etil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)propan-2-il)isobutiramida (intermedio de producción 9)

[0285]



[0286]

Se disolvió (S,E)-N-(1-(5-(1-(isopropoxiimino)etil)-3-(metoximetil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)propan-2-il)isobutiramida (0,50 g) en cloruro de metileno (15 ml), enfriando con hielo, se añadió una solución de tribromuro de boro al 17 % en cloruro de metileno (1,5 ml) y la mezcla resultante se agitó durante la noche. Se añadió una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato de sodio a la solución de reacción. La solución se extrajo con cloruro de metileno y luego se secó con sulfato de sodio anhidro.

El disolvente se eliminó mediante destilación al vacío y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en gel de sílice (eluyente: hexano - acetato de etilo) para obtener 0,32 g del producto objetivo. Rendimiento: 72%

La RMN de ^{1}H del producto objetivo obtenido se muestra a continuación.

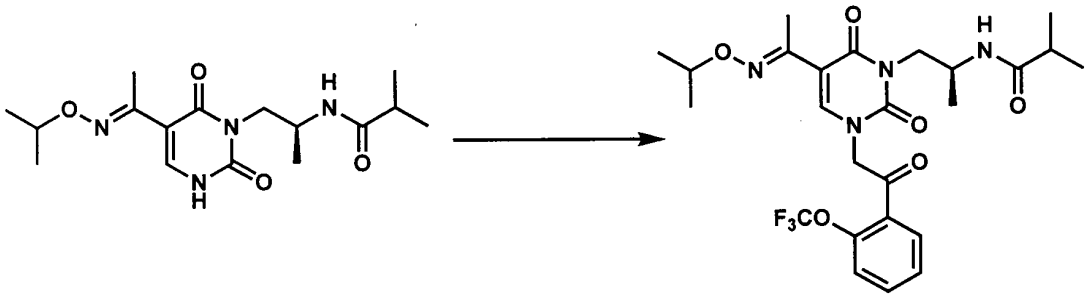
RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 9,33 (1H, d, J = 6,3 Hz), 7,42 (1H, d, J= 6,3 Hz), 5,94 (1H, d, J = 8,2 Hz), 4,48-3,84 (4H, m), 2,25-2,21 (1H, m), 2,12 (3H, s), 1,26-1,01 (15H, m).

Paso 4

Síntesis de (S,E)-N-(1-(5-(1-(isopropoxiimino)etil)-2,6-dioxo-3-(2-oxo-2-(2-(trifluorometoxi)fenil)etil)-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)propan-2-

il)isobutiramida (número de compuesto C-195)

[0287]



[0288]

Se disolvió (S,E)-N-(1-(5-(1-(isopropoxiimino)etil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)propan-2-il)isobutiramida (0,20 g) en N,N-dimetilformamida (3 ml), se añadieron 2-bromo-1-(2-(trifluorometoxi)fenil)etan-1-ona (0,25 g) y carbonato de potasio (0,10 g) enfriando en hielo y la mezcla resultante se agitó durante la noche.

Se añadió agua a la solución de reacción. La solución se extrajo con acetato de etilo y luego se secó con sulfato de sodio anhidro. El disolvente se eliminó mediante destilación al vacío y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en gel de sílice (eluyente: hexano - acetato de etilo) para obtener 0,23 g del producto objetivo. Rendimiento: 72%

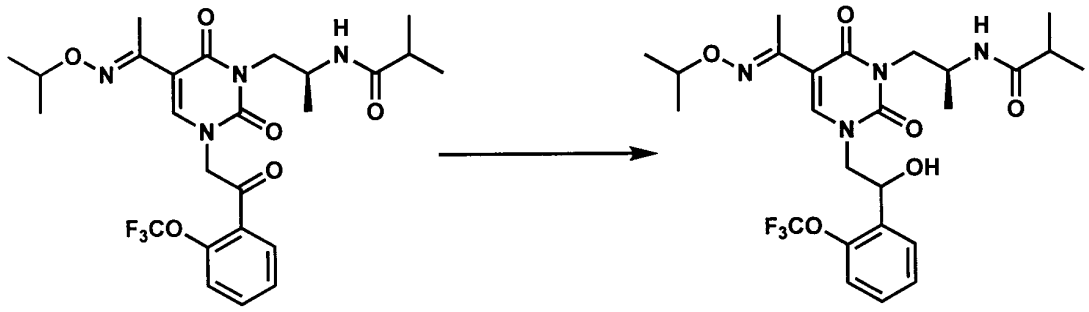
La RMN de ^{1}H del producto objetivo obtenido se muestra a continuación.

RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,98-7,36 (4H, m), 7,33 (1H, s), 6,07-3,90 (7H, m), 2,28-2,21 (1H, m), 2,17 (3H, s), 1,26-1,05 (15H, m).

Paso 5

Síntesis de N-((2S)-1-(3-(2-hidroxi-2-(2-(trifluorometoxi)fenil)etil)-5-((E)-1-(isopropoxiimino)etil)-2,6-dioxo-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)propan-2-il)isobutiramida (números de compuesto C-193 y C-194)

[0289]



[0290]

Se disolvió (S,E)-N-(1-(5-(1-(isopropoxiimino)etil)-2,6-dioxo-3-(2-oxo-2-(2-(trifluorometoxi)fenil)etil)-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)propan-2-il)isobutiramida (0,19 g) en metanol (2 ml) y tetrahidrofurano (2 ml), se añadió borohidruro de sodio (15 mg) enfriando con hielo y la mezcla resultante se agitó durante 40 minutos. Se añadió una solución acuosa saturada de cloruro de amonio a la solución de reacción. La solución se extrajo con acetato de etilo, se lavó con agua y salmuera saturada y luego se secó con sulfato de sodio anhidro. El disolvente se eliminó mediante destilación al vacío y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo) para obtener los compuestos objetivo C-193 (0,90 g) y C-194 (0,90 g). Rendimiento: 47% cada uno

La RMN de ^{1}H de los productos objetivos obtenidos se muestra a continuación.

Número de compuesto C-194: RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,76-7,27 (4H, m), 7,41 (1H, s), 5,75-5,43 (3H, m), 4,77-4,24 (4H, m), 3,81-3,13 (2H, m), 2,21-2,18 (1H, m), 2,12 (3H, s), 1,28-1,00 (15H, m).

Número de compuesto C-193: RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,84-7,35 (4H, m), 7,42 (1H, s), 5,64-3,74 (9H, m), 2,25-2,18 (1H, m), 2,14 (3H, s), 1,28-1,01 (15H, m).

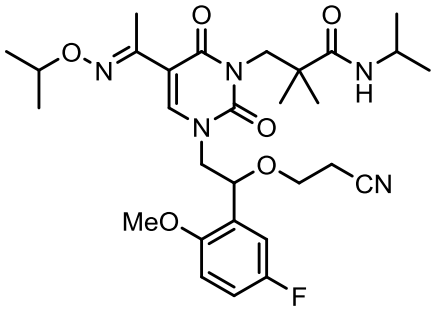
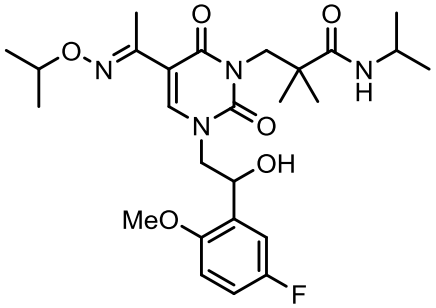
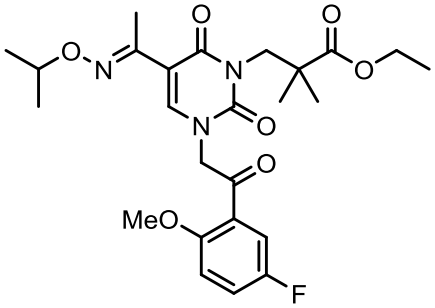
[0291]

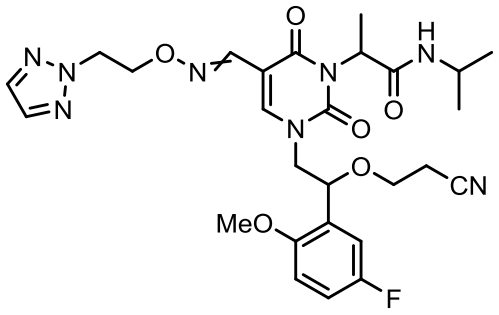
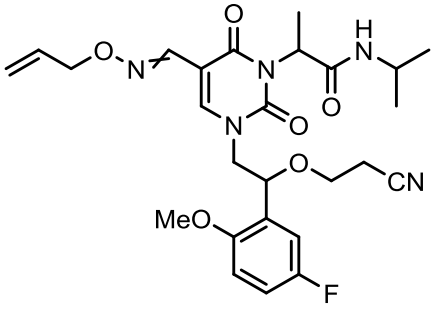
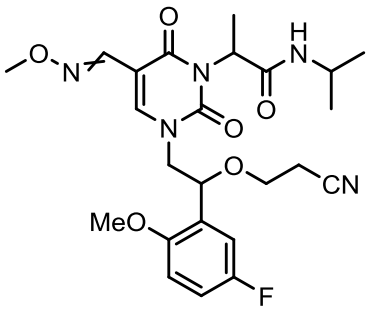
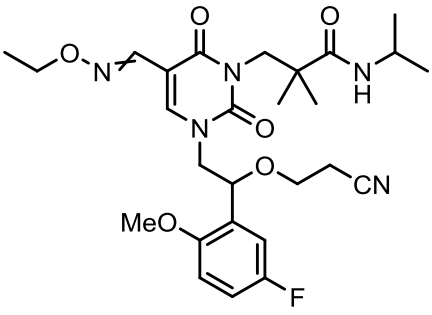
Algunos de los compuestos de la presente invención producidos de la misma manera que en los Ejemplos descritos anteriormente se muestran en la Tabla 2. En la tabla, el punto de fusión (p.f.) también se

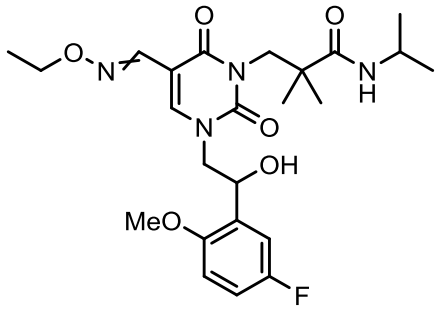
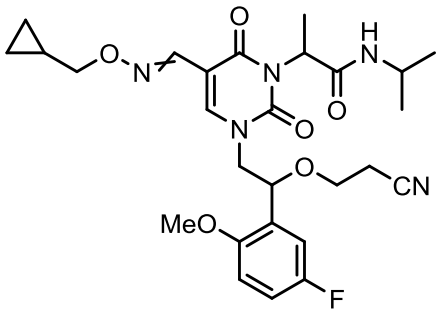
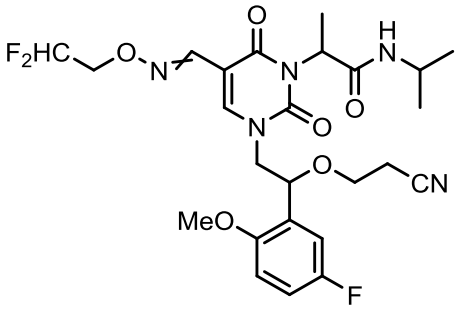
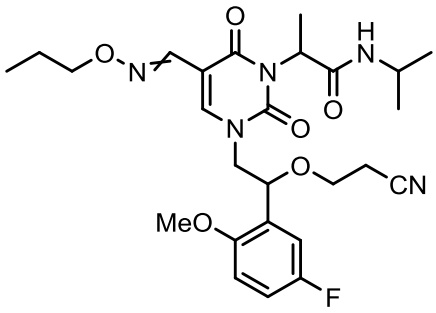
muestra como propiedades físicas de cada compuesto.

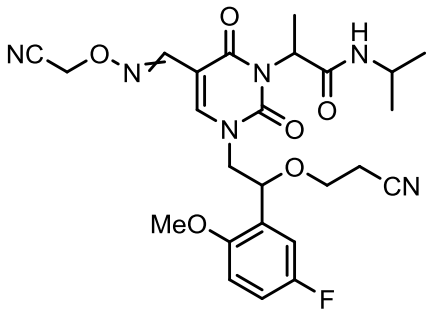
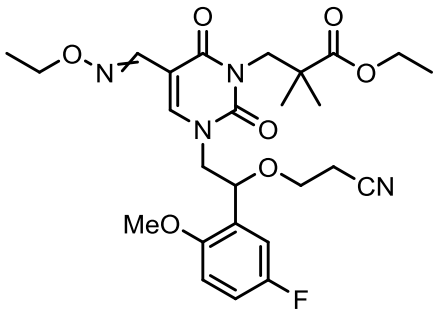
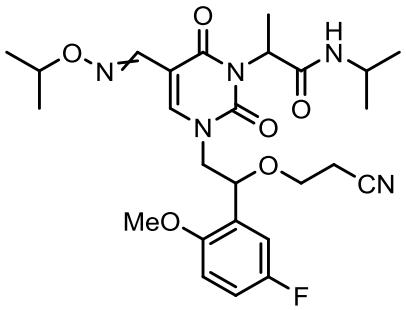
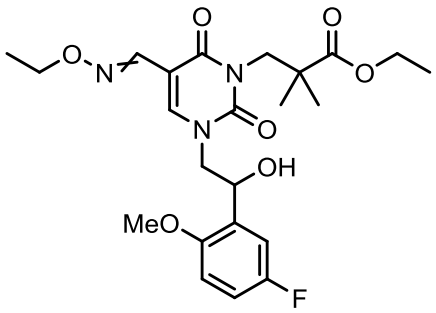
[0292]

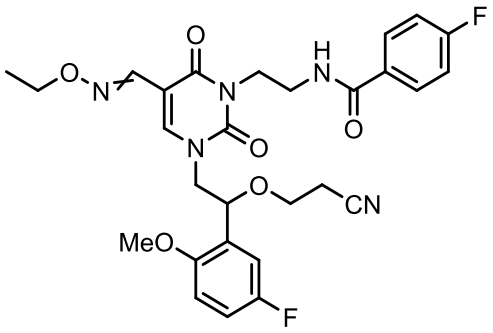
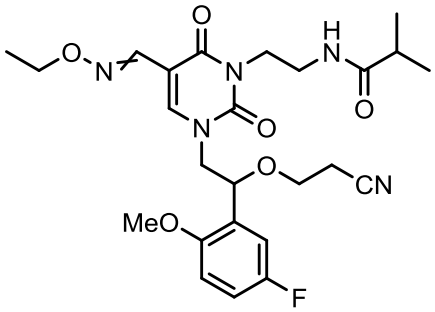
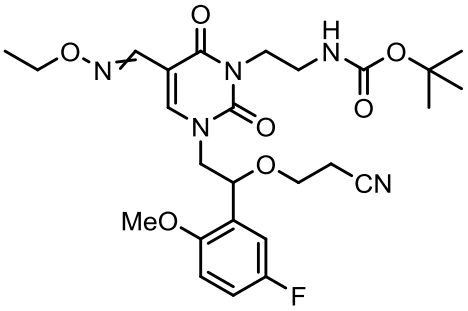
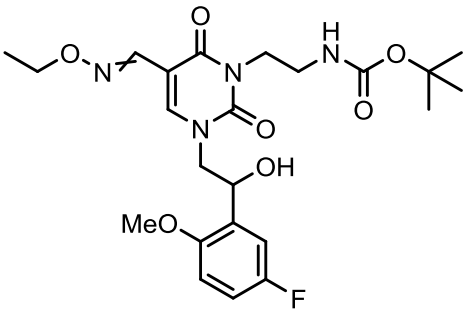
Tabla 2

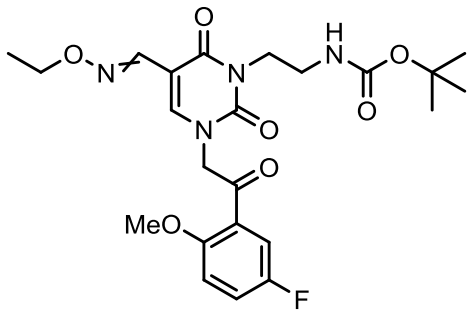
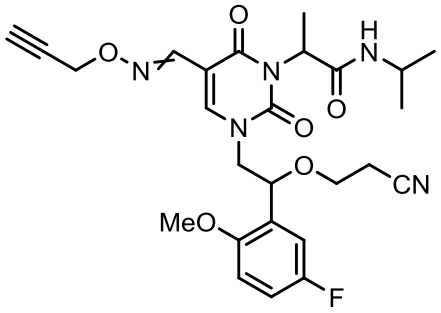
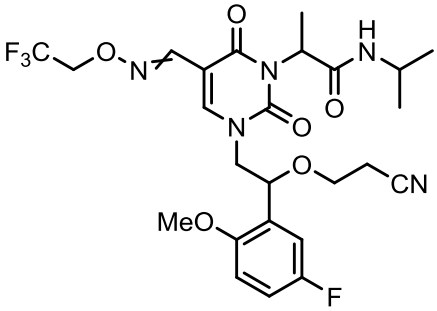
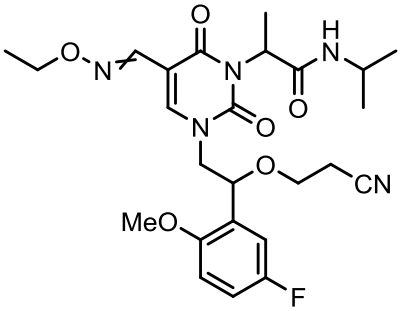
Número de compuesto	Fórmula estructural	Propiedades físicas
A-1		p.f. 151-152°C
A-2		p.f. 82-83°C
A-3		aceite viscoso

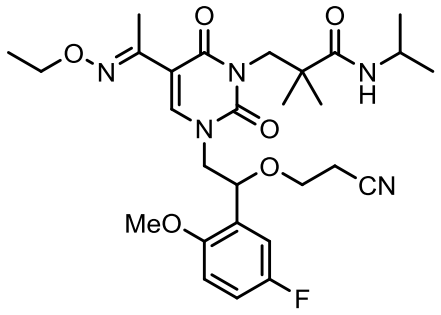
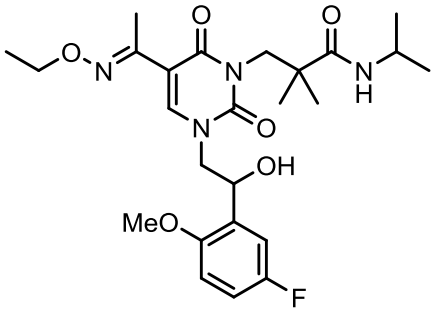
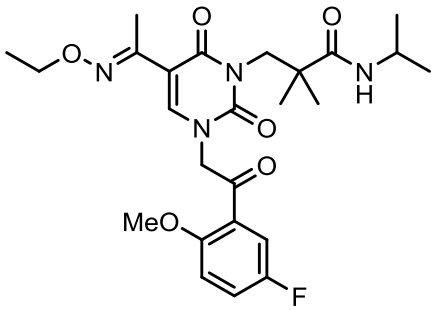
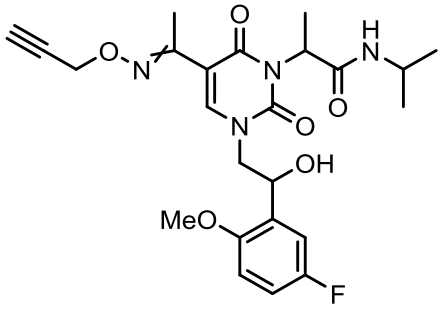
A-4		aceite viscoso
A-5		aceite viscoso
A-6		aceite viscoso
A-7		aceite viscoso

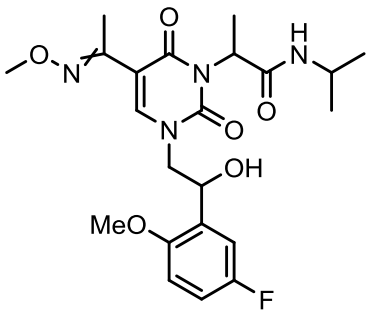
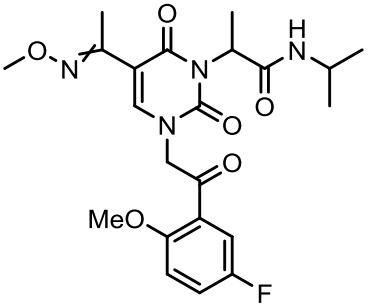
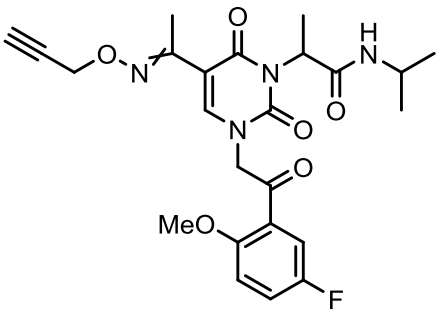
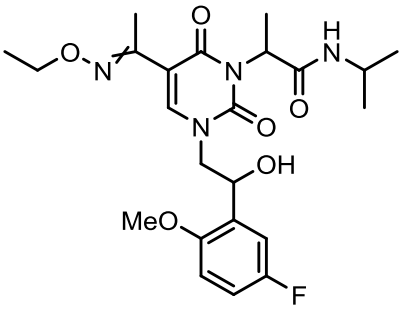
A-8		p.f. 72-73°C
A-9		aceite viscoso
A-10		aceite viscoso
A-11		aceite viscoso

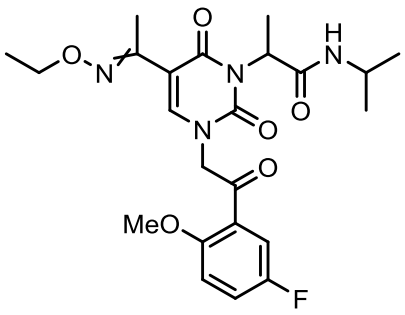
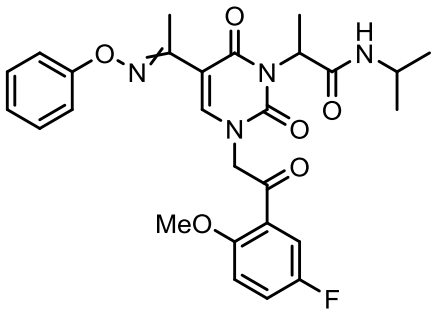
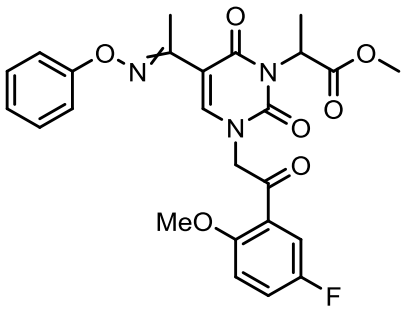
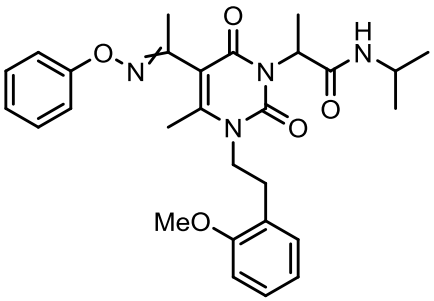
A-12		aceite viscoso
A-13		aceite viscoso
A-14		aceite viscoso
A-15		p.f. 120-121°C

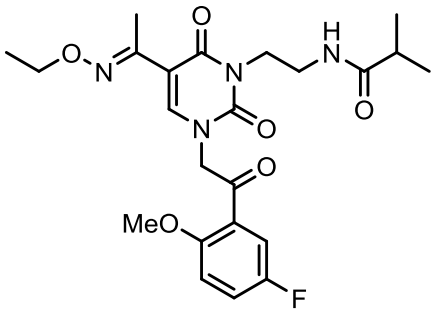
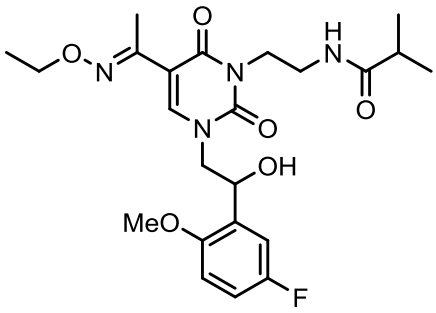
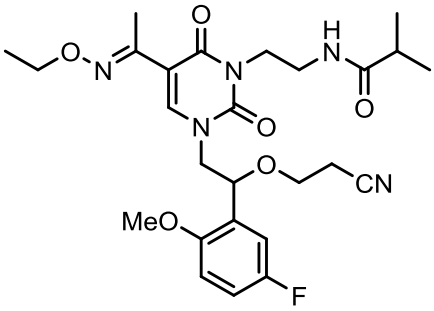
A-16		aceite viscoso
A-17		p.f. 52-53°C
A-18		aceite viscoso
A-19		p.f. 128-129°C

A-20		p.f. 82-83°C
A-21		aceite viscoso
A-22		aceite viscoso
A-23		aceite viscoso

A-24		aceite viscoso
A-25		aceite viscoso
A-26		p.f. 182-183°C
A-27		p.f. 79-80°C

A-28		aceite viscoso
A-29		p.f. 91-92°C
A-30		p.f. 138-139°C
A-31		aceite viscoso

A-32		p.f. 105-106°C
A-33		p.f. 102-103°C
A-34		p.f. 177-178°C
A-35		p.f. 145-146°C

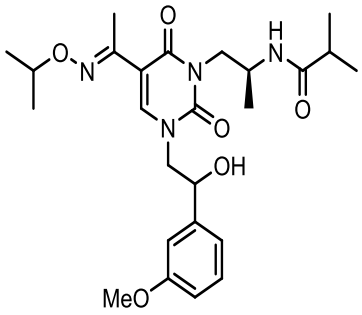
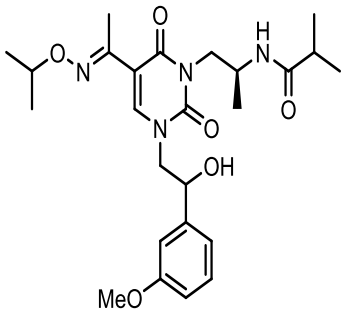
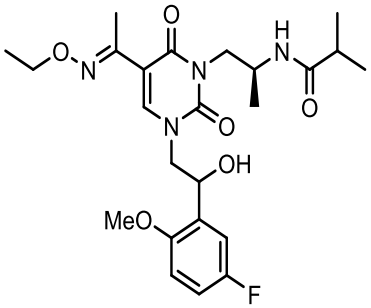
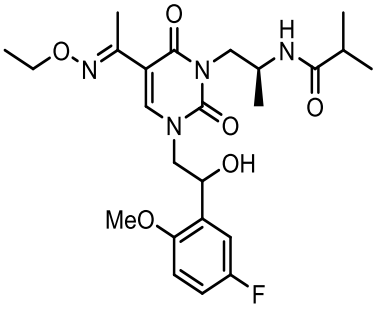
A-36		p.f. 146-147°C
A-37		p.f. 148-149°C
A-38		p.f. 105-106°C

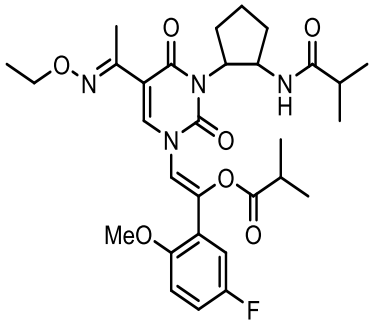
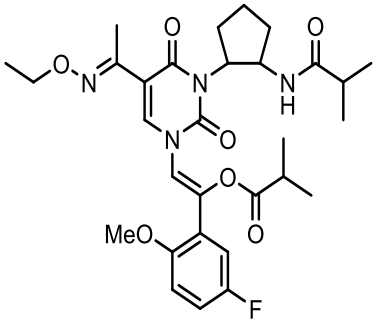
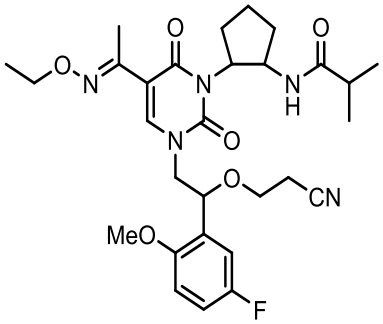
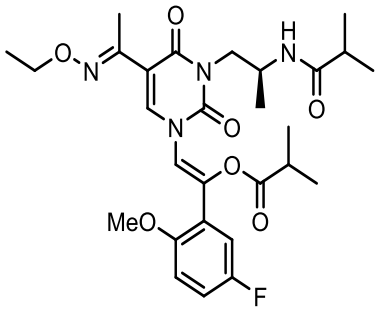
[0293]

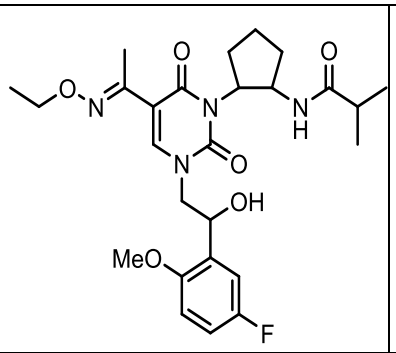
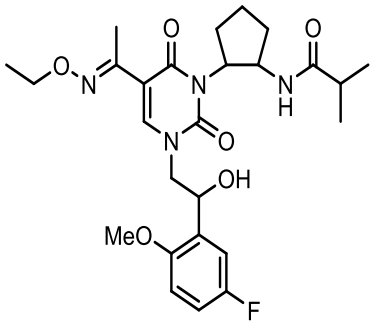
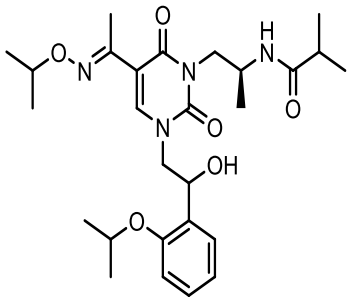
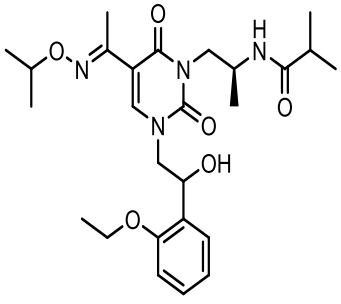
Además, algunos de los compuestos de la presente invención producidos de la misma manera que en los Ejemplos descritos anteriormente se muestran en la Tabla 3. En la tabla, el punto de fusión (p.f.) también se muestra como propiedades físicas de cada compuesto. Cuando el compuesto es un estereoisómero, se indica en las observaciones.

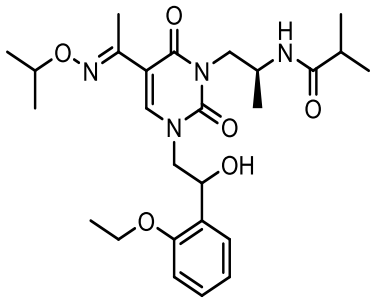
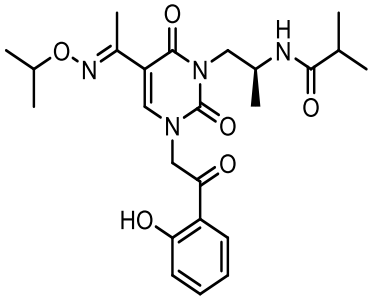
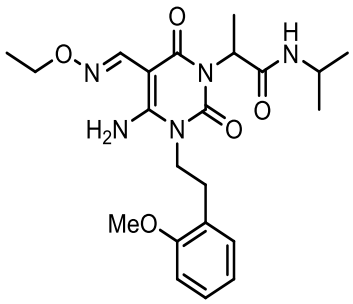
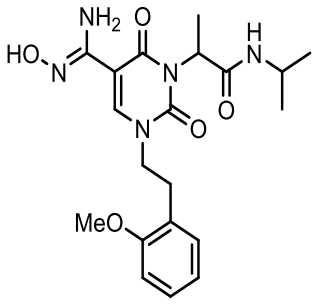
Tabla 3

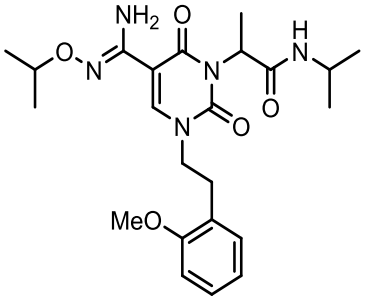
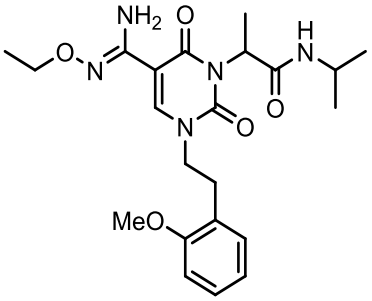
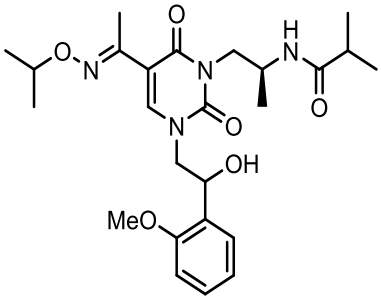
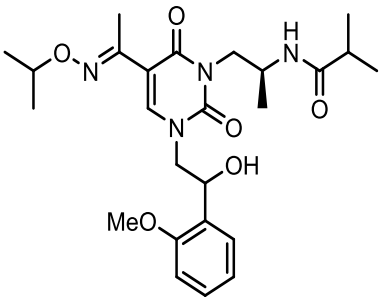
Número de compuesto	Fórmula estructural	Propiedades físicas	Observaciones

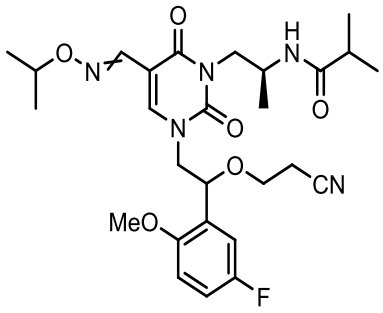
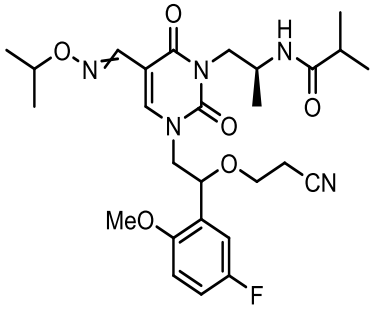
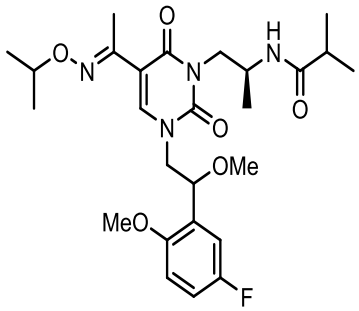
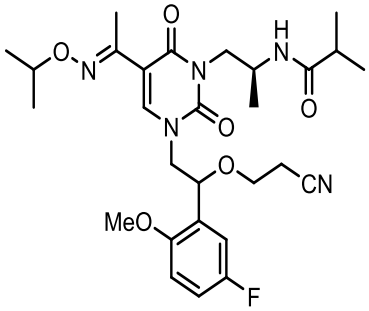
A-39		p.f. 100-103°C	
A-40		p.f. 74-79°C	Isómero de A-39
A-41		p.f. 80-84°C	
A-42		p.f. 141-142°C	Isómero de A-41

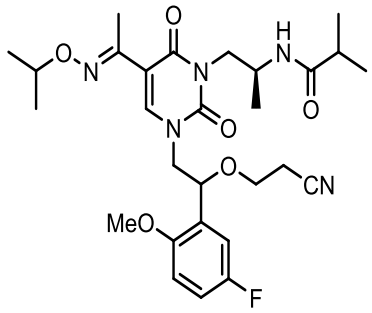
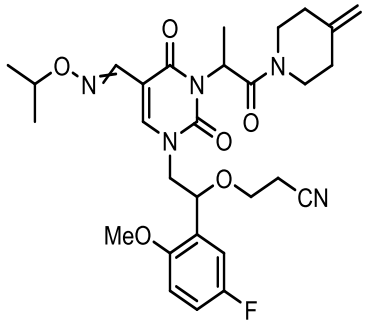
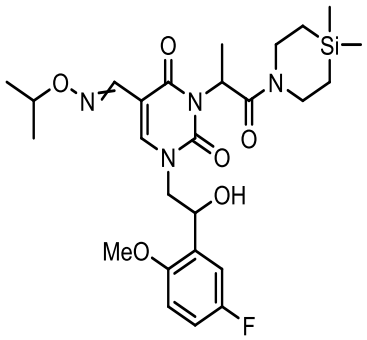
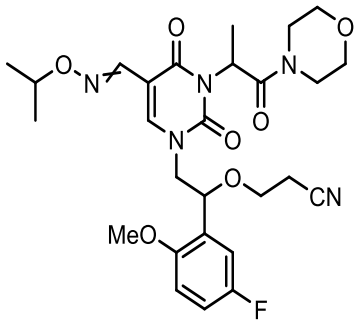
A-43		aceite viscoso	
A-44		aceite viscoso	Isómero de A-43
A-45		aceite viscoso	
A-46		aceite viscoso	

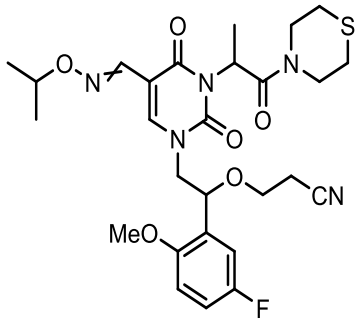
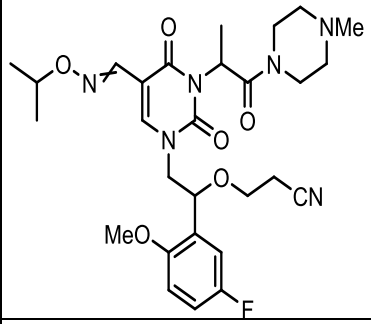
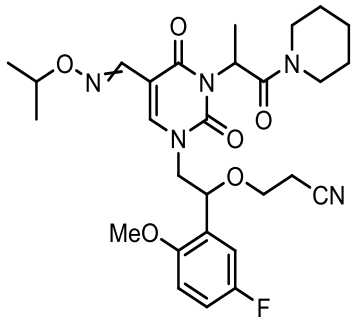
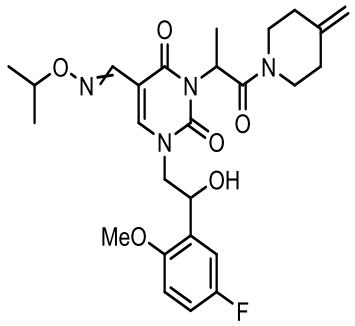
A-47		aceite viscoso	
A-48		aceite viscoso	Isómero de A-47
A-49		p.f. 61-64°C	
A-50		p.f. 153-154°C	

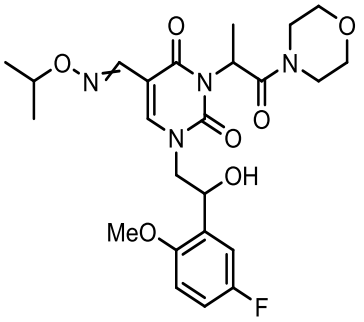
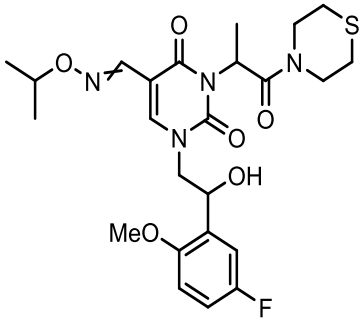
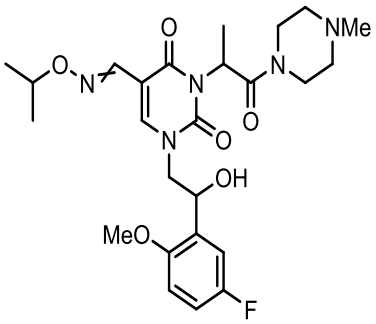
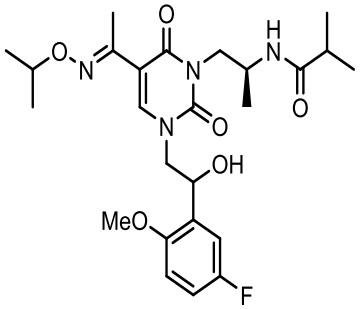
A-51		p.f. 104-106°C	Isómero de A-50
A-52		p.f. 93-96°C	
A-53		amorfo	
A-54		p.f. 217-219°C	

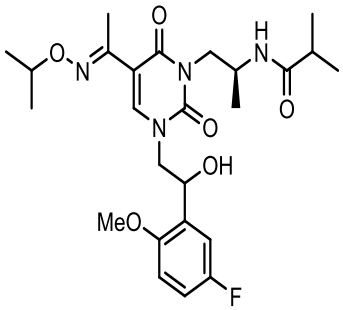
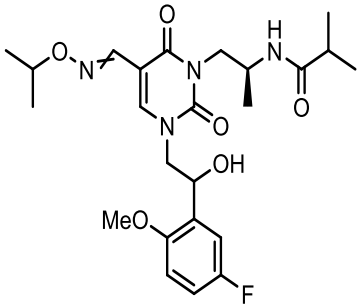
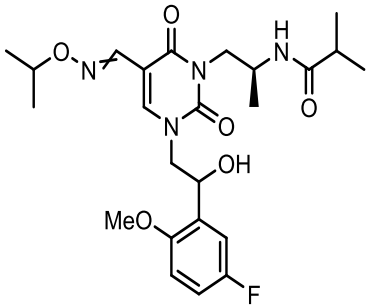
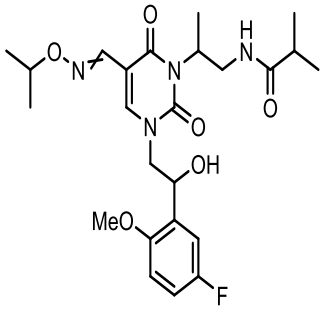
A-55		p.f. 87-90°C	
A-56		p.f. 130-132°C	
A-57		p.f. 112-114°C	
A-58		p.f. 73-77°C	Isómero de A-57

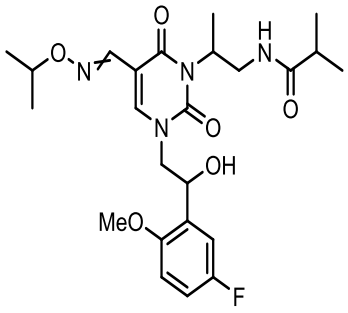
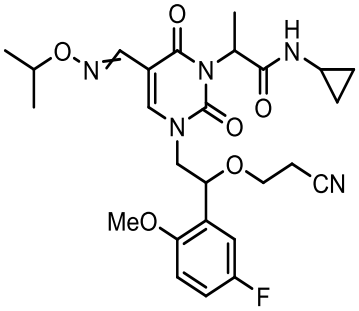
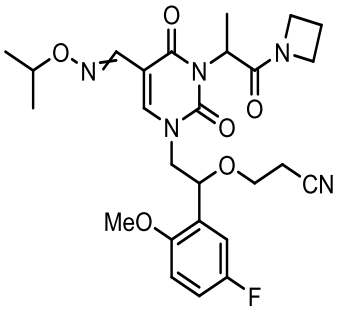
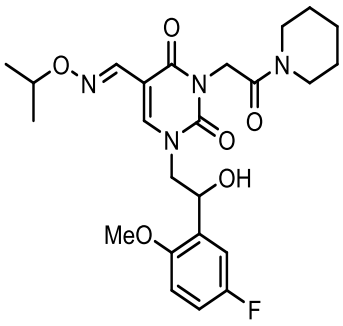
A-59		p.f. 59-62°C	
A-60		p.f. 63-68°C	Isómero de A-59
A-61		p.f. 42-51°C	
A-62		p.f. 53-54°C	

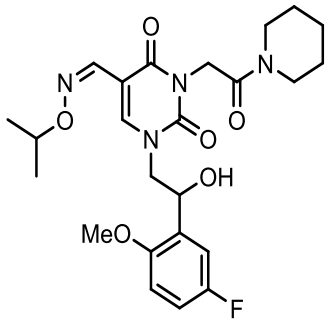
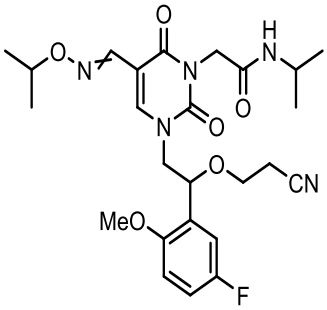
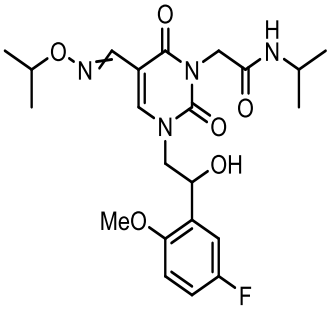
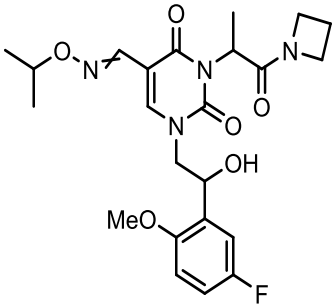
A-63		p.f. 53-54°C	Isómero de A-62
A-64		p.f. 38-40°C	
A-65		aceite viscoso	
A-66		p.f. 67-70°C	

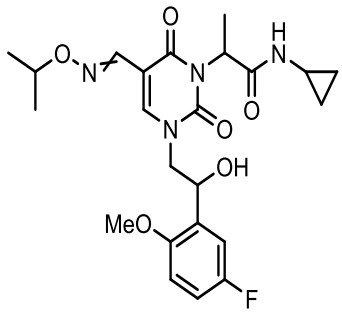
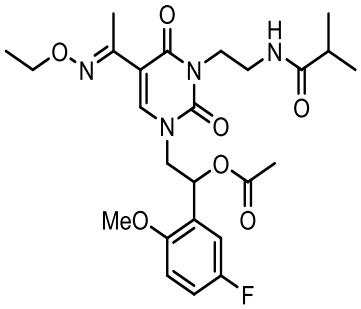
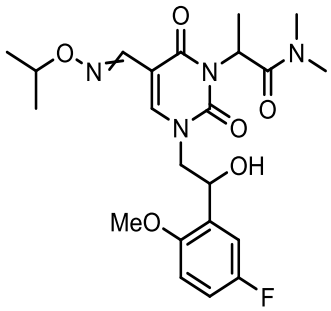
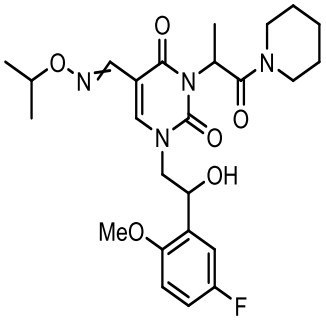
A-67		p.f. 50-52°C	
A-68		p.f. 66-69°C	
A-69		p.f. 66-71°C	
A-70		p.f. 80-82°C	

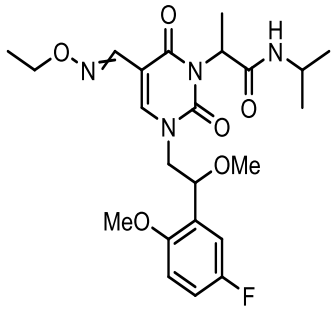
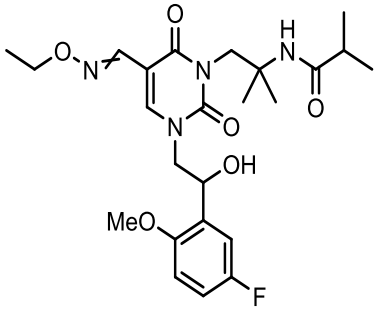
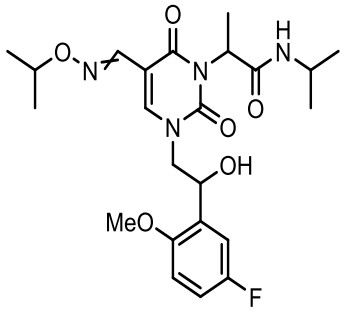
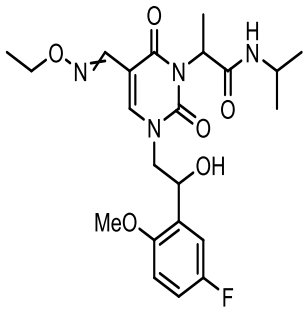
A-71		p.f. 84-87°C	
A-72		p.f. 83-85°C	
A-73		p.f. 84-86°C	
A-74		p.f. 65-68°C	

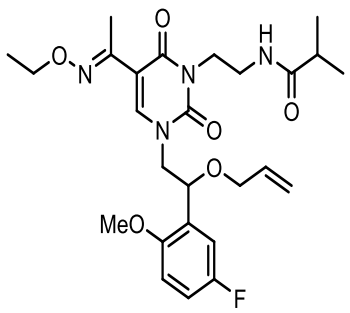
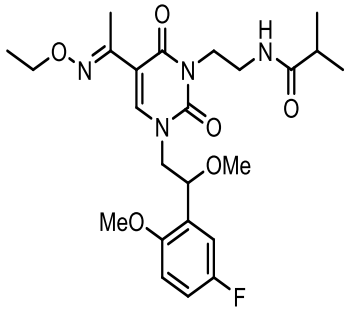
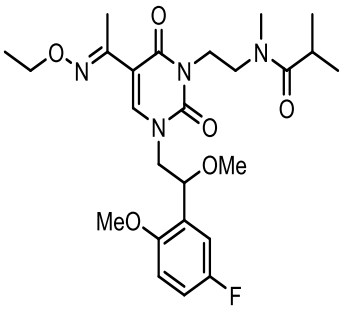
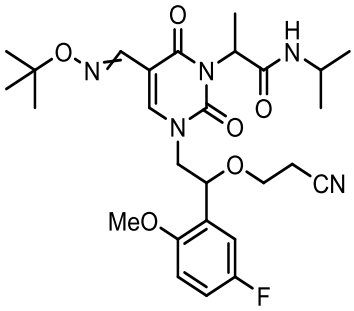
A-75		p.f. 121-124°C	Isómero de A-74
A-76		p.f. 70-76°C	
A-77		p.f. 73-74°C	Isómero de A-76
A-78		p.f. 63-70°C	

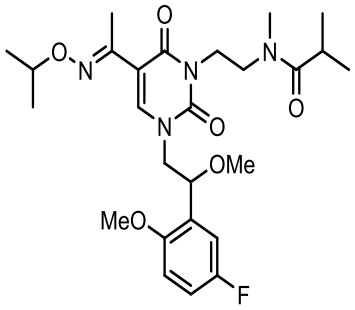
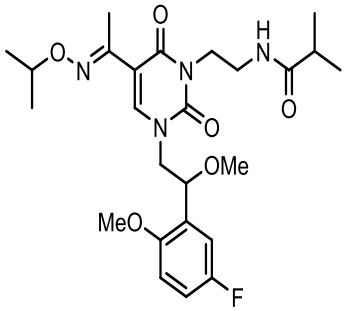
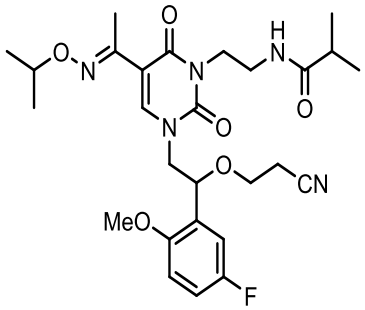
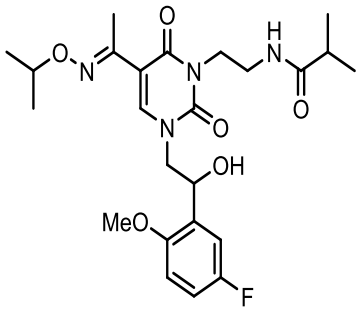
A-79		p.f. 60-67°C	Isómero de A-78
A-80		p.f. 55-56°C	
A-81		p.f. 76-78°C	
A-82		aceite viscoso	

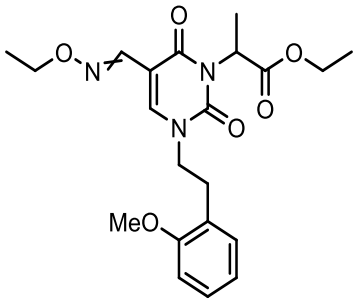
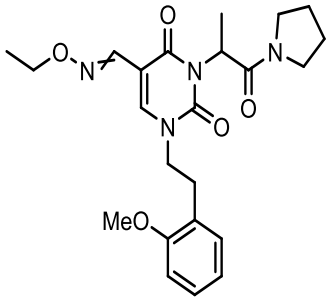
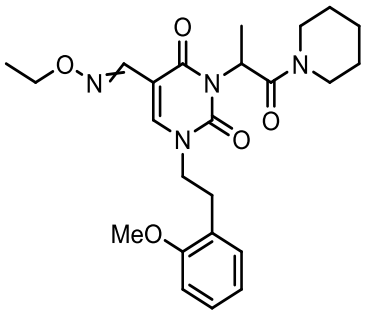
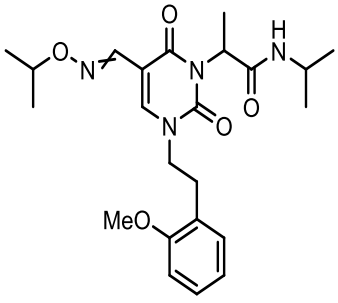
A-83		aceite viscoso	
A-84		p.f. 125-126°C	
A-85		p.f. 108-109°C	
A-86		p.f. 84-85°C	

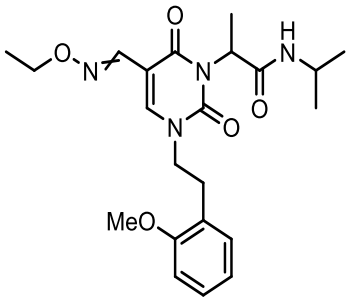
A-87		p.f. 84-89°C	
A-88		p.f. 174-175°C	
A-89		aceite viscoso	
A-90		amorfo	

A-91		aceite viscoso	
A-92		amorfo	
A-93		p.f. 91-92°C	
A-94		p.f. 89-90°C	

A-95		p.f. 118-119°C	
A-96		p.f. 107-108°C	
A-97		aceite viscoso	
A-98		aceite viscoso	

A-99		aceite viscoso	
A-100		aceite viscoso	
A-101		aceite viscoso	
A-102		p.f. 73-74°C	

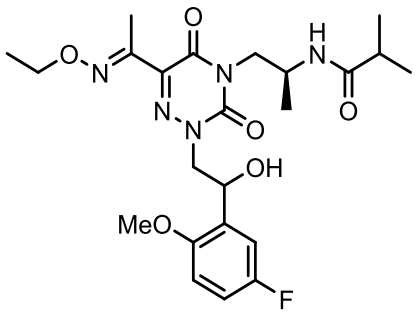
A-103		aceite viscoso	
A-104		aceite viscoso	
A-105		aceite viscoso	
A-106		aceite viscoso	

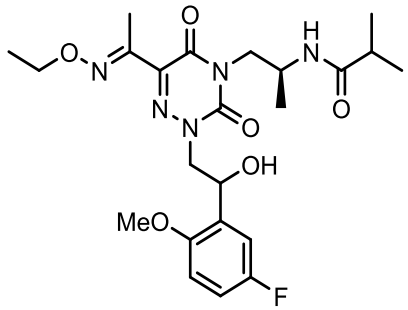
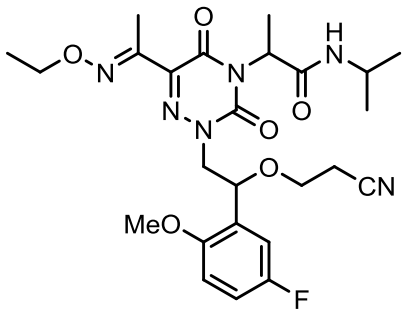
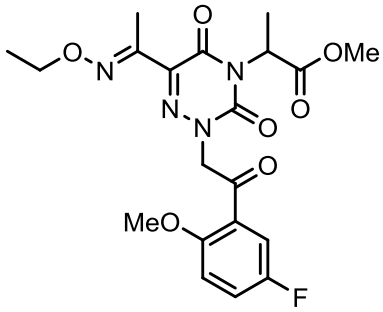
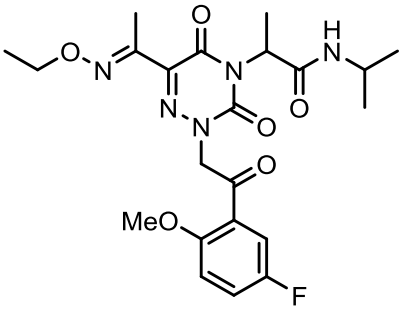
A-107		aceite viscoso	

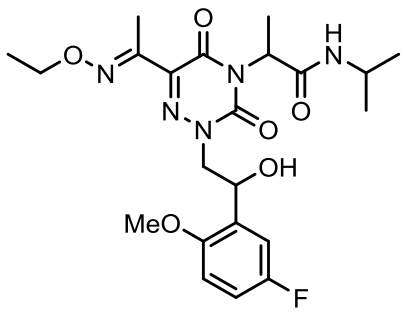
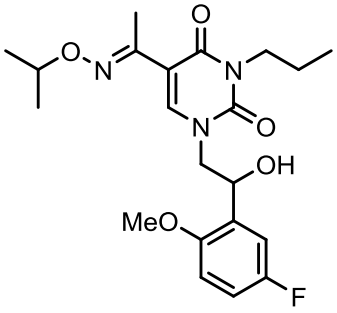
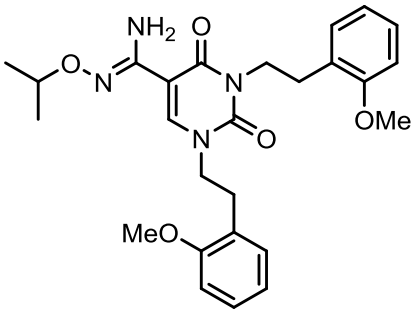
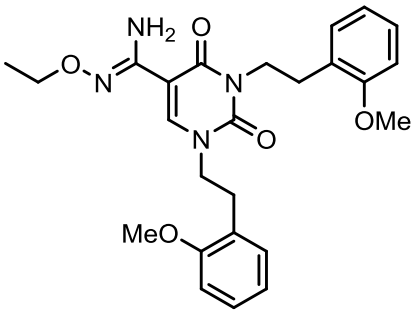
[0294]

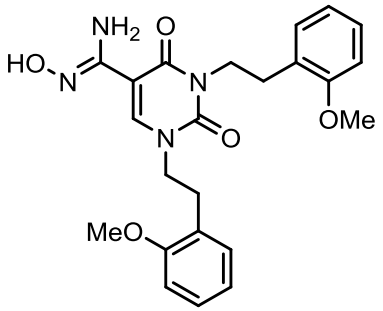
Además, algunos de los compuestos de la presente invención producidos de la misma manera que en los Ejemplos descritos anteriormente se muestran en la Tabla 4. En la tabla, el punto de fusión (p.f.) también se muestra como propiedades físicas de cada compuesto. Cuando el compuesto es un estereoisómero, se indica en las observaciones.

Tabla 4

Número de compuesto	Fórmula estructural	Propiedades físicas	Observaciones
B-1		aceite viscoso	

B-2		aceite viscoso	Isómero de B-1
B-3		amorfo	
B-4		aceite viscoso	
B-5		p.f. 194-196°C	

B-6		aceite viscoso	
B-7		p.f. 118-119°C	
B-8		aceite viscoso	
B-9		aceite viscoso	

B-10		p.f. 138-140°C	

[0295]

Entre los compuestos descritos en las Tablas 2 a 4, para un compuesto que tiene una propiedad de aceite amorfo o viscoso, los datos de RMN de ^{1}H del mismo se muestran en la Tabla 5 a continuación.

Tabla 5

Número de compuesto	Datos de RMN
A-3	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,64-6,97(4H, m) , 5,09(2H, s), 4,38-3,96(8H, m), 2,16(3H, s), 1,28-1,21(15H, m).
A-4	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,64-7,50(2H, m) 7,61(2H, s)7,14-6,80(3H, m), 5,88-5,03 (3H, m), 4,74-2,51 (14H, m), 1,55(3H, d), 1,13(6H, d).
A-5	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,80-7,55(2H, m) 7,14-6,80(3H, m), 6,10-4,60 (8H, m), 4,40-3,41 (5H, m), 3,82 (3H, s), 2,65-2,51(2H, m), 1,55(3H, d), 1,13(6H, d).
A-6	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,71-7,51(2H, m) 7,14-6,80(3H, m), 5,85-5,07 (3H, m), 4,40-3,41 (5H, m), 3,93 (3H, s), 3,82 (3H, s), 2,65-2,51(2H, m), 1,55(3H, d), 1,13(6H, d).
A-7	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,71-7,51(2H, m) 7,14-6,80(3H, m), 6,08-2,55 (16H, m), 1,32-1,18 (15H, m).

A-9	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,90-7,51(2H, m) 7,14-6,80(3H, m), 5,85-5,07 (3H, m), 4,40-3,41 (7H, m), 3,82 (3H, s), 2,65-2,51(2H, m), 1,55(3H, d), 1,62-0,30(11H, m).
A-10	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,79-7,60(2H, m) 7,14-6,80(3H, m), 6,30-5,07 (4H, m), 4,40-3,41 (7H, m), 3,82 (3H, s), 2,65-2,51(2H, m), 1,55(3H, d), 1,13(6H, d).
A-11	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,80-7,51(2H, m) 7,14-6,80(3H, m), 5,85-5,07 (3H, m), 4,40-3,41 (7H, m), 3,82 (3H, s), 2,65-2,51(2H, m), 1,78-0,95(11H, m).
A-12	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,23-7,94(2H, m) 7,14-6,80(3H, m), 5,85-5,07 (3H, m), 4,74(2H, s), 4,40-3,41 (5H, m), 3,82 (3H, s), 2,65-2,51(2H, m), 1,55(3H, d), 1,13(6H, d).
A-13	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,67-7,48(2H, m) 7,15-6,80(3H, m), 5,08-2,53 (16H, m), 1,31-1,18 (12H, m).
A-14	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,84-7,51(2H, m) 7,14-6,80(3H, m), 5,85-5,07 (3H, m), 4,40-3,41 (6H, m), 3,82 (3H, s), 2,65-2,51(2H, m), 1,55(3H, d), 1,29-1,13(12H, m)
A-16	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,78-6,80(8H, m) 5,11-2,53(16H, m), 1,33(3H, t).
A-18	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,71-7,51(2H, m) 7,14-6,80(3H, m), 5,12-2,53 (17H, m), 1,39 (9H, s), 1,32 (3H, t).
A-21	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,77-7,51(2H, m) 7,14-6,80(3H, m), 5,85-5,07 (3H, m), 4,72-2,49 (10H, m), 3,82 (3H, s),1,55(3H, d), 1,12(6H, d).
A-22	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,23-7,84(2H, m) 7,14-6,80(3H, m), 5,85-5,07 (3H, m), 4,40-3,41 (7H, m), 3,82 (3H, s), 2,65-2,51(2H, m), 1,55(3H, d), 1,13(6H, d).
A-23	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,80-7,51(2H, m) 7,14-6,80(3H, m), 5,85-5,07 (3H, m), 4,37-3,41 (7H, m), 3,82 (3H, s), 2,65-2,51(2H, m), 1,56-1,11(12H, m).

A-24	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,41(1H, s) 7,14-6,80(3H, m), 6,11(1H, d), 5,05-2,51(12H, m), 3,82 (3H, s), 2,14(3H, s), 1,31-1,13(15H, m).
A-25	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,30(1H, s) 7,20-6,77(3H, m), 5,91(1H, d), 5,24-3,81(9H, m), 3,85 (3H, s), 2,14(3H, s), 1,31-1,13(15H, m).
A-28	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,35(1H, s) 7,18-6,80(3H, m), 5,45-3,81(13H, m), 2,12 (3H, s), 1,52(3H, d), 1,15(6H, m).
A-31	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,33(1H, s) 7,18-6,80(3H, m), 5,45-3,81(12H, m), 2,14 (3H, s), 1,52(3H, d), 1,30-1,12(9H, m).

Número de compuesto	Datos de RMN
A-43	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 1,06-1,33(m,15H), 1,69-2,30(m,11H), 3,70-4,50(m,5H), 4,78-5,23(m,2H), 6,59-7,34(m,4H), 8,21(s,1H).
A-44	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 1,06-1,42(m,15H), 1,69-2,30(m,11H), 3,70-4,50(m,5H), 4,78-5,23(m,2H), 6,61-7,34(m,4H), 7,27(s,1H).
A-45	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 0,95-1,31(m,9H), 1,69-2,30(m,10H), 2,60-2,72(m,2H), 3,48-4,52(m,6H), 4,99-5,28(m,2H), 6,82-7,31(m,4H).
A-46	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 1,02-1,28(m,18H), 2,13(s,3H), 2,21-2,30(m,1H), 2,75-2,82(m,1H), 3,85(s,3H), 3,93-4,40(m,5H), 6,85-7,03(m,3H), 7,17(s,1H), 7,59(s,1H).
A-47	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 0,99-1,26(m,9H), 1,48-2,70(m,10H), 3,84(s,3H), 4,05-4,55(m,5H), 5,40-5,48(m,2H), 6,77-6,95(m,2H), 7,24-7,29(m,2H).

A-48	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 1,05-1,30(m,9H), 1,48-2,39(m,10H), 3,22-4,53(m,H)s,8H), 5,09-5,32(m,2H), 6,77-6,98(m,2H), 7,24-7,29(m,2H).
A-53	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 1,26-1,30(m,6H), 1,66(d,3H), 2,93-2,98(m,2H), 3,83(s,3H), 4,10-4,22(m,8H), 4,51-4,54(m,1H), 6,81-7,24(m,4H), 8,23(s,1H).
A-65	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,80-7,51(2H, m) 7,14-6,80(3H, m) 5,57-3,13 (11H, m), 3,84 (3H, s), 1,55-1,23(13H, m), 0,09(6H, s).
A-82	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,82(1H, s), 7,51(1H, s), 7,25-6,80 (3H, m), 5,25-3,47 (11H, m), 3,79 (3H, s), 1,69-1,23(12H, m).
A-83	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,01(1H, s), 7,70(1H, s), 7,25-6,80 (3H, m), 5,25-3,45 (11H, m), 3,79 (3H, s), 1,69-1,23(12H, m).
A-89	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,83-8,74 (1H, m), 7,97-7,47 (1H, m), 7,09-7,07 (1H, m), 6,97-6,91 (1H, m), 6,80-6,78 (1H, m), 5,51-5,46 (1H, m), 5,24-5,16 (1H, m), 4,44-4,07 (3H, m), 3,87 (3H, s), 2,94-2,64 (6H, m), 1,50-1,46 (3H, m), 1,31-1,23 (6H, m).
A-90	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,83-7,62 (1H, m), 8,01-7,51 (1H, m), 7,16-7,11 (1H, m),6,99-6,94 (1H, m), 6,83-6,80 (1H, m), 5,53-5,50 (1H, m), 5,21-5,18 (1H, m), 4,44-3,08 (7H, m), 3,865 (3H, s), 1,634-1,243 (15H, m).
A-91	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,74-7,49(2H, m) 7,11-6,80(3H, m), 5,50-4,83 (3H, m), 4,37-3,41 (5H, m), 3,82 (3H, s), 3,30 (3H, s), 1,56-1,11(12H, m).
A-92	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,76-8,09 (1H, m), 7,74-7,48 (1H, m), 7,23-7,19 (1H, m), 6,98-6,94 (1H, m), 6,83-6,78 (1H, m), 5,27-5,26 (1H, m), 4,32-4,04 (7H, m), 3,84 (3H, s), 2,23-2,16 (1H, m), 1,46-1,46 (6H, m), 1,33-1,26 (3H, m), 1,06-1,04 (6H, m).

A-97	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,40-6,79(4H, m), 4,90-2,69(10H, m), 3,82 (3H, s), 3,29 (3H, s), 3,05 (3H, s), 2,14 (3H, s), 1,30-1,01(9H, m)
A-98	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,87-7,51(2H, m) 7,14-6,80(3H, m), 5,85-5,07 (3H, m), 4,34-3,41 (5H, m), 3,82 (3H, s), 2,65-2,51(2H, m), 1,56-1,11(18H, m)
A-99	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,40-6,79(4H, m), 4,90-2,69(9H, m), 3,82 (3H, s), 3,29 (3H, s), 3,05 (3H, s), 2,14 (3H, s), 1,30-1,01(12H, m)
A-100	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,36(1H, s), 7,10-6,82(3H, m) 6,29-4,88(2H, m), 4,40-3,41(7H, m), 3,82 (3H, s), 3,29 (3H, s), 2,34-2,15(4H, m), 1,30-1,11(12H, m).
A-101	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,43(1H, s), 7,14-6,82(3H, m) 6,29-5,10(2H, m), 4,40-3,43(9H, m), 3,84 (3H, s), 2,63(2H, t), 2,34-2,15(4H, m), 1,30-1,11(12H, m).
A-103	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 1,18-1,26(m,6H), 1,58(d,3H), 2,98-3,04(m,2H), 3,71-4,10(m,9H), 5,46-5,51(m,1H), 6,82-7,38(m,5H), 7,95(s,1H).
A-104	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 1,25-1,29(m,3H), 1,62-1,95(m,4H), 2,68-3,47(m,6H), 3,81-4,18(m,7H), 5,39-5,441(m,1H), 6,82-7,54(m,5H), 7,96(s,1H).
A-105	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 1,18-1,62(m,12H), 2,94-3,12(m,4H), 3,40-3,62(m,2H), 3,81-4,19(m,7H), 5,45-5,51(m,1H), 6,82-7,49(m,5H), 7,97(s,1H).
A-106	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: RMN de 1H (CDCl3) δ: 8,50-6,85(6H, m) 5,50-5,38(2H, m), 4,35-3,94 (4H, m), 3,80 (3H, s), 3,15-2,91(2H, m), 1,56-1,14(15H, m).
A-107	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,43-6,85(6H, m) 5,50-5,38(2H, m), 4,18-3,98(5H, m), 3,80 (3H, s), 3,15-2,91(2H, m), 1,56-1,14(12H, m).

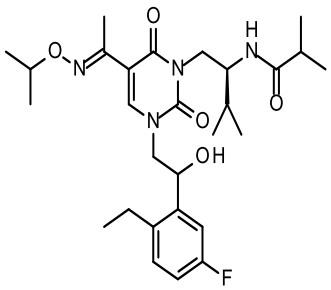
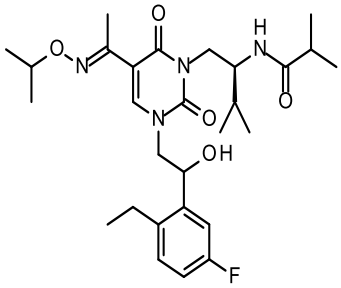
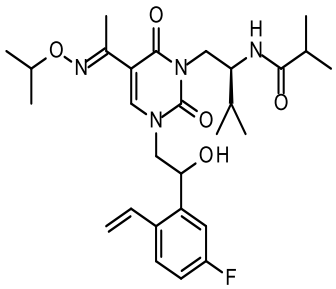
B-1	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 1,01-1,08(m,6H), 1,23-1,29(m,6H), 2,03-2,30(m,4H), 3,63-3,85(m,2H), 3,86(s,3H), 4,05-4,40(m,2H), 4,60-4,72(m,2H), 5,44-5,56(m,1H), 6,75-6,81(m,1H), 6,89-6,95(m,1H), 7,32-7,38(m,1H).
B-2	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 1,04-1,09(m,6H), 1,22-1,31(m,6H), 2,02-2,25(m,4H), 3,48-3,90(m,5H), 4,11-4,28(m,2H), 5,18-5,65(m,2H), 6,75-6,81(m,1H), 6,89-6,95(m,1H), 7,32-7,38(m,1H).
B-3	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 1,14-1,62(m,12H), 2,15(s,3H), 2,58-2,62(m,2H), 3,47-4,43(m,11H), 5,15-5,32(m,2H), 6,89-6,93(m,1H), 6,95-6,98(m,1H), 7,19-7,24(m,1H) ,
B-4	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 1,33(t,3H), 1,72(d,3H), 2,18(s,3H), 3,68-3,77(m,3H), 3,95(s,3H), 4,25-4,31(m,2H), 5,29-5,38(m,2H), 6,96-6,99(m,1H), 7,21-7,25(m,1H), 7,62-7,65(m,1H).
B-6	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 1,14-1,16(m,6H), 1,30(t,3H), 1,64(d,3H), 2,13(s,3H), 3,40-3,47(m,1H), 3,89(s,3H), 4,01-4,55(m,5H), 5,05-5,19(m,2H), 6,82-6,85(m,1H), 6,91-6,98(m,1H), 7,06-7,12(m,1H) ,
B-8	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 1,20-1,28(m,6H), 2,91-2,97(m,4H), 3,80(s,3H), 3,84(s,3H), 3,94-4,20(m,4H), 6,82-7,24(m,8H), 7,60(s,1H).
B-9	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 1,20-1,27(m,3H), 2,91-2,96(m,4H), 3,81(s,3H), 3,84(s,3H), 3,95-4,20(m,4H), 6,82-7,24(m,8H), 7,64(s,1H).

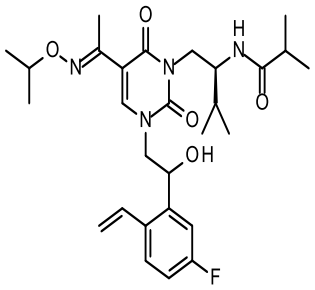
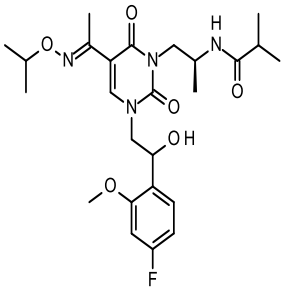
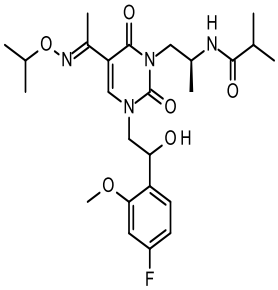
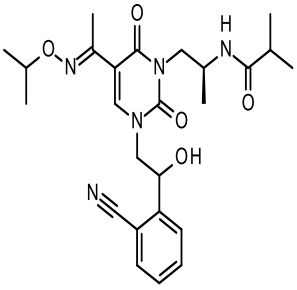
[0296]

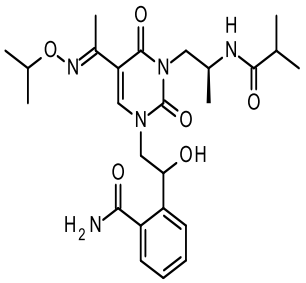
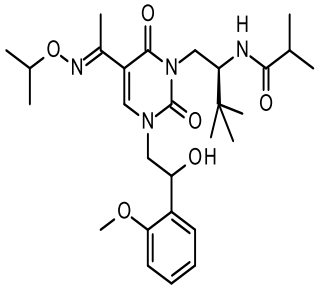
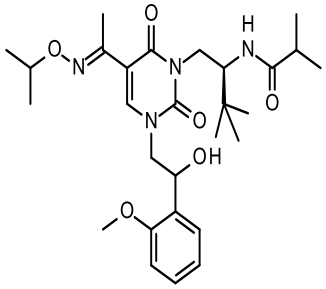
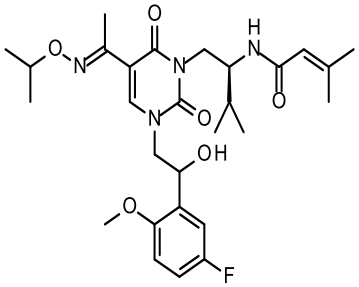
Además, algunos de los compuestos de la presente invención producidos de la misma manera que en los Ejemplos descritos anteriormente se muestran en la Tabla 6. En la tabla, el punto de fusión (p.f.) también se muestra como propiedades físicas de cada compuesto.

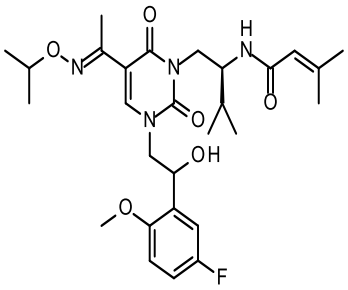
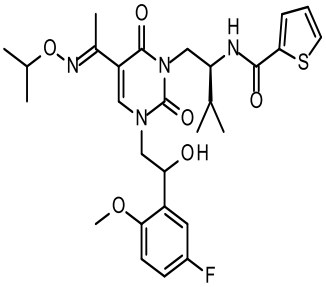
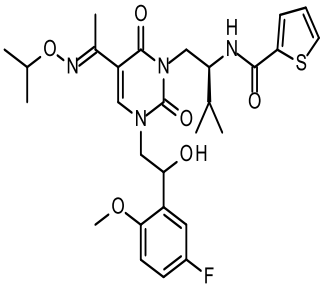
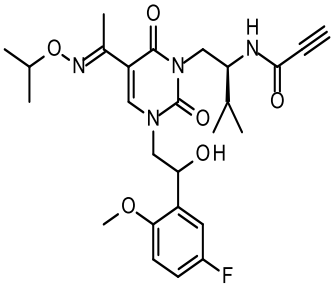
Cuando el compuesto es un estereoisómero, se indica en las observaciones.

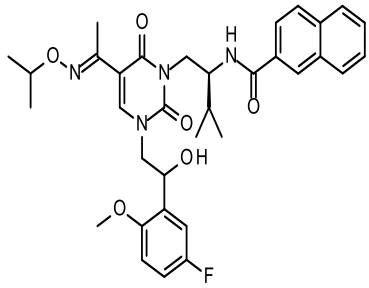
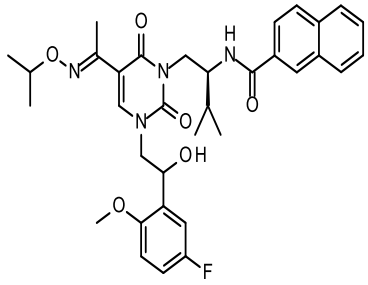
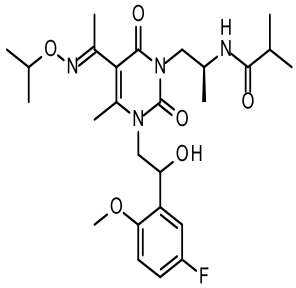
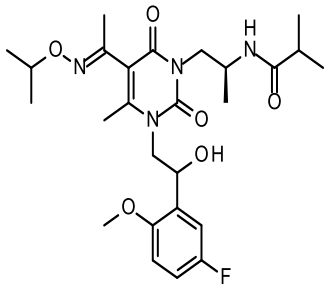
Tabla 6

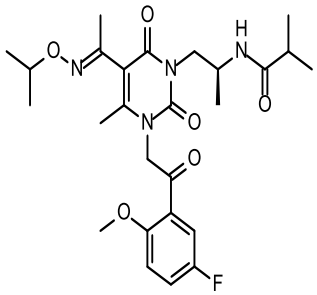
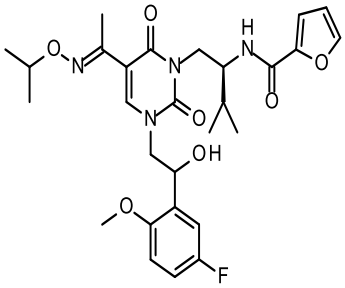
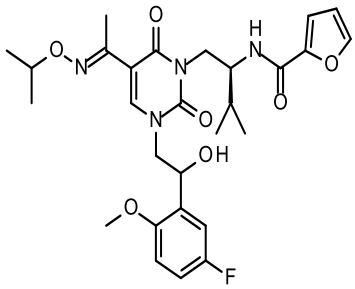
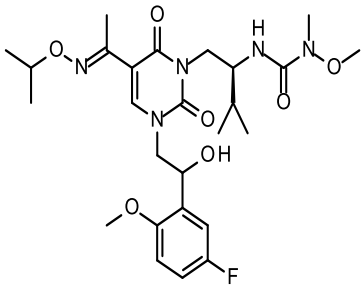
Número de compuesto	Fórmula estructural	Propiedades físicas	Observaciones
C-1		p.f. 73-75°C	
C-2		p.f. 82-84°C	Isómero de C-1
C-3		aceite viscoso	

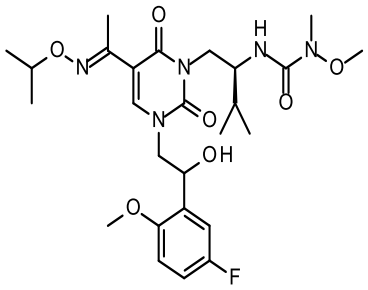
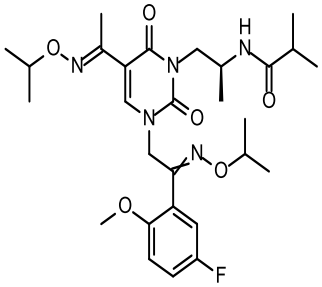
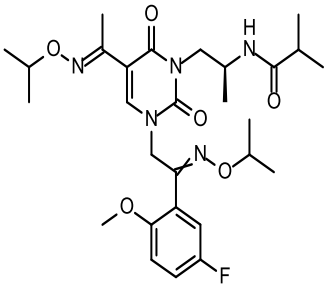
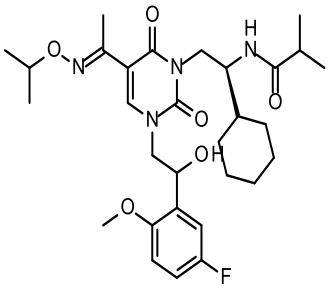
C-4		aceite viscoso	Isómero de C-3
C-5		amorfo	
C-6		p.f. 124-126°C	Isómero de C-5
C-7		p.f. 182-185°C	

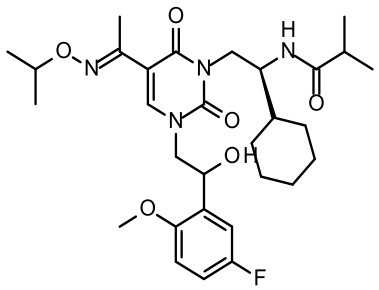
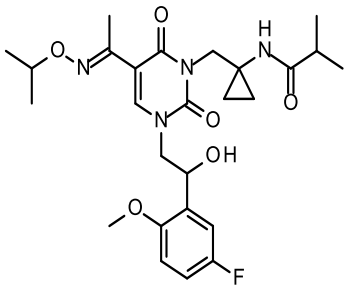
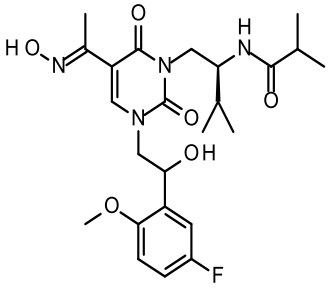
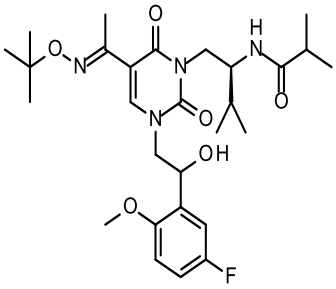
C-8		aceite viscoso	
C-9		p.f. 72-76°C	
C-10		p.f. 124-126°C	Isómero de C-9
C-11		p.f. 68-69°C	

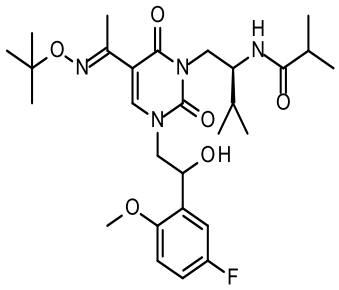
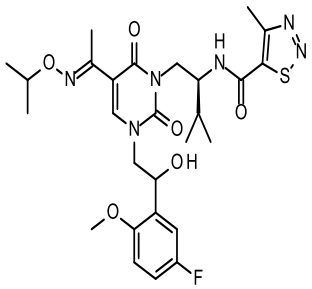
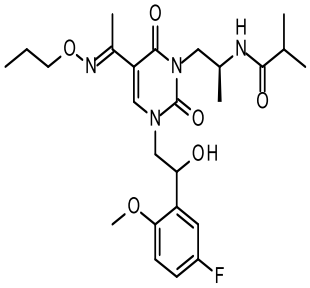
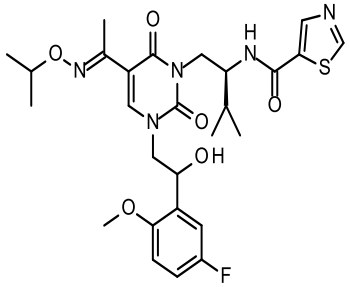
C-12		p.f. 150-153°C	Isómero de C-11
C-13		p.f. 69-70°C	
C-14		p.f. 74-75°C	Isómero de C-13
C-15		p.f. 49-50°C	

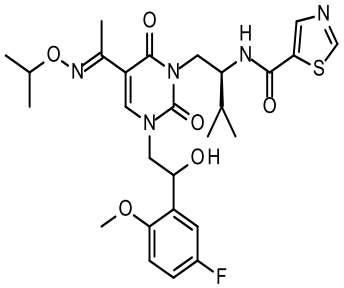
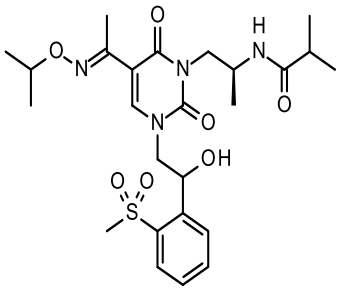
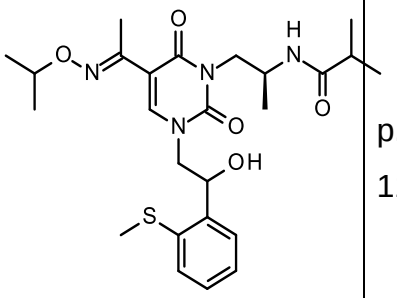
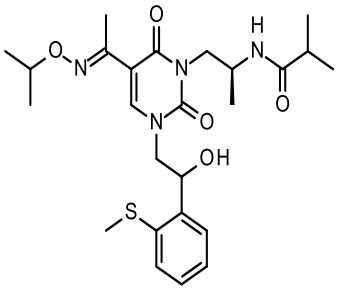
C-16		p.f. 77-78°C	
C-17		p.f. 88-89°C	Isómero de C-16
C-18		aceite viscoso	
C-19		amorfo	Isómero de C-18

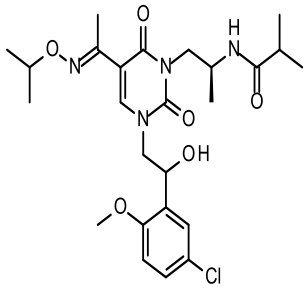
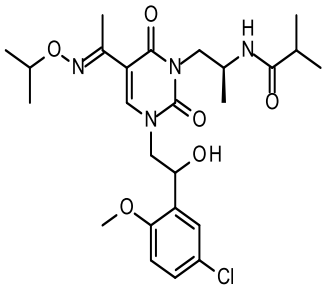
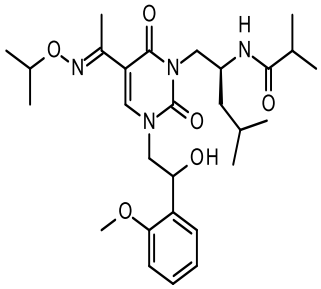
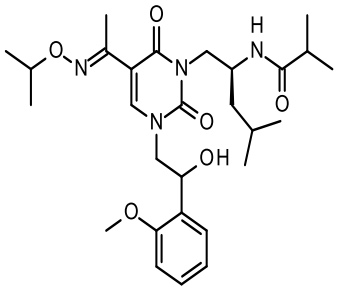
C-20		p.f. 187-189°C	
C-21		p.f. 64-65°C	
C-22		p.f. 68-70°C	Isómero de C-21
C-23		p.f. 56-57°C	

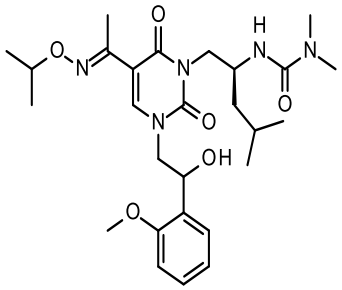
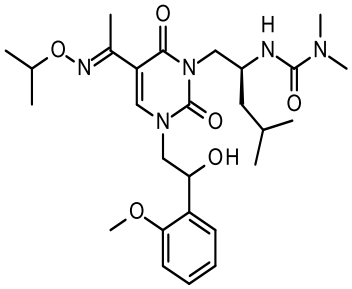
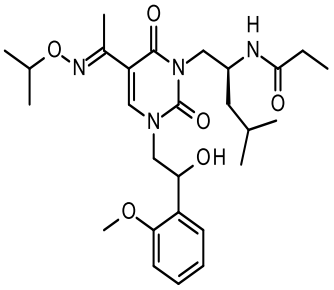
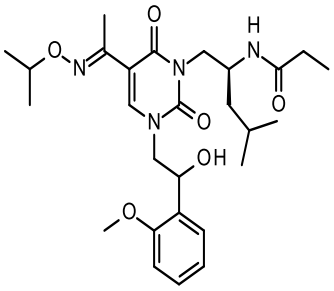
C-24		p.f. 44-47°C	Isómero de C-23
C-25		p.f. 146-147°C	
C-26		aceite viscoso	Isómero de C-25
C-27		p.f. 142-144°C	

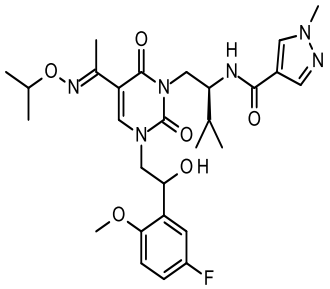
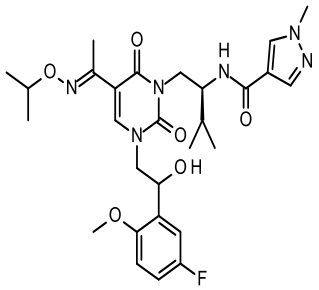
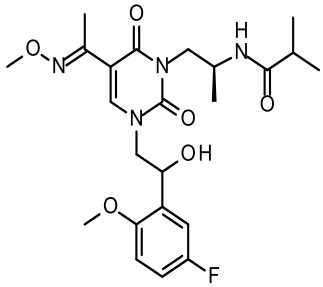
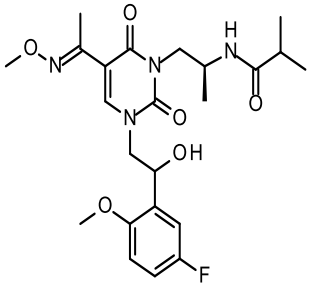
C-28		p.f. 82-85°C	Isómero de C-27
C-29		p.f. 70-75°C	
C-30		p.f. 72-73°C	
C-31		p.f. 76-77°C	

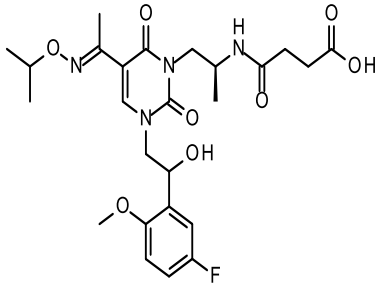
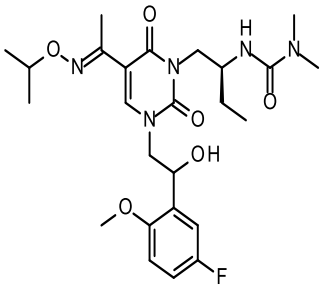
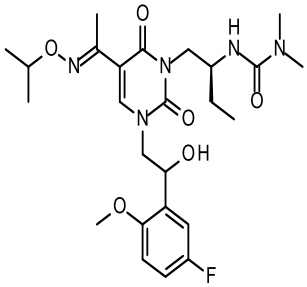
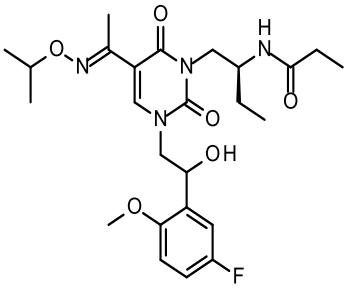
C-32		p.f. 70-72°C	Isómero de C-31
C-33		p.f. 76-77°C	
C-34		p.f. 61-62°C	
C-35		p.f. 75-78°C	

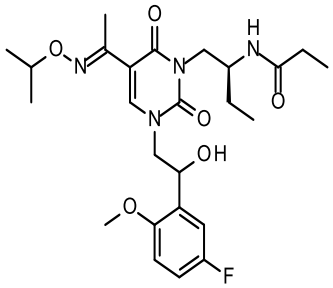
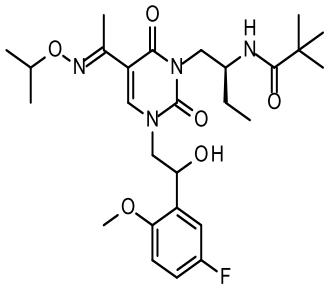
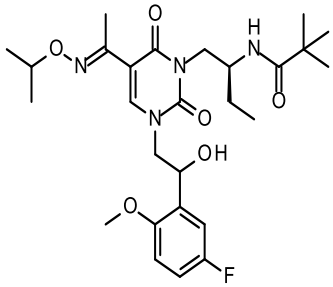
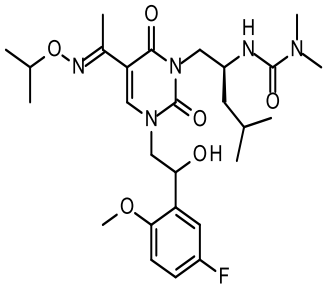
C-36		p.f. 89-90°C	Isómero de C-35
C-37		aceite viscoso	
C-38		p.f. 109-111°C	
C-39		p.f. 76-79°C	Isómero de C-38

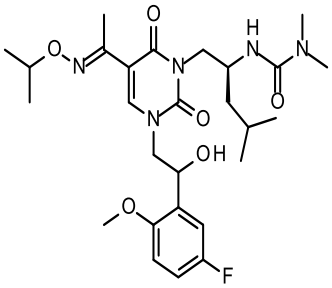
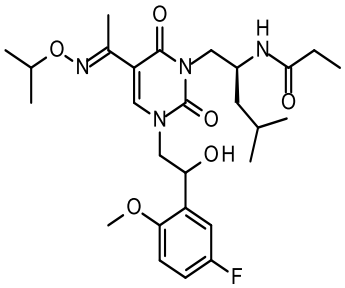
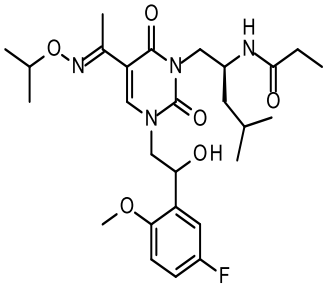
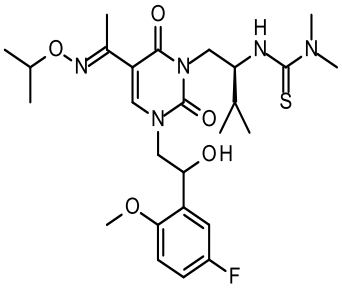
C-40		amorfo	
C-41		p.f. 126-129°C	Isómero de C-40
C-42		aceite viscoso	
C-43		amorfo	Isómero de C-42

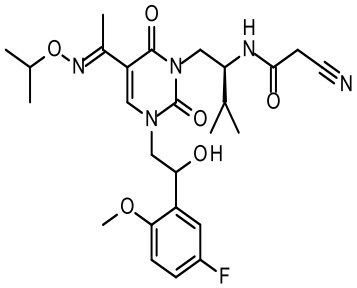
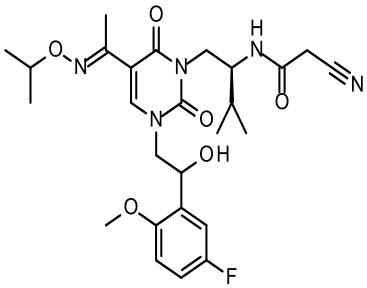
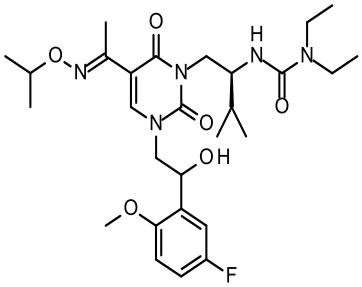
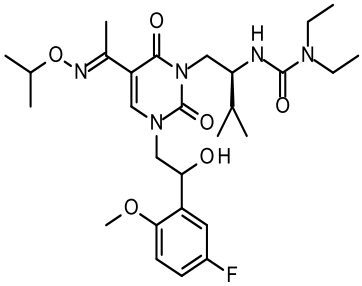
C-44		aceite viscoso	
C-45		aceite viscoso	Isómero de C-44
C-46		amorfo	
C-47		p.f. 72-74°C	Isómero de C-46

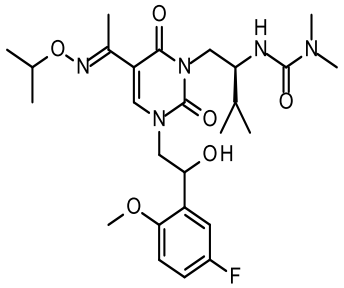
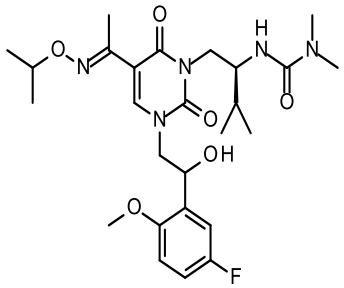
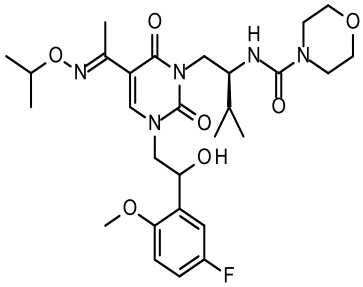
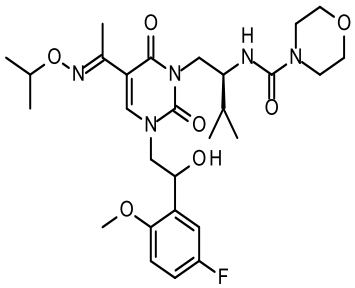
C-48		p.f. 85-86°C	
C-49		p.f. 80-82°C	Isómero de C-48
C-50		p.f. 70-74°C	
C-51		p.f. 137-139°C	Isómero de C-50

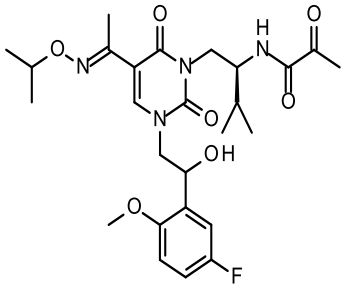
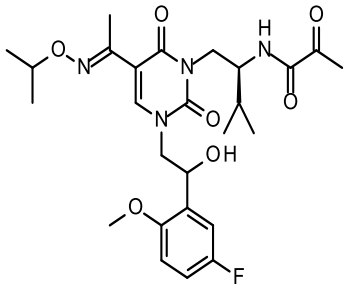
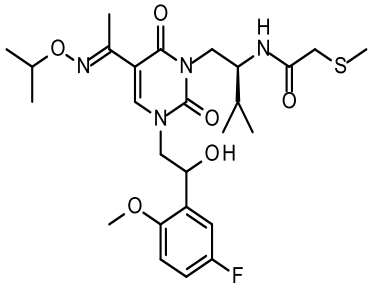
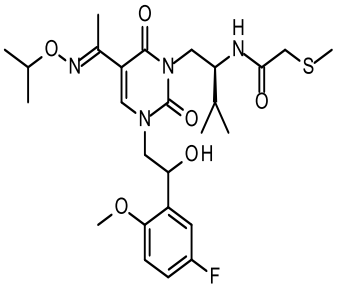
C-52		p.f. 178-179°C	
C-53		amorfo	
C-54		p.f. 83-85°C	Isómero de C-53
C-55		aceite viscoso	

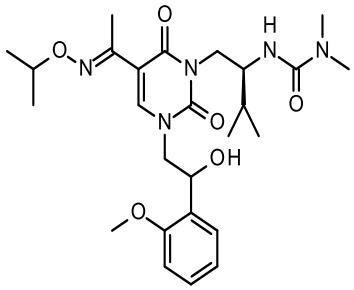
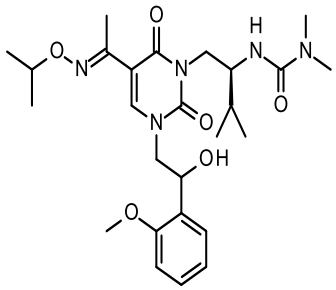
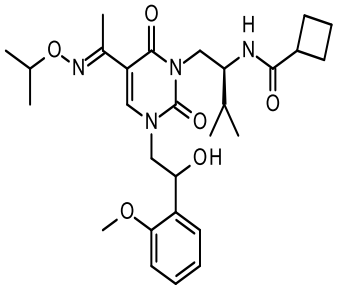
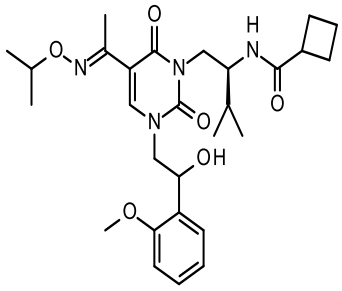
C-56		p.f. 129-130°C	Isómero de C-55
C-57		p.f. 63-66°C	
C-58		p.f. 68-71°C	Isómero de C-57
C-59		amorfo	

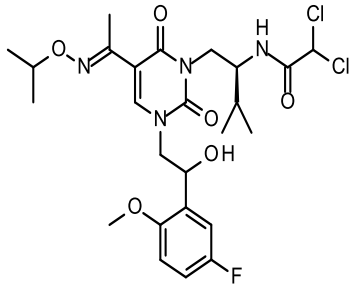
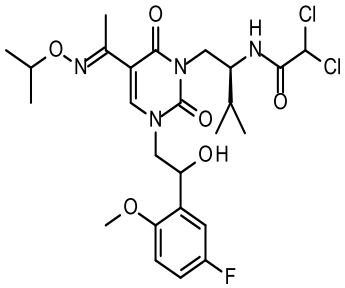
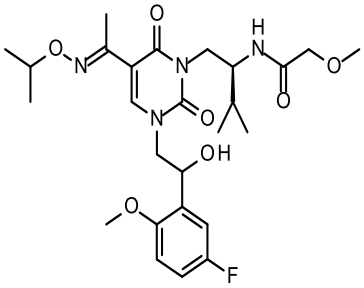
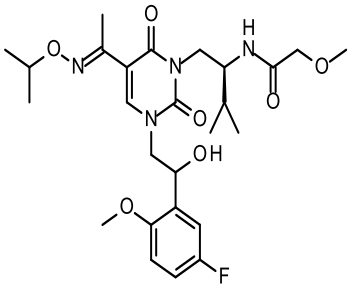
C-60		aceite viscoso	Isómero de C-59
C-61		amorfo	
C-62		p.f. 137-142°C	Isómero de C-61
C-63		p.f. 56-57°C	

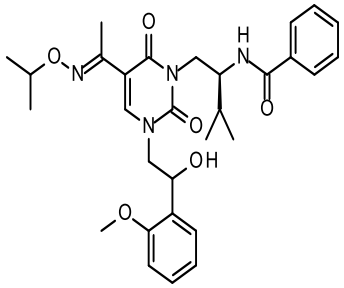
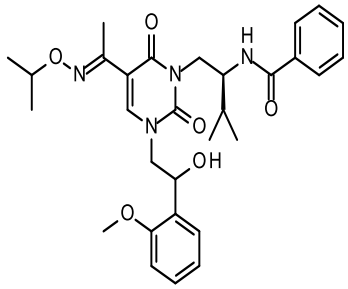
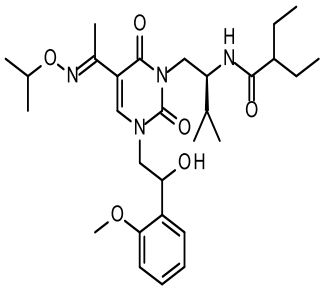
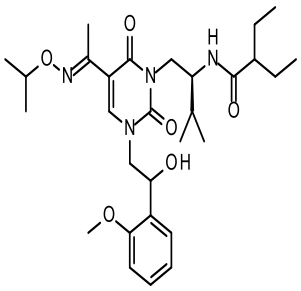
C-64		p.f. 66-67°C	
C-65		p.f. 61-63°C	Isómero de C-64
C-66		p.f. 70-78°C	
C-67		p.f. 105-106°C	Isómero de C-66

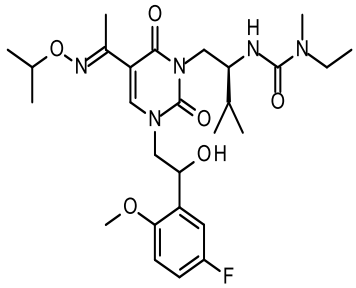
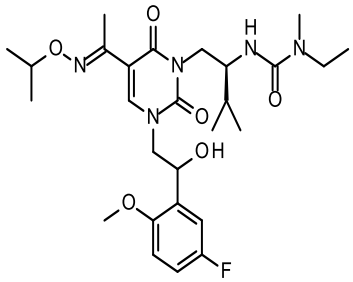
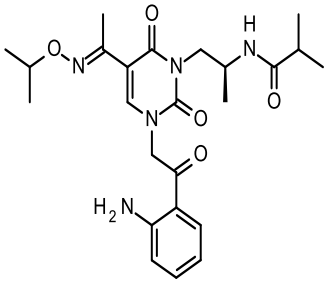
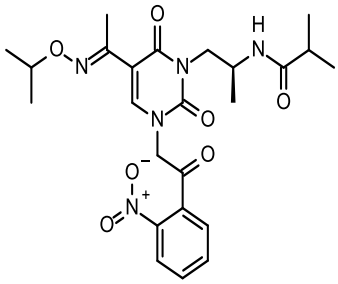
C-68		p.f. 80-81°C	
C-69		p.f. 144-146°C	Isómero de C-68
C-70		p.f. 75-76°C	
C-71		p.f. 71-75°C	Isómero de C-70

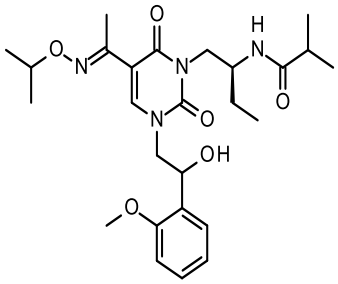
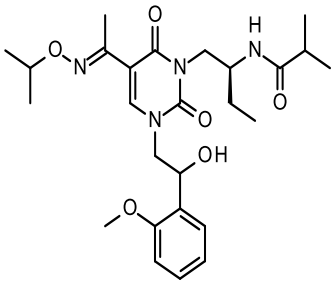
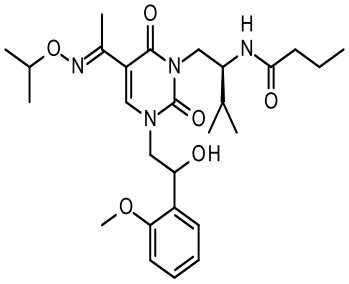
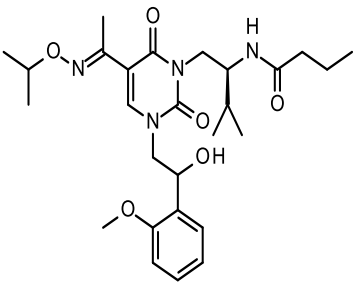
C-72		p.f. 51-52°C	
C-73		p.f. 66-69°C	Isómero de C-72
C-74		p.f. 52-53°C	
C-75		p.f. 64-65°C	Isómero de C-74

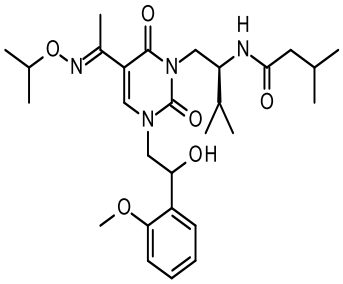
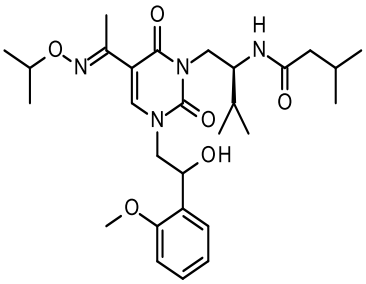
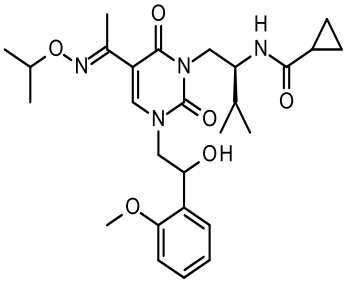
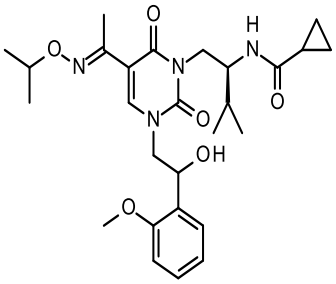
C-76		aceite viscoso	
C-77		aceite viscoso	Isómero de C-76
C-78		amorfo	
C-79		p.f. 129-131°C	Isómero de C-78

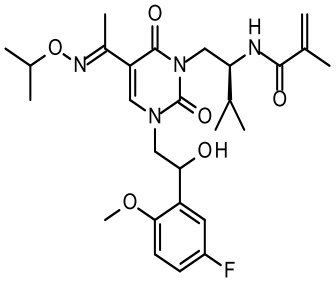
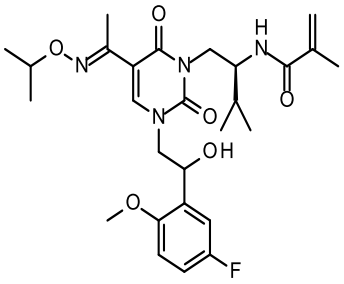
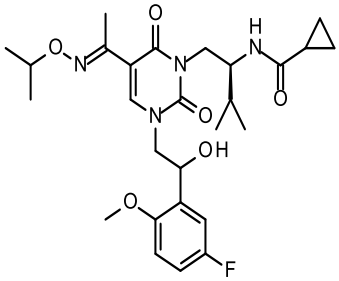
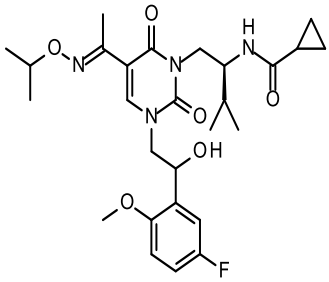
C-80		p.f. 60-63°C	
C-81		p.f. 64-67°C	Isómero de C-80
C-82		p.f. 59-60°C	
C-83		p.f. 55-57°C	Isómero de C-82

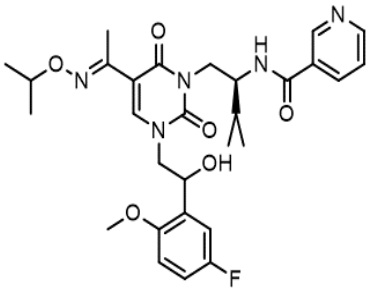
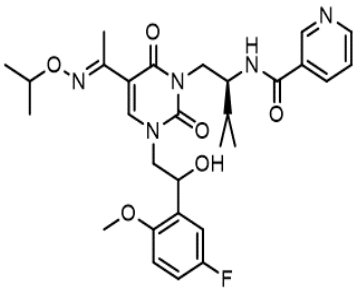
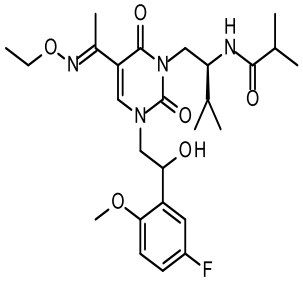
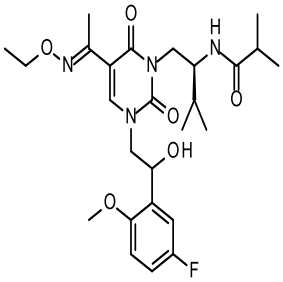
C-84		p.f. 160-162°C	
C-85		aceite viscoso	Isómero de C-84
C-86		p.f. 165-167°C	
C-87		amorfo	Isómero de C-86

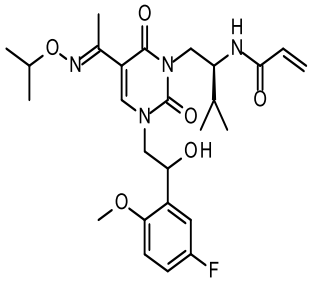
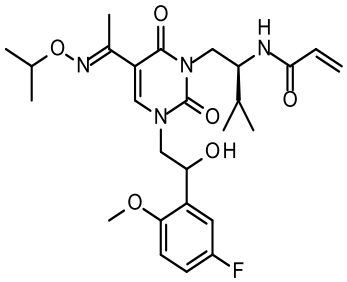
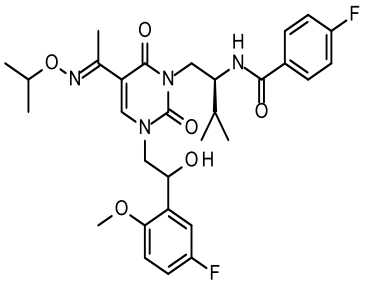
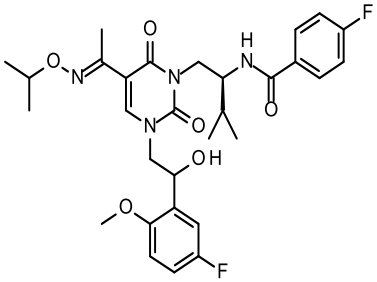
C-88		p.f. 60-63°C	
C-89		p.f. 126-130°C	Isómero de C-88
C-90		p.f. 91-96°C	
C-91		p.f. 202-203°C	

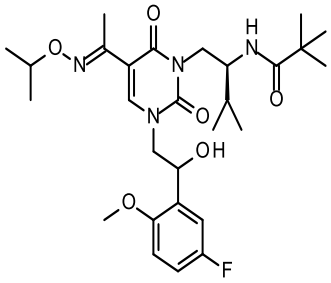
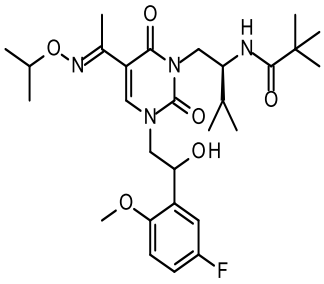
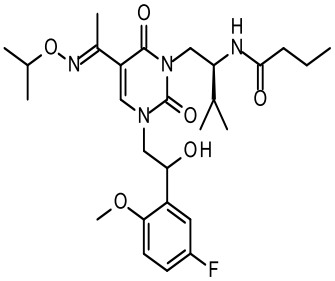
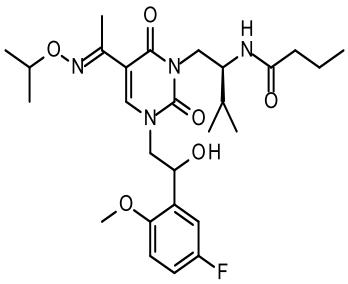
C-92		p.f. 121-122°C	
C-93		p.f. 130-131°C	Isómero de C-92
C-94		aceite viscoso	
C-95		aceite viscoso	Isómero de C-94

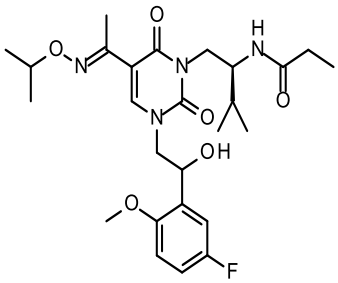
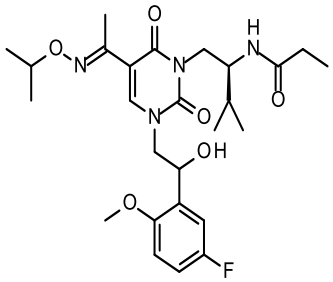
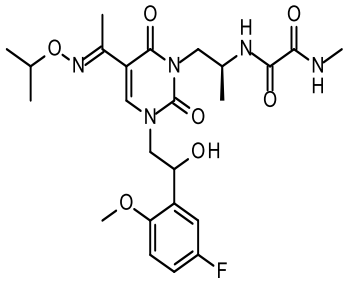
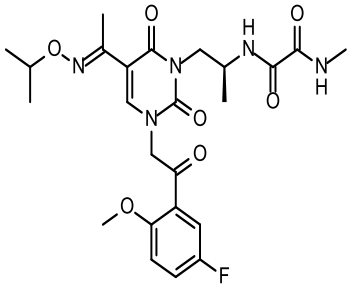
C-96		p.f. 133-135°C	
C-97		amorfo	Isómero de C-96
C-98		p.f. 139-141°C	
C-99		p.f. 132-134°C	Isómero de C-98

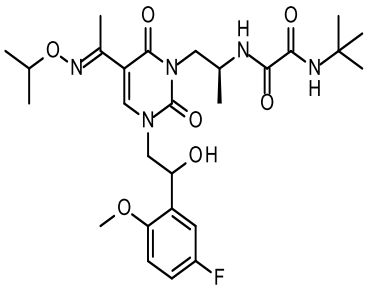
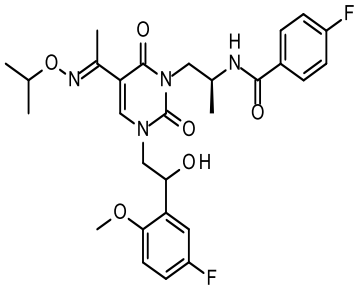
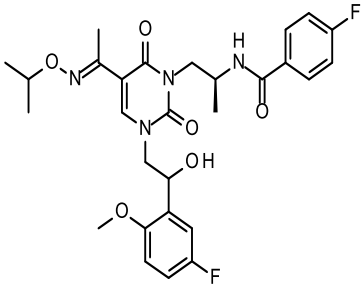
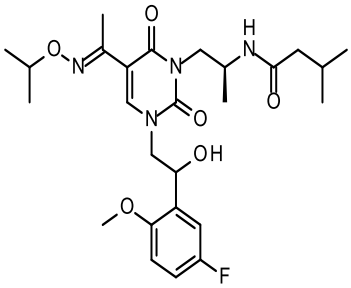
C-100		p.f. 70-72°C	
C-101		p.f. 129-130°C	Isómero de C-100
C-102		p.f. 82-83°C	
C-103		p.f. 84-86°C	Isómero de C-102

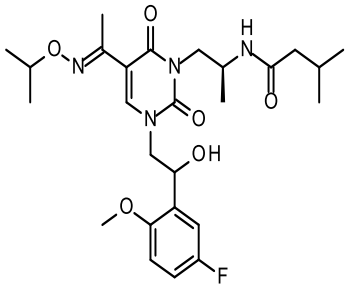
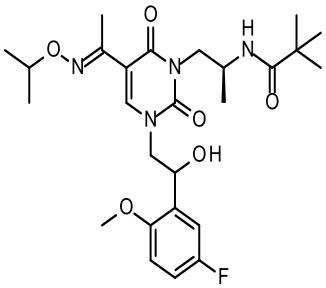
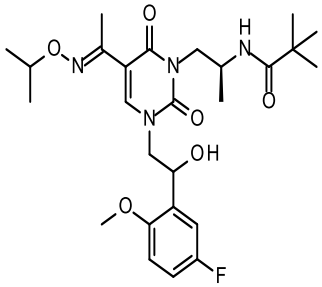
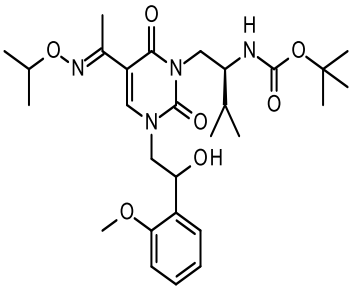
C-104		p.f. 77-79°C	
C-105		p.f. 77-78°C	Isómero de C-104
C-106		p.f. 71-73°C	
C-107		p.f. 67-68°C	Isómero de C-106

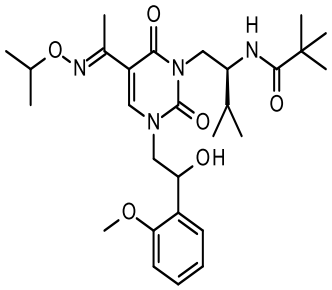
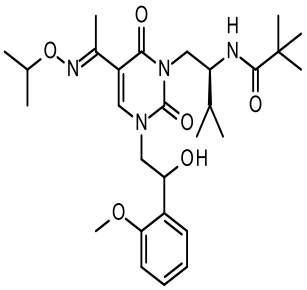
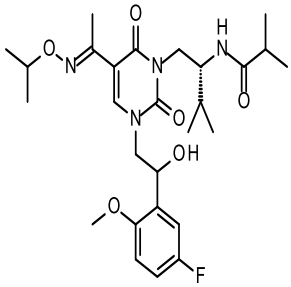
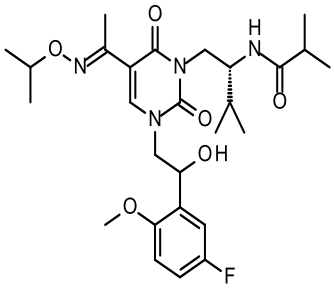
C-108		p.f. 85-86°C	
C-109		p.f. 88-89°C	Isómero de C-108
C-110		p.f. 75-76°C	
C-111		p.f. 80-81°C	Isómero de C-110

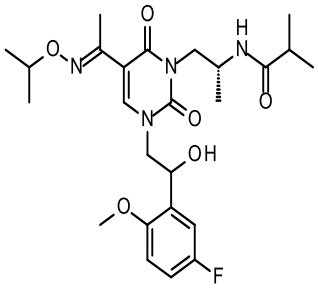
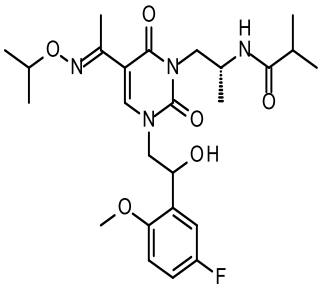
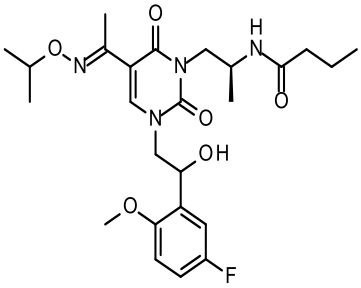
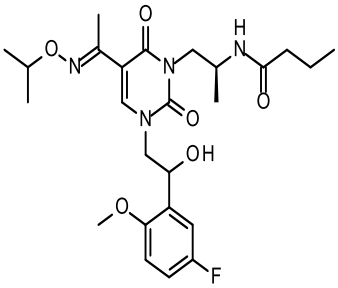
C-112		p.f. 69-70°C	
C-113		p.f. 70-73°C	Isómero de C-112
C-114		p.f. 56-57°C	
C-115		p.f. 128-129°C	Isómero de C-114

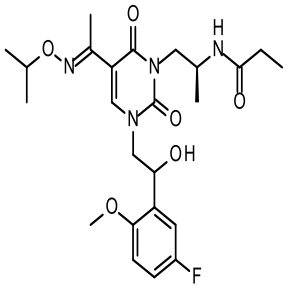
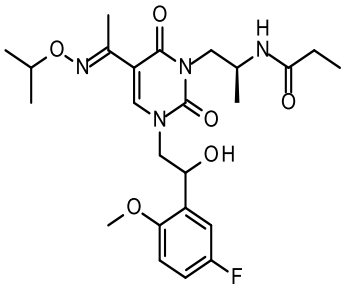
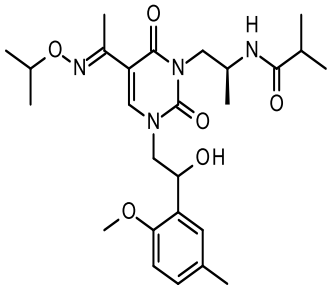
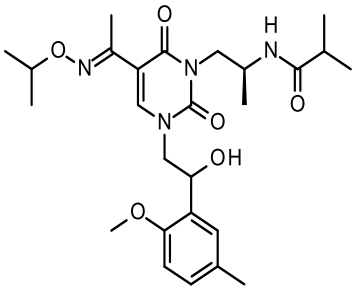
C-116		p.f. 62-63°C	
C-117		p.f. 76-77°C	Isómero de C-116
C-118		p.f. 91-92°C	
C-119		p.f. 171-172°C	

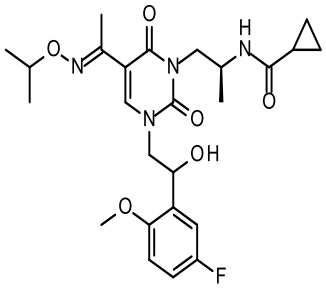
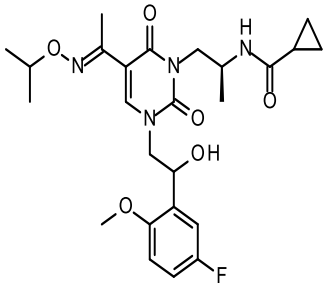
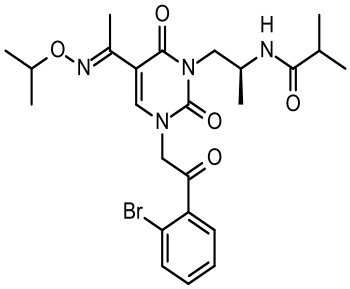
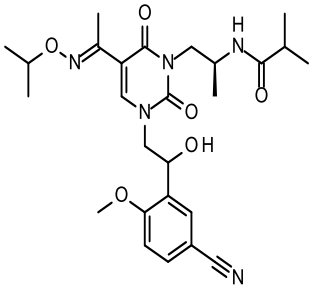
C-120		p.f. 72-73°C	
C-121		p.f. 73-75°C	
C-122		p.f. 92-93°C	Isómero de C-121
C-123		p.f. 65-68°C	

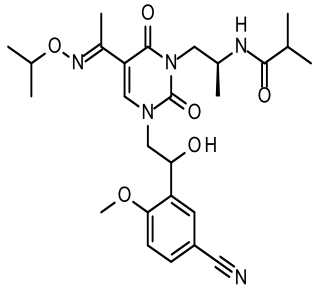
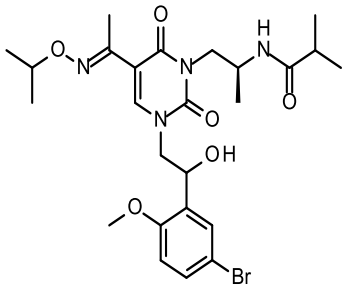
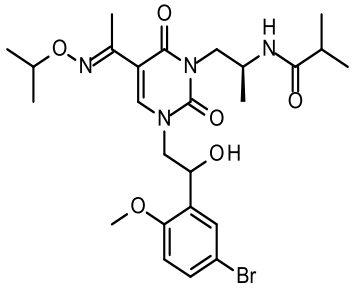
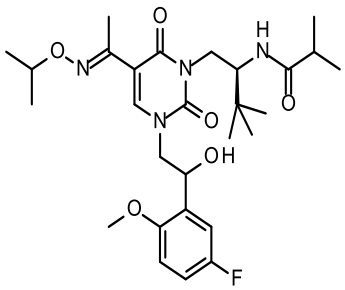
C-124		p.f. 69-71°C	Isómero de C-123
C-125		p.f. 81-82°C	
C-126		p.f. 83-84°C	Isómero de C-125
C-127		amorfo	

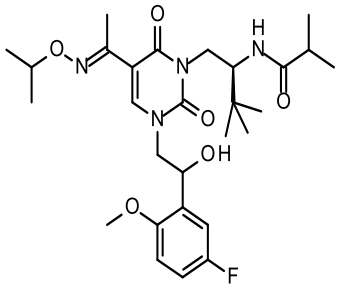
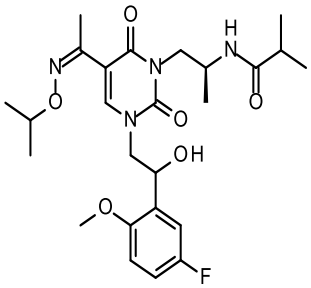
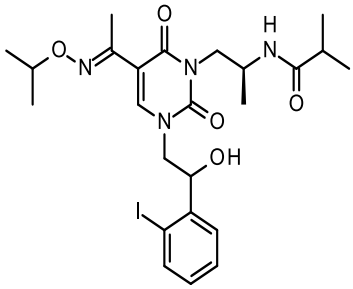
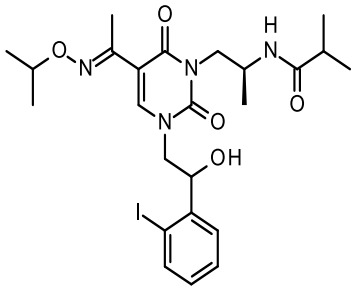
C-128		aceite viscoso	
C-129		aceite viscoso	Isómero de C-128
C-130		amorfo	
C-131		aceite viscoso	Isómero de C-130

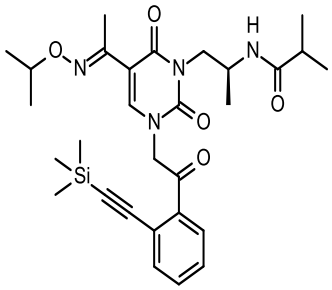
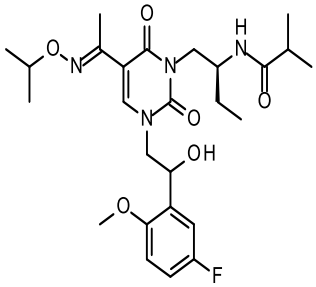
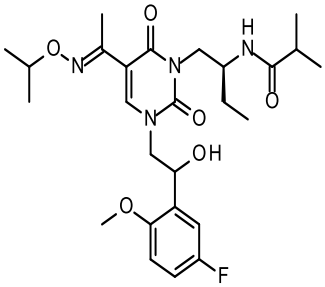
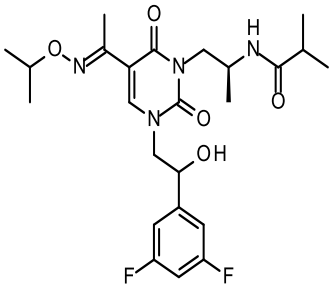
C-132		aceite viscoso	
C-133		aceite viscoso	Isómero de C-132
C-134		p.f. 83-86°C	
C-135		p.f. 126-129°C	Isómero de C-134

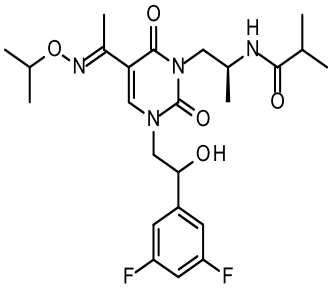
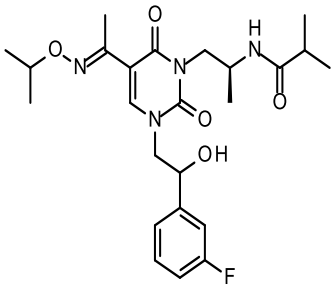
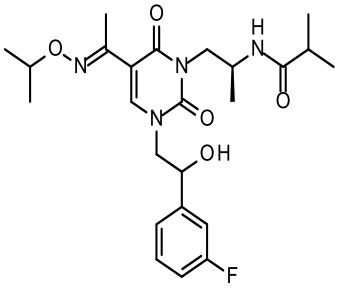
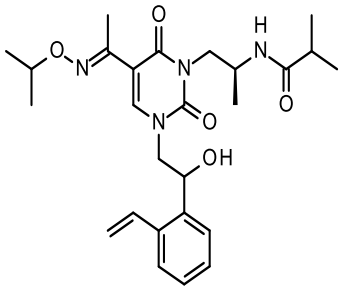
C-136		aceite viscoso	
C-137		p.f. 140-141°C	Isómero de C-136
C-138		p.f. 76-79°C	
C-139		p.f. 81-83°C	Isómero de C-138

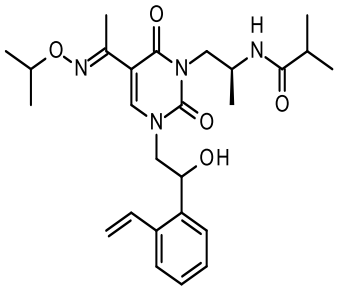
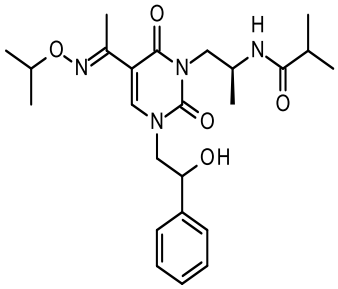
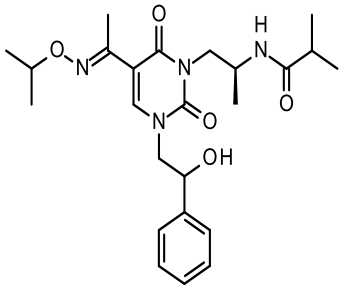
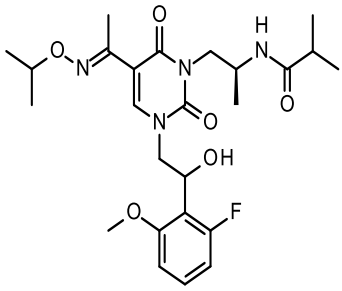
C-140		p.f. 81-84°C	
C-141		p.f. 131-132°C	Isómero de C-140
C-142		p.f. 163-164°C	
C-143		p.f. 113-117°C	

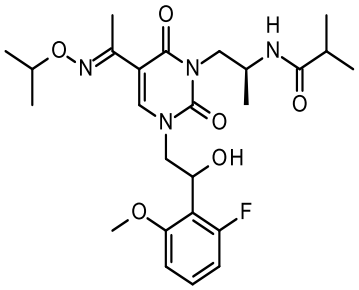
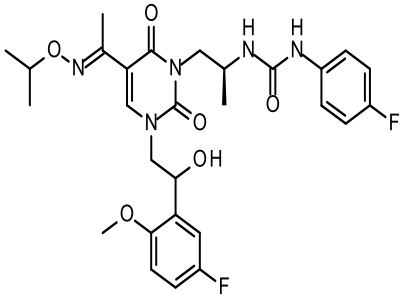
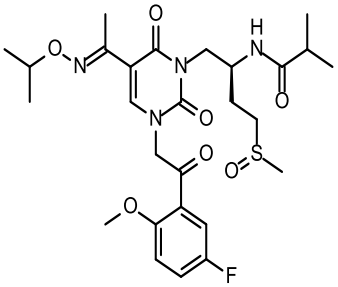
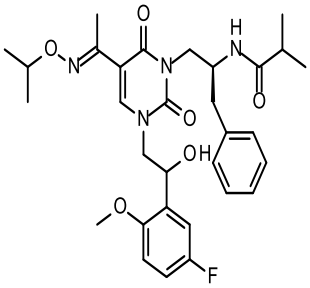
C-144		p.f. 148-149°C	Isómero de C-143
C-145		p.f. 82-83°C	
C-146		p.f. 129-130°C	Isómero de C-145
C-147		p.f. 70-71°C	

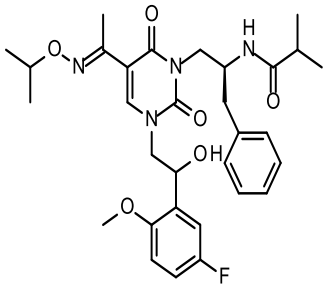
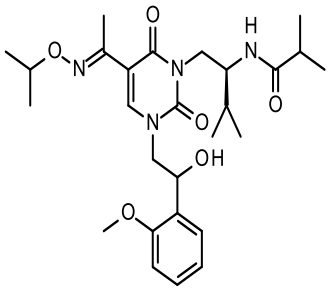
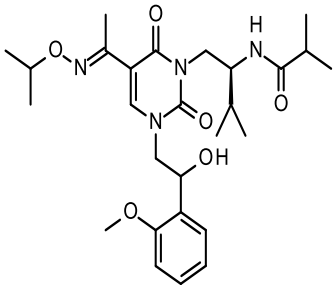
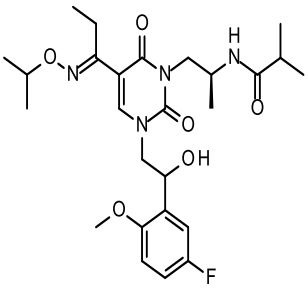
C-148		p.f. 111-112°C	Isómero de C-147
C-149		aceite viscoso	
C-150		p.f. 120-121°C	
C-151		p.f. 100-101°C	Isómero de C-150

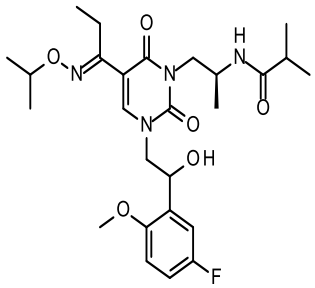
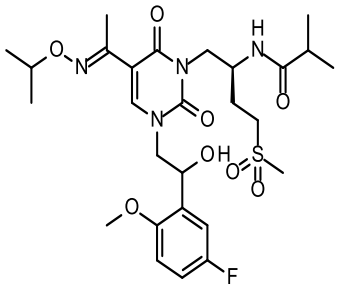
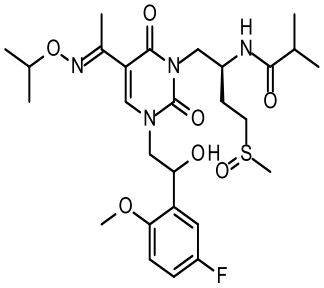
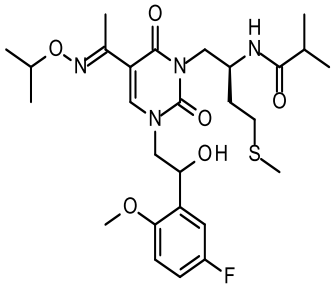
C-152		p.f. 72-73°C	
C-153		aceite viscoso	
C-154		p.f. 120-121°C	Isómero de C-153
C-155		p.f. 154-155°C	

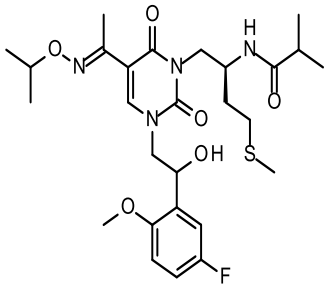
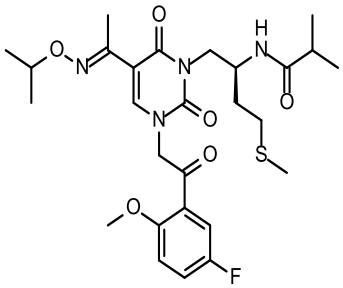
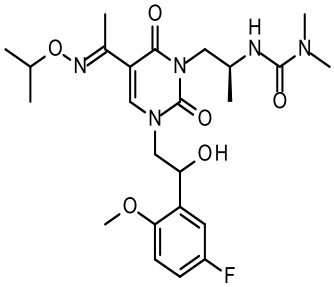
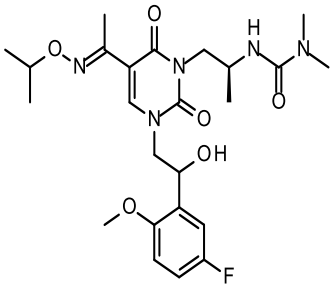
C-156		p.f. 93-94°C	Isómero de C-155
C-157		p.f. 156-157°C	
C-158		p.f. 97-98°C	Isómero de C-157
C-159		p.f. 157-158°C	

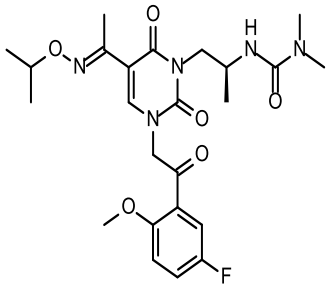
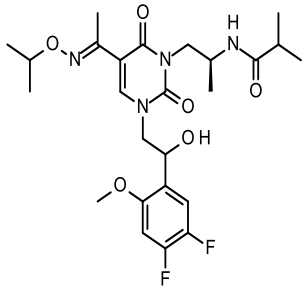
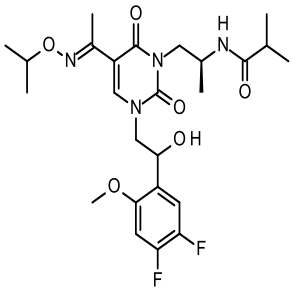
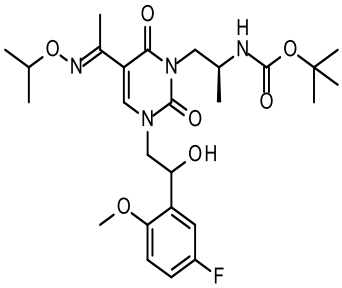
C-160		p.f. 134-135°C	Isómero de C-159
C-161		p.f. 161-162°C	
C-162		p.f. 120-121°C	Isómero de C-161
C-163		aceite viscoso	

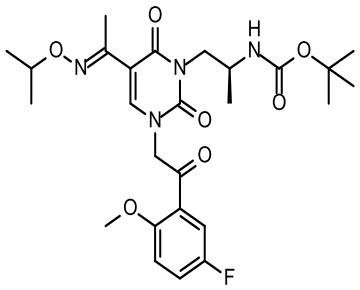
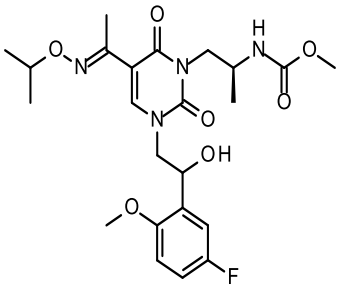
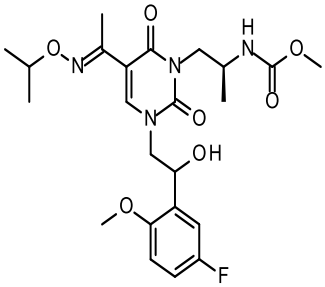
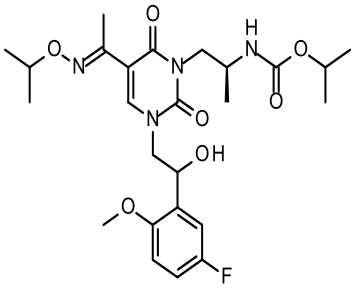
C-164		aceite viscoso	Isómero de C-163
C-165		p.f. 97-99°C	
C-166		p.f. 123-125°C	
C-167		p.f. 78-81°C	

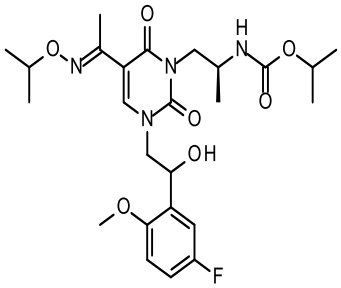
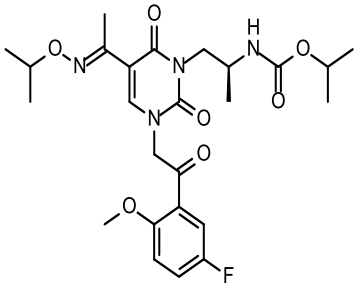
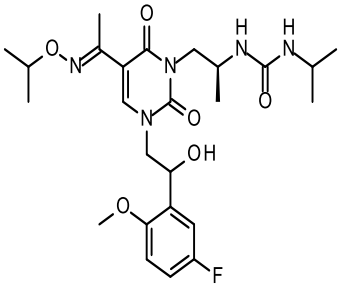
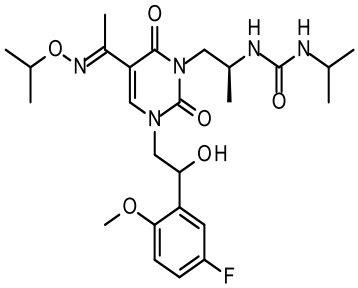
C-168		p.f. 96-100°C	Isómero de C-167
C-169		p.f. 145-146°C	
C-170		p.f. 86-88°C	Isómero de C-169
C-171		p.f. 70-71°C	

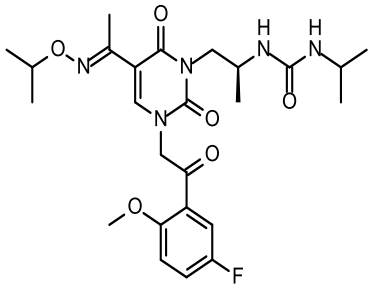
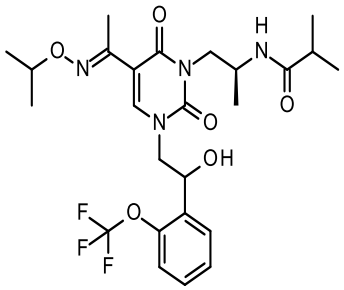
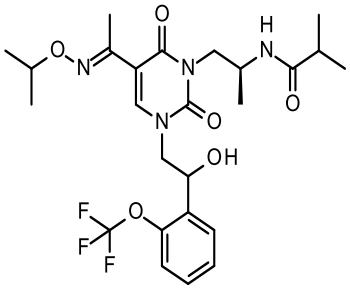
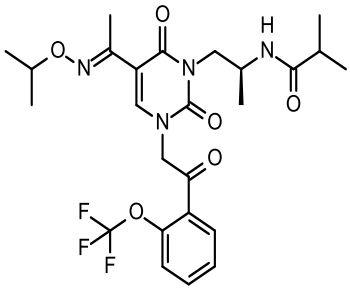
C-172		p.f. 69-70°C	Isómero de C-171
C-173		p.f. 82-85°C	
C-174		p.f. 78-81°C	
C-175		p.f. 119-120°C	

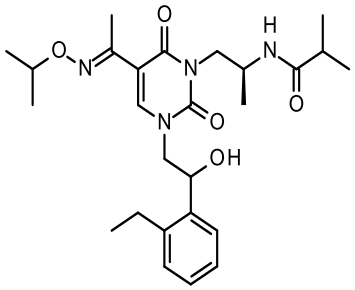
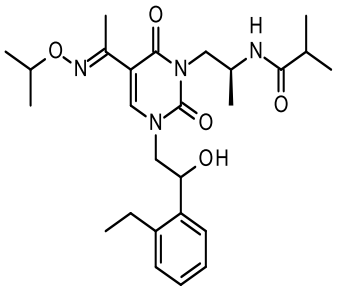
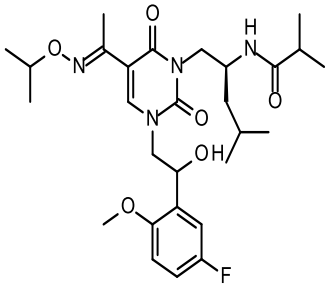
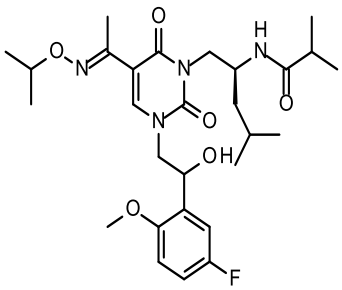
C-176		p.f. 104-108°C	Isómero de C-175
C-177		p.f. 100-101°C	
C-178		p.f. 71-72°C	
C-179		p.f. 83-84°C	Isómero de C-178

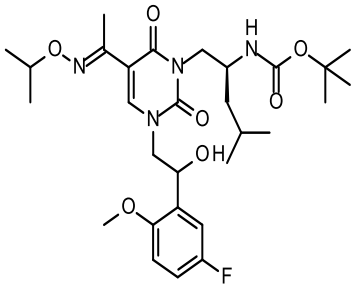
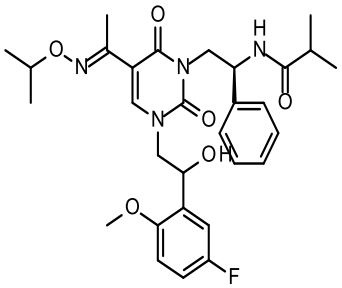
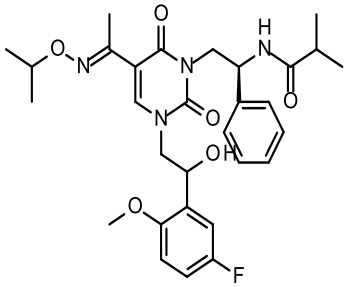
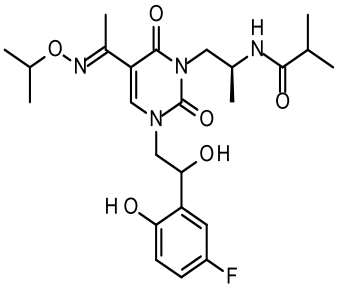
C-180		p.f. 73-74°C	
C-181		p.f. 72-73°C	
C-182		p.f. 81-82°C	Isómero de C-181
C-183		aceite viscoso	

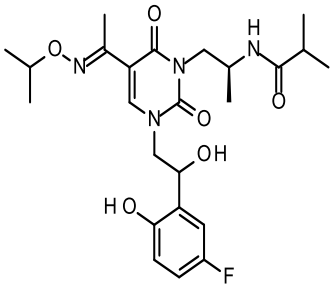
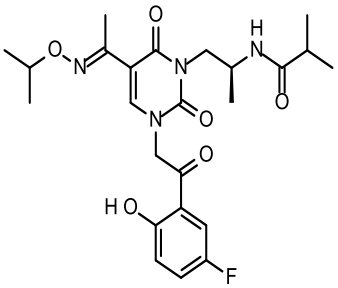
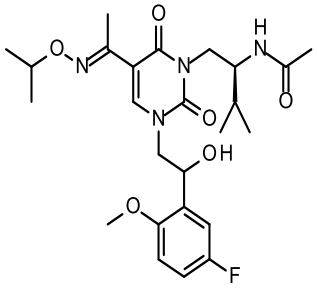
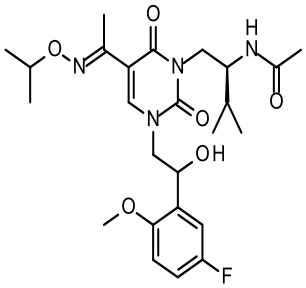
C-184		p.f. 138-139°C	
C-185		aceite viscoso	
C-186		p.f. 117-118°C	Isómero de C-185
C-187		aceite viscoso	

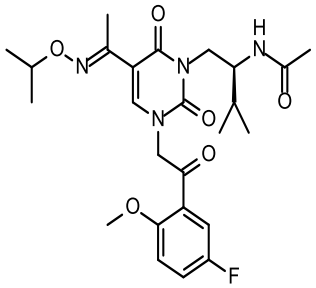
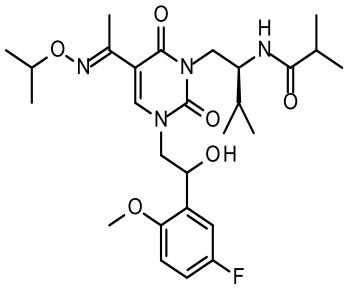
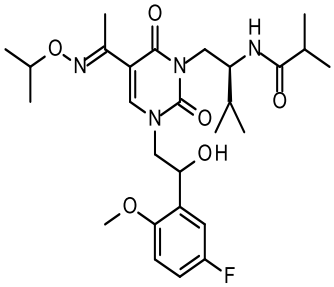
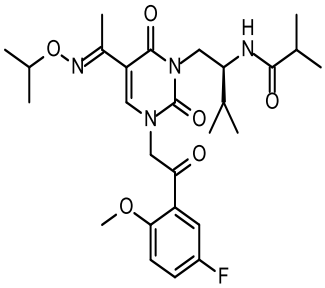
C-188		aceite viscoso	Isómero de C-187
C-189		p.f. 118-119°C	
C-190		p.f. 89-90°C	
C-191		p.f. 176-177°C	Isómero de C-190

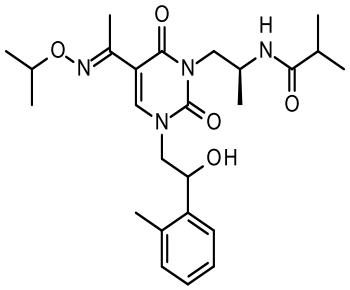
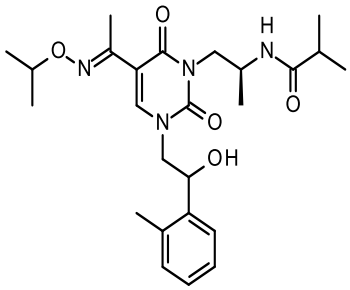
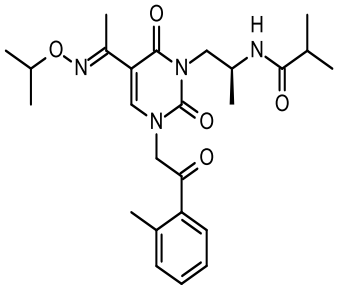
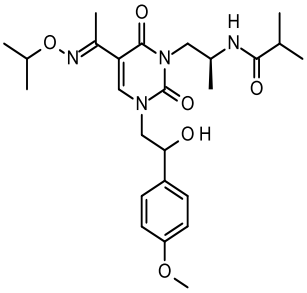
C-192		p.f. 162-163°C	
C-193		aceite viscoso	
C-194		p.f. 105-110°C	Isómero de C-193
C-195		p.f. 159-160°C	

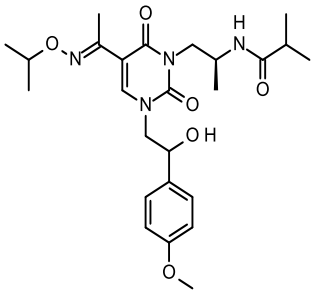
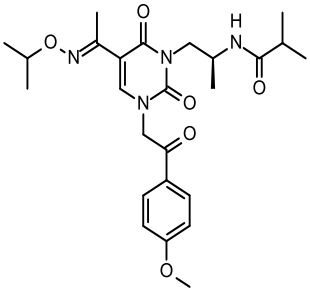
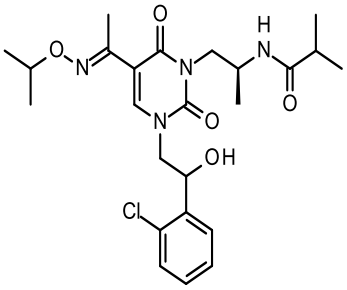
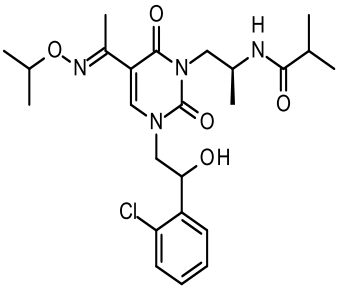
C-196		p.f. 147-148°C	
C-197		aceite viscoso	Isómero de C-196
C-198		aceite viscoso	
C-199		aceite viscoso	Isómero de C-198

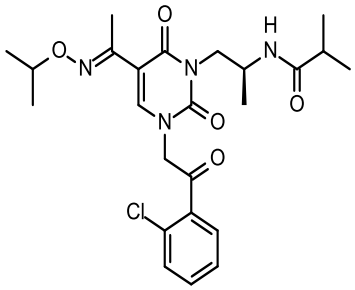
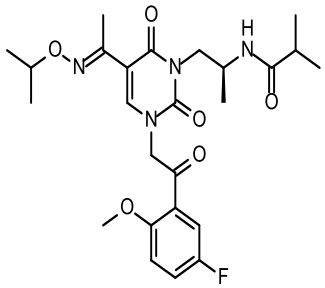
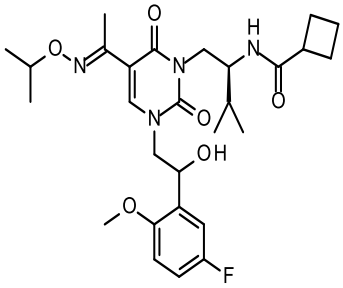
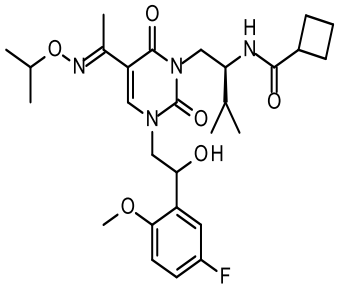
C-200		aceite viscoso	
C-201		p.f. 81-85°C	
C-202		p.f. 161-162°C	Isómero de C-201
C-203		p.f. 101-102°C	

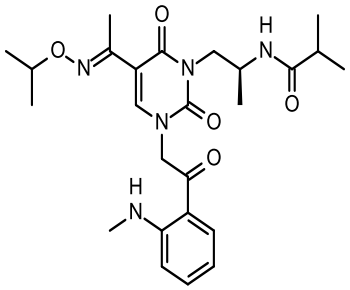
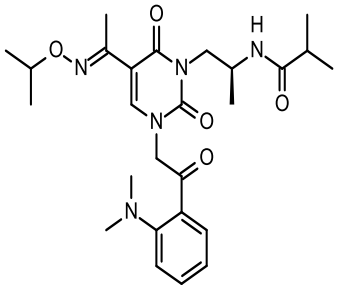
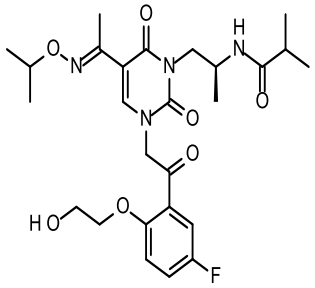
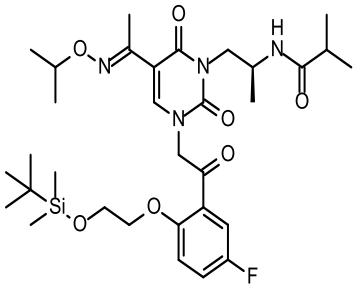
C-204		aceite viscoso	Isómero de C-203
C-205		p.f. 95-99°C	
C-206		aceite viscoso	
C-207		p.f. 73-74°C	Isómero de C-206

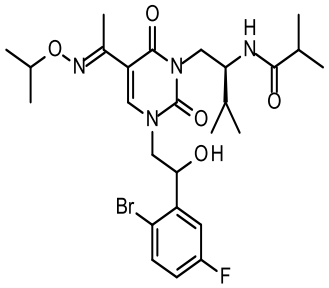
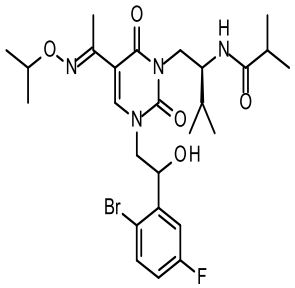
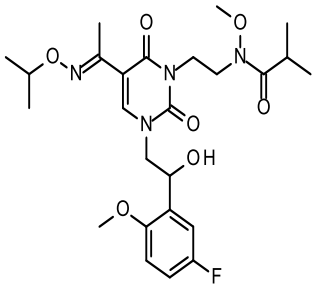
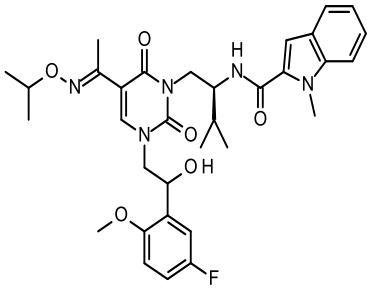
C-208		p.f. 147-148°C	
C-209		aceite viscoso	
C-210		p.f. 91-92°C	Isómero de C-209
C-211		p.f. 131-132°C	

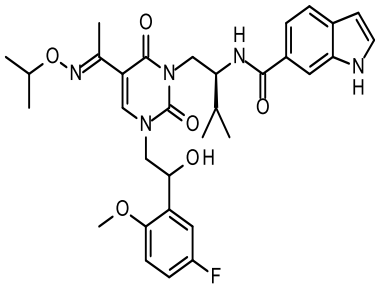
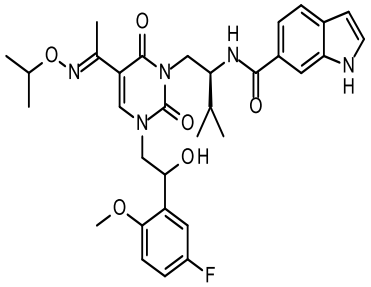
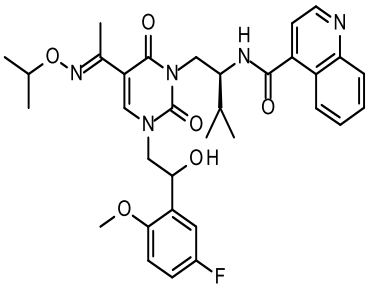
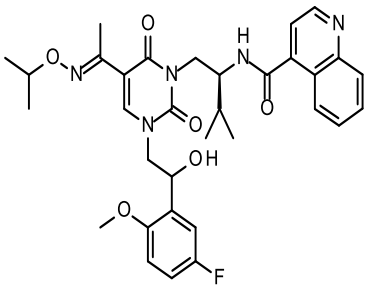
C-212		p.f. 176-177°C	
C-213		p.f. 89-90°C	Isómero de C-212
C-214		p.f. 150-151°C	
C-215		p.f. 117-118°C	

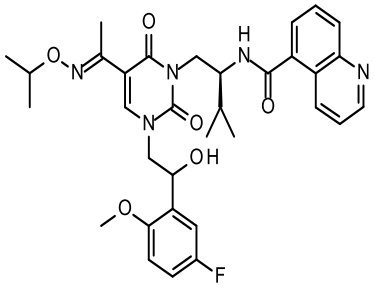
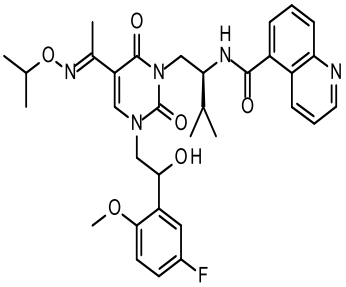
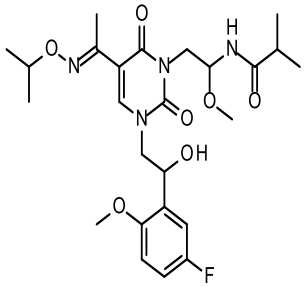
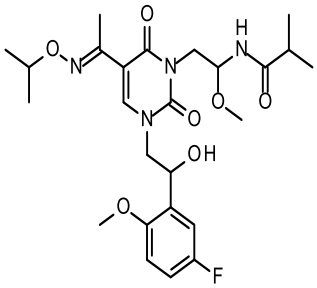
C-216		p.f. 75-76°C	Isómero de C-215
C-217		p.f. 68-70°C	
C-218		p.f. 176-177°C	
C-219		p.f. 123-124°C	Isómero de C-218

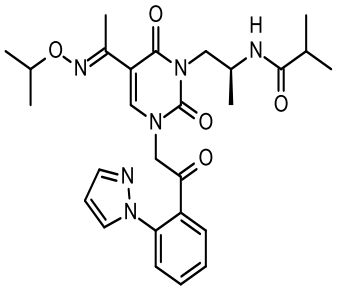
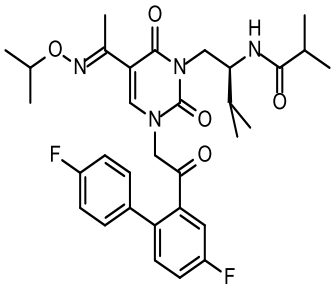
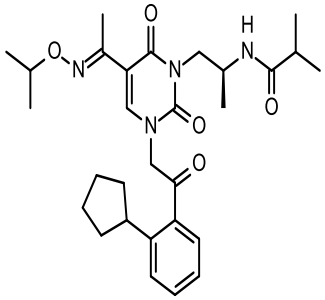
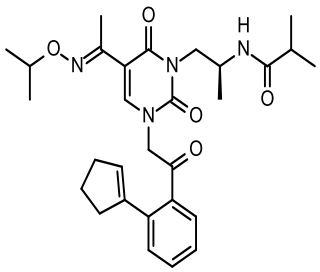
C-220		p.f. 142-143°C	
C-221		p.f. 129-130°C	
C-222		p.f. 66-67°C	
C-223		p.f. 70-71°C	Isómero de C-222

C-224		p.f. 197-201°C	
C-225		p.f. 157-163°C	
C-226		p.f. 78-80°C	
C-227		p.f. 53-56°C	

C-228		p.f. 88-90°C	
C-229		p.f. 92-94°C	Isómero de C-228
C-230		p.f. 57-58°C	
C-231		p.f. 127-128°C	

C-232		p.f. 97-98°C	
C-233		p.f. 90-92°C	Isómero de C-232
C-234		p.f. 120-122°C	
C-235		p.f. 101-102°C	Isómero de C-234

C-236		p.f. 124-125°C	
C-237		p.f. 116-117°C	Isómero de C-236
C-238		p.f. 97-100°C	
C-239		p.f. 89-91°C	Isómero de C-238

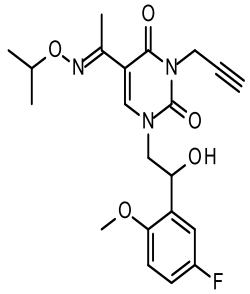
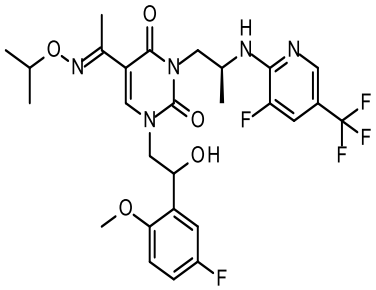
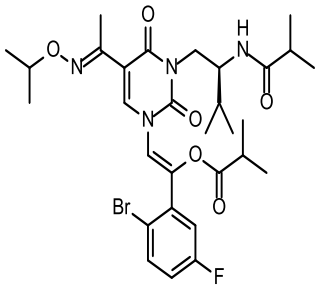
C-240		p.f. 206-210°C	
C-241		p.f. 179-180°C	
C-242		aceite viscoso	
C-243		aceite viscoso	

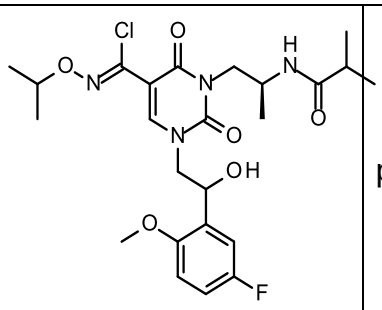
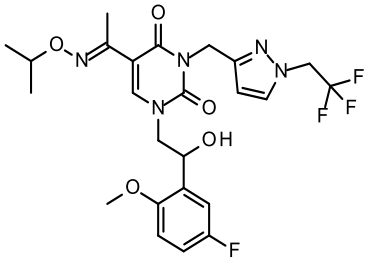
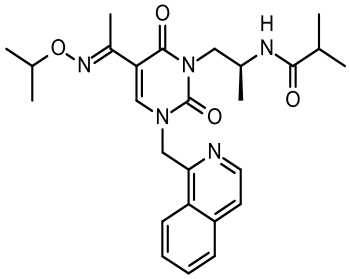
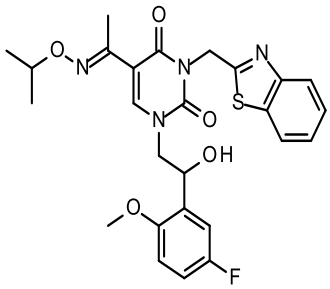
[0297]

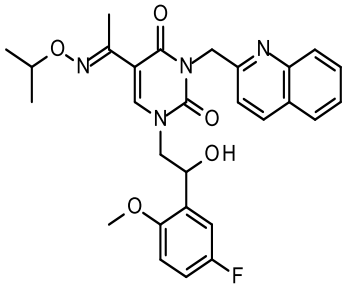
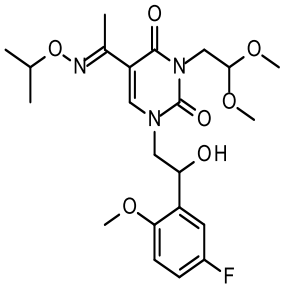
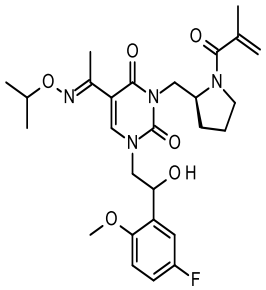
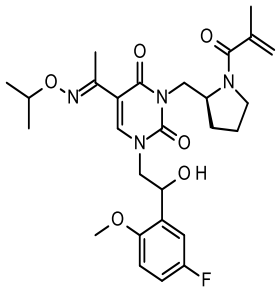
Además, algunos de los compuestos de la presente invención producidos de la misma manera que en los Ejemplos descritos anteriormente se muestran en la Tabla 7. En la tabla, el punto de fusión (p.f.) también se muestra como propiedades físicas de cada compuesto.

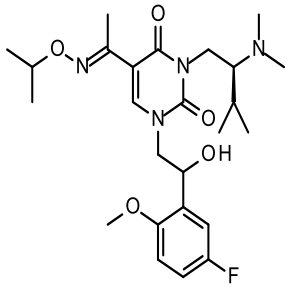
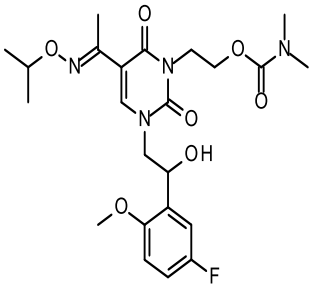
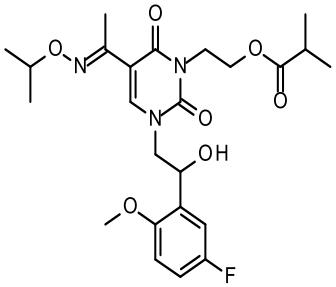
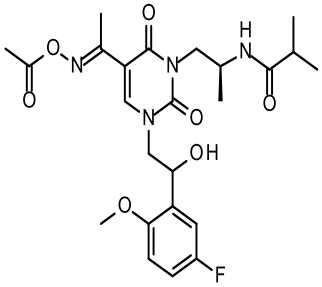
Cuando el compuesto es un estereoisómero, se indica en las observaciones.

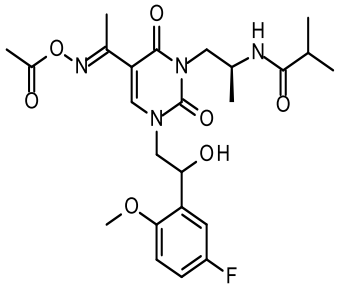
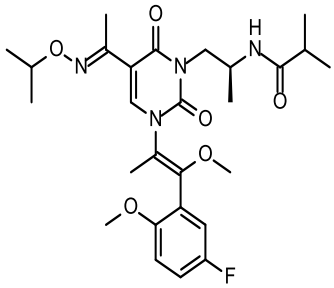
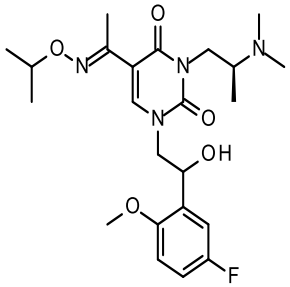
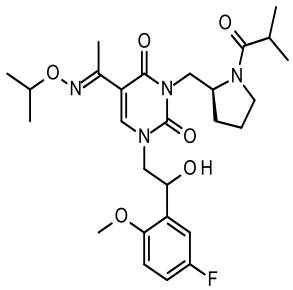
Tabla 7

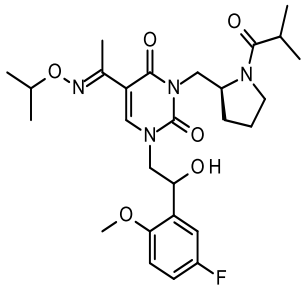
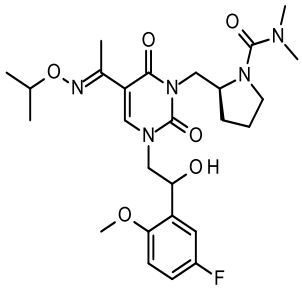
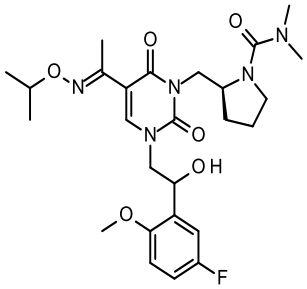
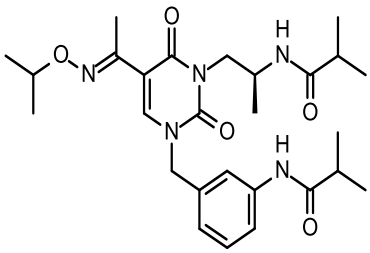
Número de compuesto	Fórmula estructural	Propiedades físicas	Observaciones
D-1		p.f. 127-131°C	
D-2		aceite viscoso	
D-3		aceite viscoso	

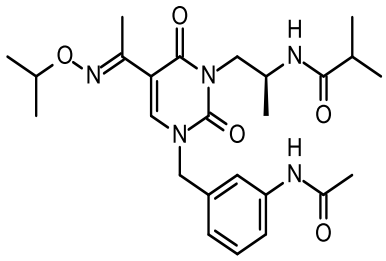
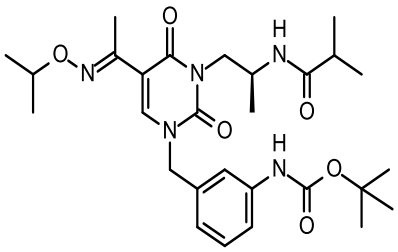
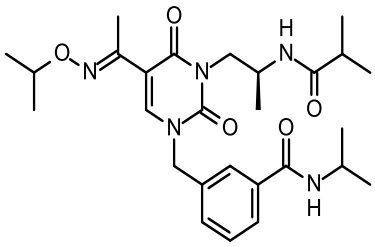
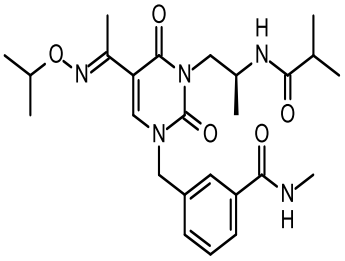
D-4		p.f. 69-74°C	
D-5		amorfo	
D-6		p.f. 174-175°C	
D-7		p.f. 97-99°C	

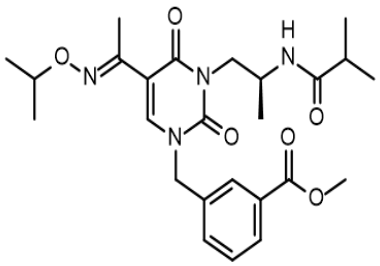
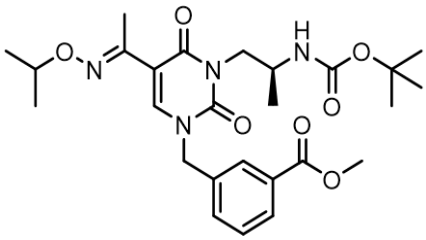
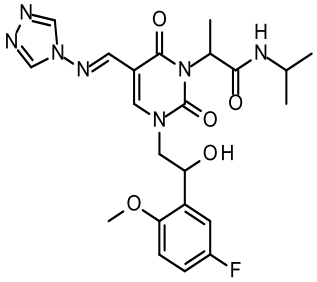
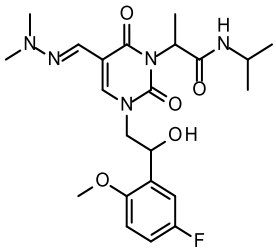
D-8		p.f. 93-95°C	
D-9		aceite viscoso	
D-10		p.f. 53-56°C	
D-11		p.f. 62-63°C	Isómero de D-10

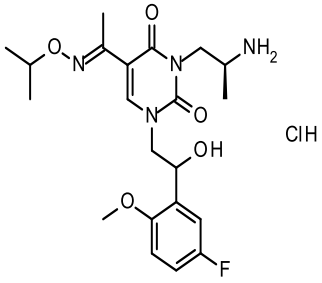
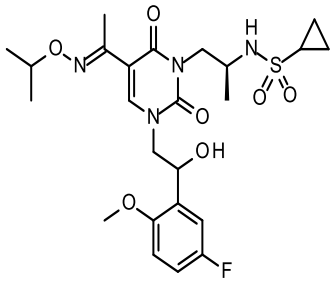
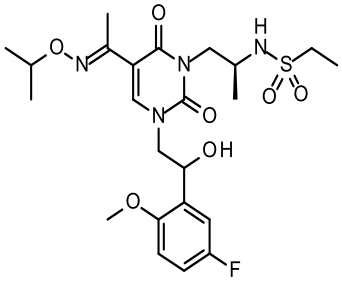
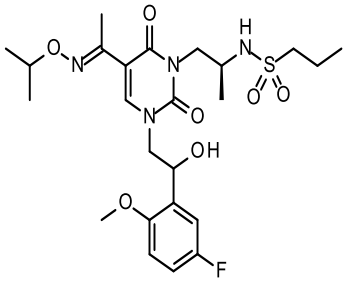
D-12		amorfo	
D-13		aceite viscoso	
D-14		aceite viscoso	
D-15		p.f. 87-88°C	

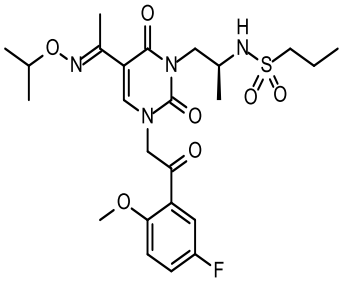
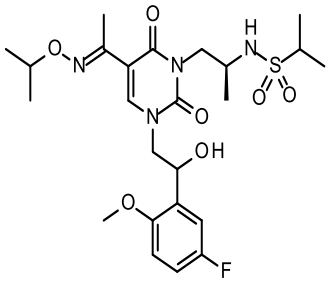
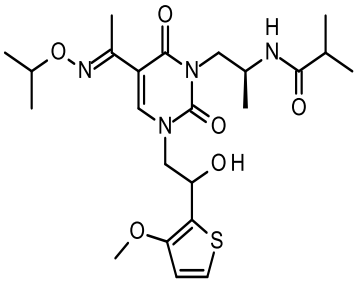
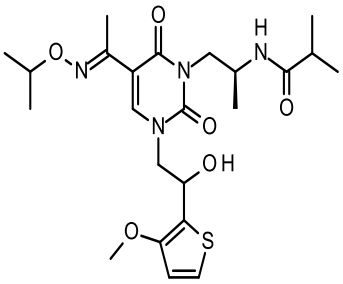
D-16		p.f. 90-91°C	Isómero de D-15
D-17		p.f. 60-61°C	
D-18		amorfo	
D-19		amorfo	

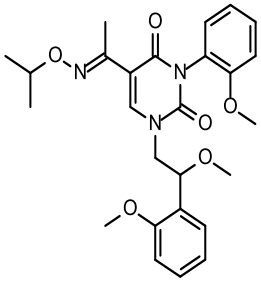
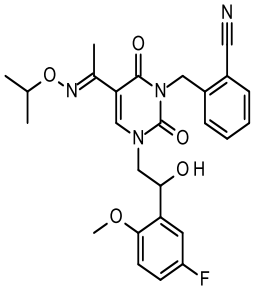
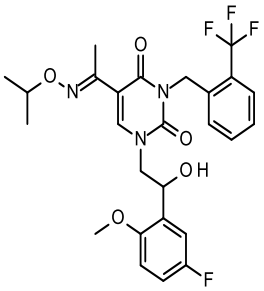
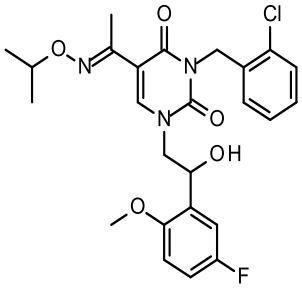
D-20		amorfo	Isómero de D-19
D-21		p.f. 65-66°C	
D-22		p.f. 69-70°C	Isómero de D-21
D-23		p.f. 190-191°C	

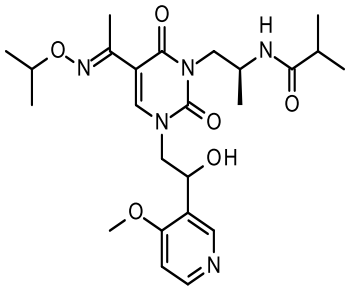
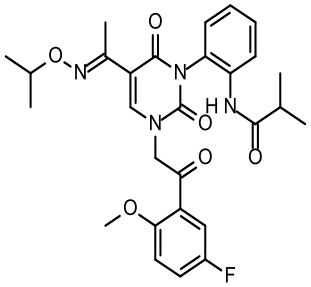
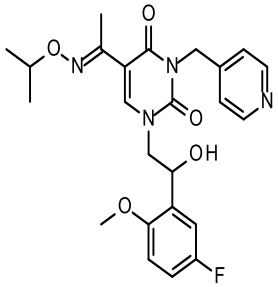
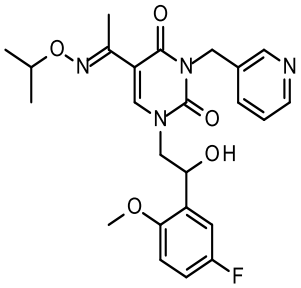
D-24		p.f. 117-119°C	
D-25		p.f. 125-126°C	
D-26		p.f. 219-220°C	
D-27		p.f. 106-113°C	

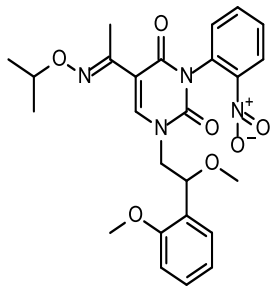
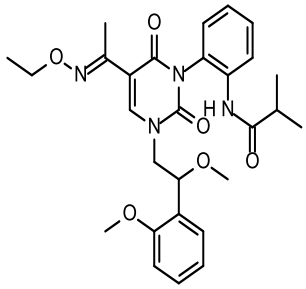
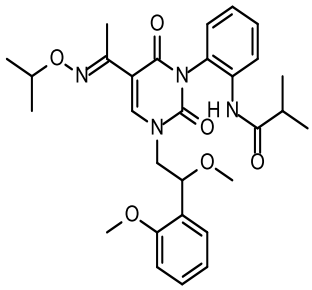
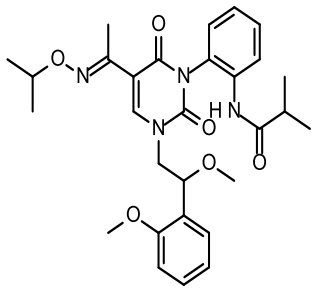
D-28		p.f. 151-152°C	
D-29		aceite viscoso	
D-30		p.f. 274-275°C	
D-31		p.f. 67-68°C	

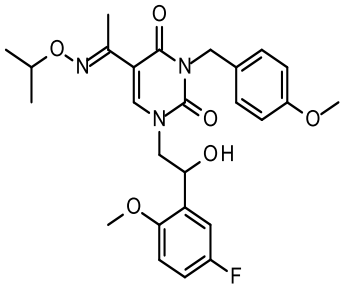
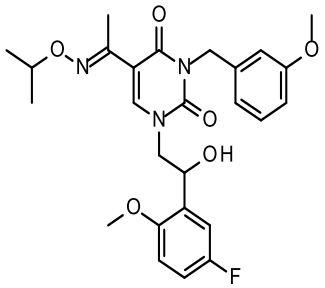
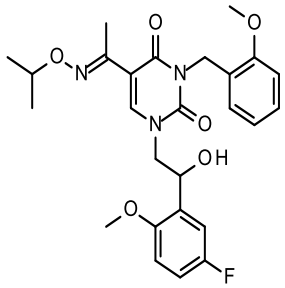
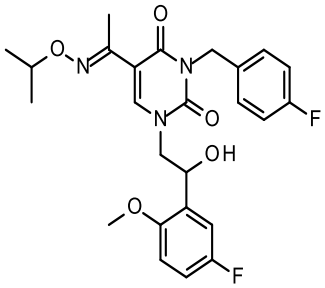
D-32		p.f. 191-192°C	
D-33		p.f. 69-73°C	
D-34		p.f. 62-65°C	
D-35		aceite viscoso	

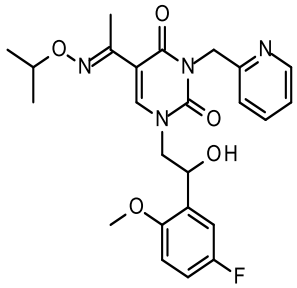
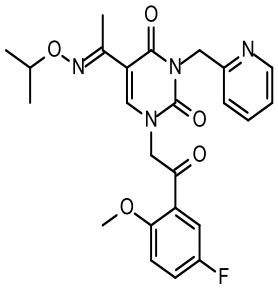
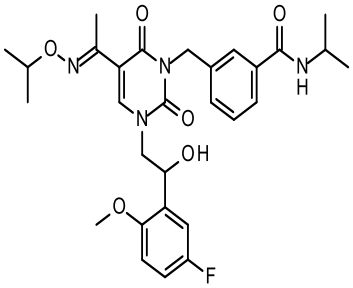
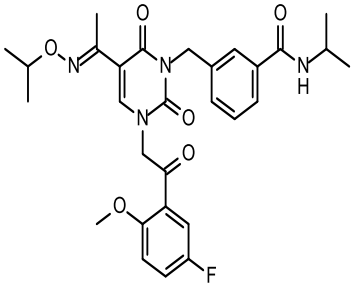
D-36		p.f. 97-98°C	
D-37		aceite viscoso	
D-38		p.f. 71-72°C	
D-39		p.f. 77-78°C	Isómero de D-38

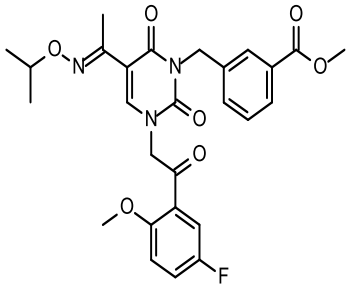
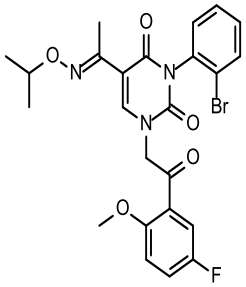
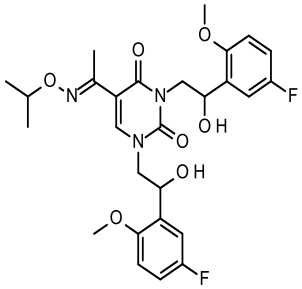
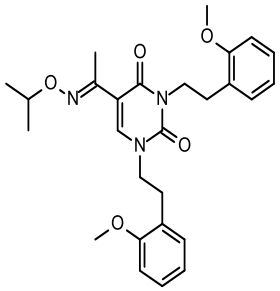
D-40		amorfo	
D-41		p.f. 153-154°C	
D-42		p.f. 162-163°C	
D-43		p.f. 155-156°C	

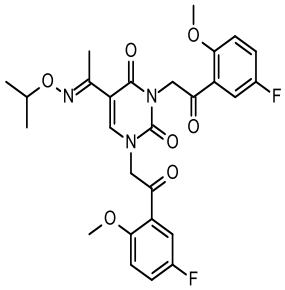
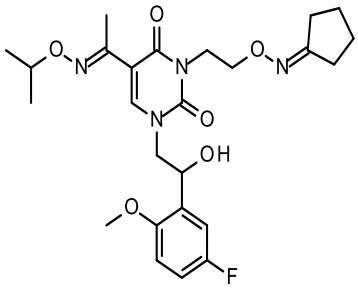
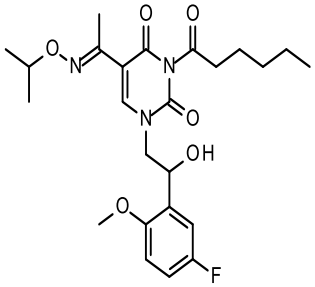
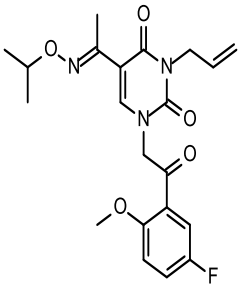
D-44		p.f. 86-92°C	
D-45		p.f. 63-65°C	
D-46		p.f. 102-103°C	
D-47		aceite viscoso	

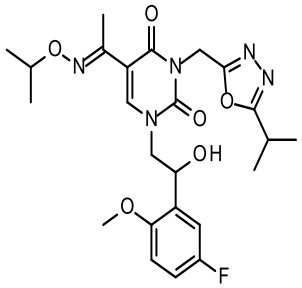
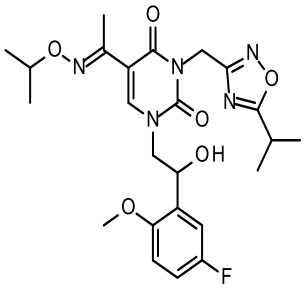
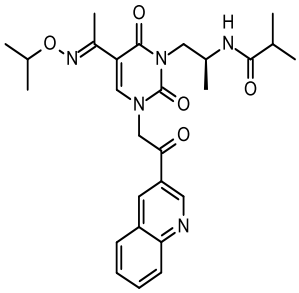
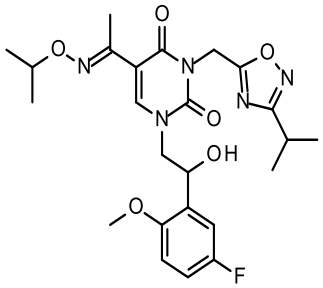
D-48		p.f. 69-70°C	
D-49		p.f. 157-159°C	
D-50		p.f. 142-143°C	
D-51		p.f. 149-150°C	Isómero de D-50

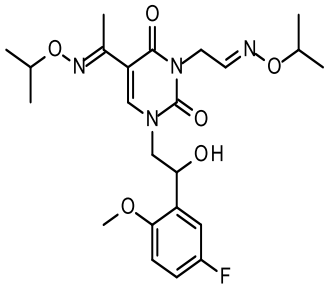
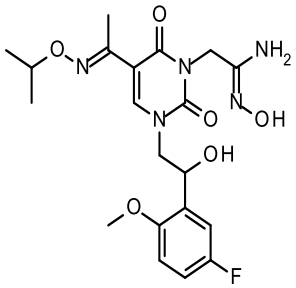
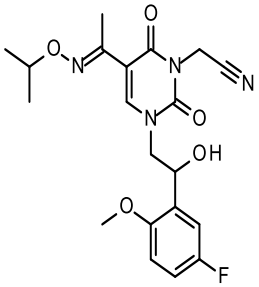
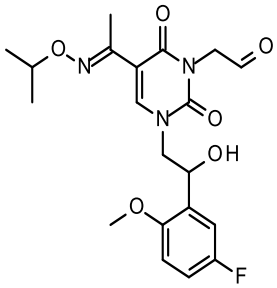
D-52		aceite viscoso	
D-53		p.f. 87-89°C	
D-54		p.f. 132-133°C	
D-55		p.f. 112-113°C	

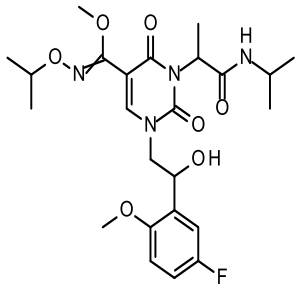
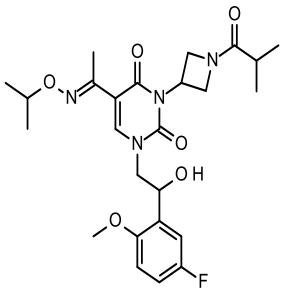
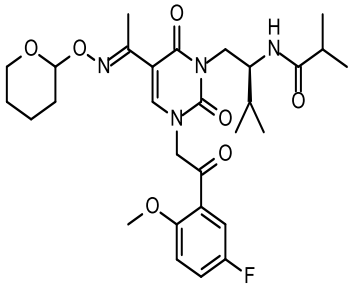
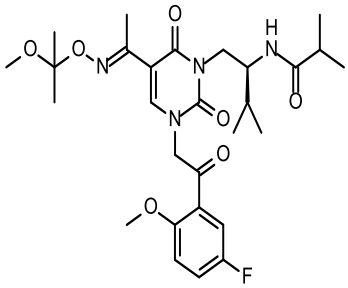
D-56		p.f. 162-163°C	
D-57		aceite viscoso	
D-58		p.f. 81-82°C	
D-59		p.f. 105-106°C	

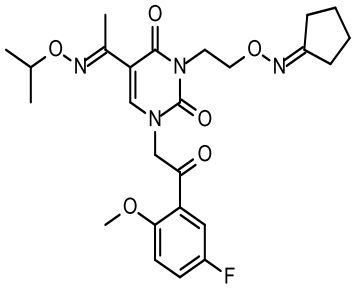
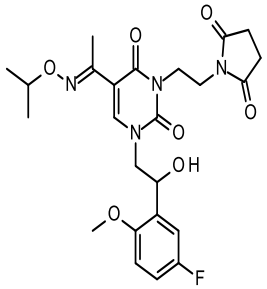
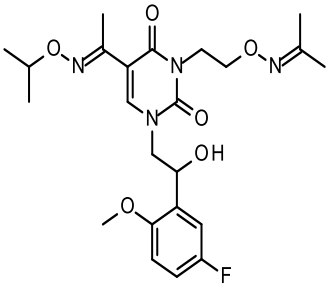
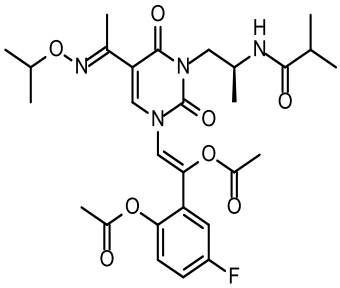
D-60		p.f. 67-70°C	
D-61		p.f. 69-73°C	
D-62		p.f. 60-65°C	
D-63		aceite viscoso	

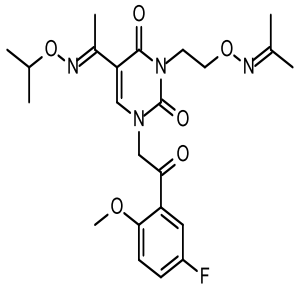
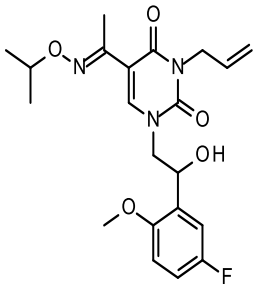
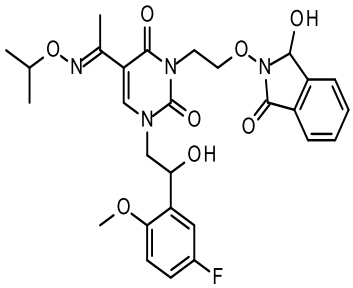
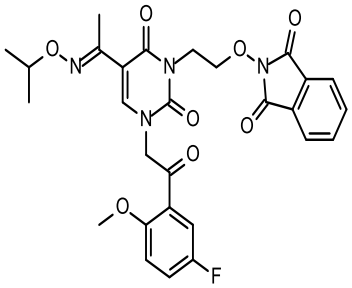
D-64		p.f. 83-84°C	
D-65		aceite viscoso	
D-66		aceite viscoso	
D-67		p.f. 63-66°C	

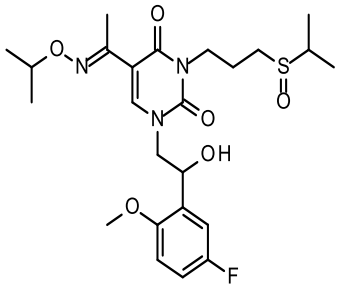
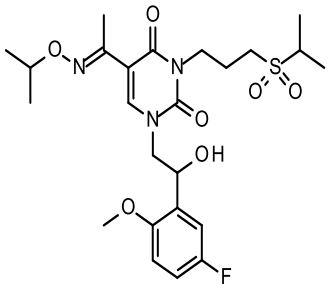
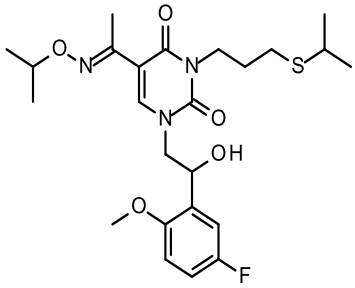
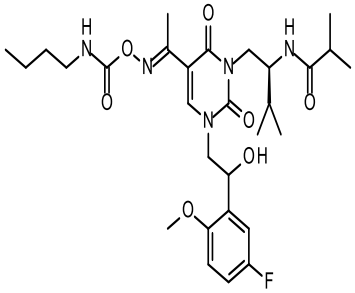
D-68		p.f. 40-45°C	
D-69		p.f. 53-58°C	
D-70		p.f. 85-90°C	
D-71		p.f. 150-151°C	

D-72		p.f. 127-129°C	
D-73		p.f. 192-196°C	
D-74		aceite viscoso	
D-75		p.f. 108-110°C	

D-76		p.f. 84-85°C	
D-77		p.f. 75-76°C	
D-78		p.f. 84-85°C	
D-79		p.f. 87-88°C	

D-80		aceite viscoso	
D-81		p.f. 200-202°C	
D-82		p.f. 110-114°C	
D-83		aceite viscoso	

D-84		aceite viscoso	
D-85		aceite viscoso	
D-86		aceite viscoso	
D-87		amorfo	

D-88		aceite viscoso	
D-89		aceite viscoso	
D-90		aceite viscoso	
D-91		p.f. 68-69°C	

[0298]

Entre los compuestos descritos en las Tablas 6 y 7, para un compuesto que tiene una propiedad de aceite amorfo o viscoso, los datos de RMN de ^{1}H del mismo se muestran en la Tabla 8 a continuación.

Tabla 8

Número de compuesto	RMN
C-3	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,46-6,96(5H, m), 5,68-1,82(14H, m), 2,12(3H, s), 1,32-1,03(18H, m).
C-4	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,53-6,96(4H, m), 7,41(1H, s), 5,75-1,82(14H, m), 2,12(3H, s), 1,32-1,00(18H, m).
C-5	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,54 (1H, dd, *J* = 8,2, 6,9 Hz), 7,40 (1H, s), 6,71 (1H, td, *J* = 8,4, 2,4 Hz), 6,62 (1H, dd, *J* = 10,5, 2,3 Hz), 5,77 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,18-5,14 (1H, m), 4,57-4,47 (2H, m), 4,38-4,32 (1H, m), 4,18 (1H, dd, *J* = 13,3, 11,0 Hz), 4,14-4,08 (1H, m), 3,90 (1H, dd, *J* = 14,0, 2,5 Hz), 3,86 (3H, s), 3,84 (1H, dd, *J* = 8,7, 3,2 Hz), 2,21 (1H, td, *J* = 13,5, 6,6 Hz), 2,14 (3H, s), 1,27 (6H, dd, *J* = 6,2, 1,6 Hz), 1,23 (3H, d, *J* = 6,9 Hz), 1,04 (6H, dd, *J* = 13,1, 7,1 Hz).
C-8	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,63 (2H, t, *J* = 7,3 Hz), 7,52-7,48 (2H, m), 7,38 (1H, dd, *J* = 8,7, 7,3 Hz), 6,65-6,62 (1H, m), 5,85-5,81 (1H, m), 5,63-5,54 (3H, m), 4,69-4,60 (1H, m), 4,51 (1H, dd, *J* = 13,7, 3,2 Hz), 4,36 (1H, t, *J* = 6,2 Hz), 4,22 (1H, dd, *J* = 12,8, 11,4 Hz), 3,80 (1H, dd, *J* = 13,3, 3,7 Hz), 3,65 (1H, dd, *J* = 13,7, 9,6 Hz), 2,20 (1H, td, *J* = 13,7, 6,9 Hz), 2,12 (3H, s), 1,26 (9H, dd, *J* = 6,2, 1,1 Hz), 1,01 (6H, dd, *J* = 16,0, 6,9 Hz).
C-18	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,44 (1H, dd, *J* = 9,2, 3,2 Hz), 7,02-6,92 (1H, m), 6,81 (1H, dd, *J* = 9,2, 4,1 Hz), 5,85 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,24 (1H, d, *J* = 9,2 Hz), 4,62 (1H, s), 4,55-4,45 (1H, m), 4,41-4,28 (2H, m), 4,21-4,14 (1H, m), 3,96 (1H, dd, *J* = 14,7, 2,3 Hz), 3,87 (1H, dd, *J* = 13,3, 3,2 Hz), 3,83 (3H, s), 2,37 (3H, s), 2,27-2,21 (1H, m), 2,05 (3H, s), 1,29-1,20 (9H, m), 1,06 (6H, dd, *J* = 8,5, 7,1 Hz).

C-19	RMN de ^{1}H (DMSO-d_6) δ: 7,69 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 7,26 (1H, dd, *J* = 9,6, 3,2 Hz), 7,08 (1H, td, *J* = 8,5, 3,2 Hz), 6,96 (1H, dd, *J* = 9,2, 4,6 Hz), 5,76 (1H, d, *J* = 5,0 Hz), 5,35-5,22 (1H, m), 4,40-4,16 (2H, m), 4,11-3,92 (2H, m), 3,91-3,63 (2H, m), 3,71 (3H, s), 2,32-2,16 (1H, m), 2,11 (3H, s), 1,89 (3H, s), 1,19 (6H, dd, *J* = 6,2, 5,7 Hz), 1,06 (3H, d, *J* = 6,9 Hz), 0,90 (6H, dd, *J* = 7,8, 7,3 Hz).
C-26	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,51(1H, s), 7,26-6,08(4H, m), 4,98-2,19(8H, m), 3,79(3H, s), 2,12(3H, s), 1,33-1,00(21H, m).
C-37	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,12 (1H, dd, *J* = 7,8, 0,9 Hz), 7,87 (1H, dd, *J* = 7,8, 0,9 Hz), 7,70 (1H, td, *J* = 7,7, 1,2 Hz), 7,54 (1H, s), 7,54-7,49 (1H, m), 6,02-5,98 (1H, m), 5,74 (1H, d, *J* = 5,0 Hz), 5,59 (1H, d, *J* = 7,3 Hz), 4,76-4,68 (1H, m), 4,49 (1H, dd, *J* = 13,7, 2,7 Hz), 4,40-4,34 (1H, m), 4,25 (1H, dd, *J* = 13,3, 11,4 Hz), 3,82 (1H, dd, *J* = 13,3, 3,7 Hz), 3,58 (1H, dd, *J* = 13,3, 10,1 Hz), 3,30 (3H, s), 2,25-2,17 (1H, m), 2,13 (3H, s), 1,28-1,24 (9H, m), 1,02 (6H, dd, *J* = 14,7, 6,9 Hz).
C-40	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,62 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,44 (1H, s), 7,24 (1H, dd, *J* = 8,9, 2,5 Hz), 6,81 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,75 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,17 (1H, dd, *J* = 5,7, 3,4 Hz), 4,70 (1H, s), 4,57-4,51 (1H, m), 4,39-4,33 (1H, m), 4,19 (1H, dd, *J* = 13,3, 11,0 Hz), 4,11-4,07 (1H, m), 3,90 (1H, dd, *J* = 13,7, 2,3 Hz), 3,86 (3H, s), 3,84-3,83 (1H, m), 2,21 (1H, td, *J* = 13,6, 6,7 Hz), 2,14 (3H, s), 1,27 (6H, d, *J* = 6,9 Hz), 1,23 (3H, d, *J* = 6,4 Hz), 1,04 (6H, dd, *J* = 13,5, 7,1 Hz).

C-42	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,60 (1H, d, *J* = 7,7 Hz), 7,45 (1H, s), 7,31-7,26 (1H, m), 7,02 (1H, t, *J* = 7,5 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 8,6 Hz), 5,53 (1H, d, *J* = 9,1 Hz), 5,20-5,17 (1H, m), 4,65 (1H, d, *J* = 4,5 Hz), 4,54-4,52 (1H, m), 4,39-4,32 (1H, m), 4,20-4,09 (2H, m), 3,93-3,85 (2H, m), 3,88 (3H, s), 2,25-2,18 (1H, m), 2,14 (3H, s), 1,74-1,65 (1H, m), 1,40 (2H, t, *J* = 7,2 Hz), 1,27 (6H, dd, *J* = 6,3, 1,4 Hz), 1,03 (6H, dd, *J* = 17,7, 6,8 Hz), 0,96 (6H, dd, *J* = 19,5, 6,3 Hz).
C-43	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,59 (1H, dd, *J* = 7,6, 1,6 Hz), 7,41 (1H, s), 7,29-7,25 (1H, m), 7,00 (1H, td, *J* = 7,4, 1,1 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 7,8 Hz), 5,66-5,61 (1H, m), 5,42 (1H, d, *J* = 9,2 Hz), 5,14 (1H, d, *J* = 5,0 Hz), 4,72-4,60 (1H, m), 4,57 (1H, dd, *J* = 13,3, 3,2 Hz), 4,38-4,32 (1H, m), 4,21 (1H, dd, *J* = 13,1, 11,2 Hz), 3,90 (3H, s), 3,83 (1H, dd, *J* = 12,8, 3,7 Hz), 3,25 (1H, dd, *J* = 13,3, 10,1 Hz), 2,21 (1H, td, *J* = 13,5, 6,6 Hz), 2,11 (3H, s), 1,74-1,67 (1H, m), 1,44-1,40 (2H, m), 1,25 (6H, d, *J* = 6,4 Hz), 1,03 (6H, dd, *J* = 16,7, 7,1 Hz), 0,96 (6H, dd, *J* = 23,1, 7,1 Hz).
C-44	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,67 (1H, d, *J* = 7,8 Hz), 7,49 (1H, s), 7,31-7,26 (1H, m), 7,03 (1H, t, *J* = 7,6 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,25 (1H, s), 5,17 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 4,41-4,35 (3H, m), 4,13-4,07 (2H, m), 3,94-3,86 (2H, m), 3,88 (3H, s), 2,79 (6H, s), 2,15 (3H, s), 1,82-1,72 (1H, m), 1,41 (2H, dt, *J* = 14,5, 5,6 Hz), 1,29 (6H, dd, *J* = 6,4, 3,2 Hz), 0,96 (6H, dd, *J* = 18,1, 6,6 Hz).

C-45	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,57 (1H, dd, *J* = 7,6, 1,6 Hz), 7,42 (1H, s), 7,29-7,24 (1H, m), 6,99 (1H, t, *J* = 7,1 Hz), 6,88 (1H, d, *J* = 7,8 Hz), 5,66-5,59 (2H, m), 4,58 (1H, dd, *J* = 13,5, 3,0 Hz), 4,51-4,46 (1H, m), 4,39-4,33 (1H, m), 4,26-4,15 (2H, m), 3,89 (3H, s), 3,87 (1H, dd, *J* = 13,1, 3,9 Hz), 3,18 (1H, dd, *J* = 13,1, 9,8 Hz), 2,79 (6H, s), 2,11 (3H, s), 1,80-1,73 (1H, m), 1,41 (2H, t, *J* = 7,3 Hz), 1,27 (6H, dd, *J* = 6,4, 4,6 Hz), 0,97 (6H, dd, *J* = 18,5, 6,6 Hz).
C-46	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,58 (1H, d, *J* = 7,2 Hz), 7,44 (1H, s), 7,30-7,27 (1H, m), 7,02 (1H, t, *J* = 7,5 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,52 (1H, d, *J* = 9,5 Hz), 5,19 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 4,59-4,49 (2H, m), 4,39-4,31 (1H, m), 4,15-3,98 (3H, m), 3,91-3,89 (1H, m), 3,88 (3H, s), 2,14 (3H, s), 2,13-2,05 (2H, m), 1,40 (2H, t, *J* = 7,2 Hz), 1,27 (6H, d, *J* = 6,3 Hz), 1,03 (3H, t, *J* = 7,5 Hz), 0,96 (6H, dd, *J* = 17,2, 6,8 Hz).
C-53	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,47 (1H, s), 7,45 (1H, dd, *J* = 9,2, 3,2 Hz), 6,95 (1H, td, *J* = 8,2, 3,2 Hz), 6,80 (1H, dd, *J* = 9,2, 4,1 Hz), 5,42 (1H, br s), 5,14 (1H, d, *J* = 9,2 Hz), 4,44-4,08 (5H, m), 3,93 (1H, dd, *J* = 12,8, 3,2 Hz), 3,86 (3H, s), 3,81 (1H, d, *J* = 12,8 Hz), 2,79 (6H, s), 2,15 (3H, s), 1,71-1,58 (1H, m), 1,57-1,44 (1H, m), 1,29 (6H, dd, *J* = 6,4, 3,7 Hz), 1,02 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).
C-55	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,41 (1H, s), 7,37 (1H, dd, *J* = 9,4, 3,0 Hz), 6,99-6,90 (1H, m), 6,79 (1H, dd, *J* = 8,9, 4,4 Hz), 5,51 (1H, d, *J* = 9,2 Hz), 5,16 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 4,76 (1H, br s), 4,41-4,29 (2H, m), 4,20-4,00 (2H, m), 3,96-3,86 (2H, m), 3,85 (3H, s), 2,13 (3H, s), 2,12-2,06 (2H, m), 1,70-1,61 (1H, m), 1,54-1,40 (1H, m), 1,26 (6H, d, *J* = 6,0 Hz), 1,05-0,98 (6H, m).

C-59	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,48 (1H, s), 7,46-7,45 (1H, m), 6,95 (1H, td, *J* = 8,5, 3,2 Hz), 6,80 (1H, dd, *J* = 8,9, 4,4 Hz), 5,53 (1H, s), 5,13 (1H, d, *J* = 9,2 Hz), 4,45-4,43 (1H, m), 4,41-4,35 (1H, m), 4,32-4,17 (2H, m), 4,13-4,10 (1H, m), 3,91-3,88 (1H, m), 3,86 (3H, s), 3,79 (1H, d, *J* = 13,3 Hz), 2,78 (6H, s), 2,15 (3H, s), 1,76-1,73 (1H, m), 1,45-1,36 (2H, m), 1,29 (6H, dd, *J* = 6,2, 3,9 Hz), 0,96 (6H, dd, *J* = 17,4, 6,4 Hz).
C-60	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,38 (1H, s), 7,35 (1H, dd, *J* = 9,6, 3,2 Hz), 6,92 (1H, td, *J* = 8,5, 3,2 Hz), 6,79 (1H, dd, *J* = 8,9, 4,4 Hz), 5,79 (1H, d, *J* = 5,0 Hz), 5,64-5,60 (1H, m), 4,64 (1H, dd, *J* = 13,1, 3,0 Hz), 4,56-4,43 (1H, m), 4,41-4,32 (1H, m), 4,20-4,16 (2H, m), 3,87 (3H, s), 3,87-3,82 (1H, m), 3,03 (1H, dd, *J* = 13,3, 10,1 Hz), 2,80 (6H, s), 2,11 (3H, s), 1,79-1,73 (1H, m), 1,41 (2H, t, *J* = 7,1 Hz), 1,31-1,24 (6H, m), 0,96 (6H, dd, *J* = 18,8, 6,9 Hz).
C-61	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,43 (1H, s), 7,39 (1H, dd, *J* = 9,2, 3,2 Hz), 6,95 (1H, td, *J* = 8,5, 3,2 Hz), 6,80 (1H, dd, *J* = 8,9, 4,4 Hz), 5,48-5,45 (1H, m), 5,17-5,15 (1H, m), 4,91-4,90 (1H, m), 4,57-4,51 (1H, m), 4,41-4,32 (1H, m), 4,16-4,07 (2H, m), 3,92-3,89 (2H, m), 3,86 (3H, s), 2,14 (3H, s), 2,12-2,06 (2H, m), 1,73-1,69 (1H, m), 1,40 (2H, t, *J* = 7,3 Hz), 1,27 (6H, t, *J* = 4,1 Hz), 1,02 (3H, t, *J* = 7,6 Hz), 0,96 (6H, dd, *J* = 18,3, 6,4 Hz).
C-76	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,68 (1H, dd, *J* = 7,6, 1,6 Hz), 7,48 (1H, s), 7,32-7,27 (1H, m), 7,03 (1H, t, *J* = 7,1 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 7,8 Hz), 5,21-5,13 (2H, m), 4,49-4,42 (1H, m), 4,42-4,33 (1H, m), 4,26-4,16 (3H, m), 3,97 (1H, d, *J* = 9,2 Hz), 3,88 (3H, s), 3,82 (1H, d, *J* = 13,7 Hz), 2,80 (6H, s), 2,15 (3H, s), 1,92-1,81 (1H, m), 1,29 (6H, dd, *J* = 6,2, 2,5 Hz), 1,03 (6H, dd, *J* = 6,9, 0,9 Hz).

C-77	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,58 (1H, dd, *J* = 7,6, 1,6 Hz), 7,41 (1H, s), 7,29-7,24 (1H, m), 7,00 (1H, td, *J* = 7,3, 0,9 Hz), 6,88 (1H, d, *J* = 7,8 Hz), 5,67-5,59 (1H, m), 5,52 (1H, br s), 4,58 (1H, dd, *J* = 13,3, 3,2 Hz), 4,41-4,21 (4H, m), 3,96-3,90 (1H, m), 3,90 (3H, s), 3,17 (1H, dd, *J* = 13,1, 10,3 Hz), 2,81 (6H, s), 2,11 (3H, s), 1,90-1,79 (1H, m), 1,27 (6H, dd, *J* = 6,2, 3,9 Hz), 1,04 (6H, dd, *J* = 9,6, 6,9 Hz).
C-78	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,60 (1H, dd, *J* = 7,3, 1,4 Hz), 7,44 (1H, s), 7,30 (1H, td, *J* = 7,9, 1,5 Hz), 7,03 (1H, t, *J* = 7,6 Hz), 6,90 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,47 (1H, d, *J* = 9,2 Hz), 5,19 (1H, d, *J* = 9,6 Hz), 4,58-4,49 (1H, m), 4,40-4,07 (4H, m), 3,99-3,91 (2H, m), 3,89 (3H, s), 2,93-2,84 (1H, m), 2,14 (3H, s), 2,13-1,97 (4H, m), 1,93-1,72 (3H, m), 1,27 (6H, dd, *J* = 6,2, 2,1 Hz), 1,01 (6H, dd, *J* = 7,1, 6,6 Hz).
C-85	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,69-7,64 (2H, m), 7,55 (1H, dd, *J* = 7,6, 1,6 Hz), 7,50-7,44 (1H, m), 7,42-7,35 (2H, m), 7,31-7,27 (2H, m), 6,98 (1H, td, *J* = 7,6, 0,9 Hz), 6,90 (1H, dd, *J* = 8,5, 1,1 Hz), 6,22 (1H, d, *J* = 10,1 Hz), 5,63 (1H, br s), 4,91 (1H, br s), 4,66-4,56 (1H, m), 4,53 (1H, dd, *J* = 13,3, 3,2 Hz), 4,41 (1H, t, *J* = 12,1 Hz), 4,30-4,23 (1H, m), 4,04 (1H, dd, *J* = 12,8, 3,7 Hz), 3,91 (3H, s), 3,34 (1H, dd, *J* = 13,5, 9,8 Hz), 2,00 (1H, dt, *J* = 20,9, 7,2 Hz), 1,70 (3H, s), 1,19 (6H, dd, *J* = 6,0, 2,7 Hz), 1,11 (6H, dd, *J* = 7,3, 6,9 Hz).

C-87	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,55 (1H, dd, *J* = 7,3, 1,4 Hz), 7,39 (1H, s), 7,31-7,27 (1H, m), 7,00 (1H, t, *J* = 7,1 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,56 (2H, d, *J* = 8,7 Hz), 4,66 (1H, br s), 4,53-4,40 (2H, m), 4,39-4,27 (2H, m), 3,90 (3H, s), 3,86 (1H, dd, *J* = 12,8, 3,2 Hz), 3,38 (1H, dd, *J* = 13,5, 9,4 Hz), 2,12 (3H, s), 1,96-1,85 (1H, m), 1,83-1,72 (1H, m), 1,51-1,31 (4H, m), 1,25 (6H, dd, *J* = 6,4, 1,4 Hz), 1,04 (6H, dd, *J* = 6,4, 6,0 Hz), 0,85-0,75 (6H, m).
C-94	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,57 (1H, dd, *J* = 7,6, 1,1 Hz), 7,41 (1H, s), 7,29 (1H, td, *J* = 7,8, 1,8 Hz), 7,02 (1H, td, *J* = 7,7, 1,1 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 7,3 Hz), 5,57 (1H, d, *J* = 9,6 Hz), 5,18 (1H, br s), 4,41-4,17 (4H, m), 4,16-4,07 (1H, m), 4,00-3,91 (2H, m), 3,89 (3H, s), 2,14 (3H, s), 2,05 (2H, t, *J* = 7,3 Hz), 1,93-1,82 (1H, m), 1,62-1,45 (2H, m), 1,27 (6H, d, *J* = 5,5 Hz), 1,01 (6H, dd, *J* = 6,6, 4,4 Hz), 0,86 (3H, t, *J* = 7,3 Hz).
C-95	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,57 (1H, dd, *J* = 7,3, 1,4 Hz), 7,39 (1H, s), 7,29 (1H, dd, *J* = 7,8, 1,4 Hz), 7,00 (1H, t, *J* = 7,1 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 7,8 Hz), 5,62-5,54 (1H, m), 5,44 (1H, d, *J* = 10,1 Hz), 4,98 (1H, br s), 4,53 (1H, dd, *J* = 13,3, 3,2 Hz), 4,46-4,24 (3H, m), 3,96-3,89 (1H, m), 3,90 (3H, s), 3,29 (1H, dd, *J* = 13,3, 9,6 Hz), 2,12 (3H, s), 2,05 (2H, dt, *J* = 11,6, 3,3 Hz), 1,90-1,80 (1H, m), 1,57-1,43 (2H, m), 1,25 (6H, d, *J* = 6,0 Hz), 1,03 (6H, dd, *J* = 11,2, 6,6 Hz), 0,86 (3H, t, *J* = 7,3 Hz).

C-97	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,56 (1H, dd, *J* = 7,6, 1,6 Hz), 7,39 (1H, s), 7,29 (1H, dd, *J* = 7,8, 1,8 Hz), 7,00 (1H, t, *J* = 7,3 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,61-5,53 (1H, m), 5,44 (1H, d, *J* = 9,6 Hz), 4,92 (1H, br s), 4,51 (1H, dd, *J* = 13,3, 3,2 Hz), 4,45-4,24 (3H, m), 3,92 (1H, dd, *J* = 13,5, 4,4 Hz), 3,90 (3H, s), 3,32 (1H, dd, *J* = 13,1, 9,8 Hz), 2,12 (3H, s), 2,04-1,92 (2H, m), 1,91-1,79 (2H, m), 1,25 (6H, d, *J* = 6,0 Hz), 1,03 (6H, dd, *J* = 10,8, 6,6 Hz), 0,86 (6H, t, *J* = 7,1 Hz).
C-127	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,66-7,51 (1H, m), 7,45-7,38 (1H, m), 7,33-7,27 (1H, m), 7,07-6,96 (1H, m), 6,89 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,60-5,12 (1H, m), 4,65-4,56 (1H, m), 4,50-4,15 (4H, m), 4,08-3,97 (1H, m), 3,91-3,87 (3H, m), 3,87-3,33 (2H, m), 2,21-2,12 (3H, m), 1,94-1,75 (1H, m), 1,33 (9H, s), 1,30-1,23 (6H, m), 1,05-0,98 (6H, m).
C-128	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,62 (1H, dd, *J* = 7,8, 1,4 Hz), 7,45 (1H, s), 7,29 (1H, td, *J* = 7,9, 1,4 Hz), 7,02 (1H, t, *J* = 7,6 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 7,8 Hz), 5,78 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,21-5,13 (1H, m), 4,64 (1H, br s), 4,40-4,28 (2H, m), 4,28-4,18 (2H, m), 3,94 (1H, dd, *J* = 12,4, 3,2 Hz), 3,88 (3H, s), 3,86 (1H, dd, *J* = 13,7, 2,3 Hz), 2,15 (3H, s), 1,95-1,82 (1H, m), 1,27 (6H, dd, *J* = 6,4, 2,3 Hz), 1,09 (9H, s), 1,01 (6H, dd, *J* = 6,6, 5,3 Hz).
C-129	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,59 (1H, dd, *J* = 7,6, 1,6 Hz), 7,40 (1H, s), 7,30-7,27 (1H, m), 7,00 (1H, td, *J* = 7,3, 0,9 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,69-5,60 (2H, m), 5,04-4,96 (1H, m), 4,55 (1H, dd, *J* = 13,3, 3,2 Hz), 4,46-4,28 (3H, m), 3,90 (3H, s), 3,89 (1H, dd, *J* = 11,9, 3,7 Hz), 3,25 (1H, dd, *J* = 13,1, 9,8 Hz), 2,13 (3H, s), 1,92-1,83 (1H, m), 1,25 (6H, dd, *J* = 6,4, 1,8 Hz), 1,10 (9H, s), 1,03 (6H, dd, *J* = 11,7, 6,6 Hz).

C-130	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,43 (1H, s), 7,42 (1H, dd, *J* = 9,4, 3,0 Hz), 7,00-6,93 (1H, m), 6,81 (1H, dd, *J* = 9,2, 4,1 Hz), 5,51 (1H, d, *J* = 9,2 Hz), 5,14 (1H, d, *J* = 6,9 Hz), 4,91 (1H, br s), 4,41-4,30 (2H, m), 4,30-4,18 (2H, m), 3,92 (1H, dd, *J* = 12,6, 3,4 Hz), 3,86 (3H, s), 3,81 (1H, dd, *J* = 14,0, 1,6 Hz), 2,29-2,18 (1H, m), 2,14 (3H, s), 1,91-1,78 (1H, m), 1,27 (6H, dd, *J* = 6,0, 1,4 Hz), 1,05 (6H, dd, *J* = 14,2, 6,9 Hz), 1,01 (6H, d, *J* = 6,9 Hz).
C-131	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,37 (1H, dd, *J* = 9,2, 3,7 Hz), 7,37 (1H, s), 6,93 (1H, td, *J* = 8,5, 3,2 Hz), 6,80 (1H, dd, *J* = 8,9, 4,4 Hz), 5,67-5,57 (1H, m), 5,43 (1H, d, *J* = 9,6 Hz), 5,22 (1H, d, *J* = 6,0 Hz), 4,62 (1H, dd, *J* = 13,3, 3,2 Hz), 4,48-4,26 (3H, m), 3,89 (1H, dd, *J* = 11,9, 4,1 Hz), 3,88 (3H, s), 3,11 (1H, dd, *J* = 13,3, 10,1 Hz), 2,30-2,19 (1H, m), 2,12 (3H, s), 1,91-1,79 (1H, m), 1,25 (6H, dd, *J* = 6,4, 0,9 Hz), 1,06 (6H, dd, *J* = 10,1, 6,9 Hz), 1,02 (6H, d, *J* = 6,9 Hz).
C-132	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,42 (1H, s), 7,37 (1H, dd, *J* = 8,9, 3,0 Hz), 6,96 (1H, td, *J* = 8,5, 3,2 Hz), 6,81 (1H, dd, *J* = 8,7, 4,1 Hz), 5,73 (1H, br s), 5,21-5,13 (1H, m), 4,69 (1H, s), 4,60-4,47 (1H, m), 4,38-4,32 (1H, m), 4,25-4,08 (2H, m), 3,91-3,81 (2H, m), 3,86 (3H, s), 2,25-2,18 (1H, m), 2,14 (3H, s), 1,27 (6H, dd, *J* = 6,2, 1,1 Hz), 1,23 (3H, d, *J* = 6,9 Hz), 1,03 (6H, dd, *J* = 14,2, 6,9 Hz).
C-133	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,38 (1H, s), 7,37 (1H, dd, *J* = 9,6, 2,3 Hz), 6,94 (1H, td, *J* = 8,5, 3,2 Hz), 6,80 (1H, dd, *J* = 8,9, 4,4 Hz), 5,66-5,59 (1H, m), 5,49 (1H, d, *J* = 9,2 Hz), 5,28 (1H, d, *J* = 6,0 Hz), 4,79-4,66 (1H, m), 4,61 (1H, dd, *J* = 13,3, 3,2 Hz), 4,40-4,21 (2H, m), 3,88 (3H, s), 3,80 (1H, dd, *J* = 12,8, 3,7 Hz), 3,12 (1H, dd, *J* = 13,3, 9,6 Hz), 2,26-2,17 (1H, m), 2,12 (3H, s), 1,27-1,23 (9H, m), 1,03 (6H, dd, *J* = 15,1, 6,9 Hz).

C-136	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,41(1H, s), 7,37-6,76(3H, m), 5,72-3,85(9H, m), 3,84(3H, s), 2,15(3H, s), 2,10-1,02(14H, m).
C-149	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,70(1H, s), 7,35-6,78(3H, m), 5,10-2,16(10H, m), 3,88(3H, s), 2,15(3H, s), 1,26-1,01(15H, m).
C-153	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,44(1H, s), 7,40-6,79(3H, m), 5,05-0,98(21H, m), 3,88(3H, s), 2,14(3H, s).
C-163	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,42(1H, s), 7,28-6,72(3H, m), 6,15-2,20(10H, m), 3,90(3H, s), 2,14(3H, s), 1,34-1,06(15H, m).
C-164	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,50(1H, s), 7,28-6,71(3H, m), 5,78-2,18(10H, m), 3,90(3H, s), 2,12(3H, s), 1,28-1,00(15H, m).
C-183	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,42-6,79(4H, m), 5,10-3,13(9H, m), 3,88(3H, s), 2,17(3H, s), 1,30-1,20(18H, m).
C-185	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,37(1H, s), 7,32-6,79(3H, m), 5,19-3,90(9H, m), 3,80(3H, s), 3,55(3H, s), 2,14(3H, s), 1,28--1,21(9H, m).
C-187	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,40(1H, s), 7,34-6,79(3H, m), 5,17-3,76(10H, m), 3,86(3H, s), 2,15(3H, s), 1,30--1,10(15H, m).
C-188	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,37(1H, s), 7,32-6,79(3H, m), 5,55-3,14(10H, m), 3,86(3H, s), 2,13(3H, s), 1,28--1,21(15H, m).
C-193	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,84-7,35(5H, m), 5,64-2,17(10H, m), 2,15(3H, s), 1,28--1,01(15H, m).
C-197	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,63-7,24(5H, m), 5,68-2,15(12H, m), 2,15(3H, s), 1,31-0,98(18H, m).
C-198	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,44(1H, s), 7,39-6,79(3H, m), 5,42-2,08(10H, m), 3,83(3H, s), 2,14(3H, s), 1,77-0,92(21H, m).
C-199	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,39(1H, s), 7,39-6,79(3H, m), 5,67-2,10(10H, m), 3,83(3H, s), 2,11(3H, s), 1,77-0,92(21H, m).
C-200	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,44-6,79(4H, m), 5,65-3,18(9H, m), 3,87(3H, s), 2,18(3H, s), 1,80-0,93(24H, m).

C-204	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,52(1H, s), 7,40(1H, s), 6,90-6,66(4H, m), 5,60-3,2,20(10H, m), 2,12(3H, s), 1,30-0,98(15H, m).
C-206	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,39(1H, s), 7,38-6,80(3H, m), 5,60-3,95(10H, m), 3,83(3H, s), 2,12(3H, s), 1,86(3H, s), 1,90-0,98(13H, m).
C-209	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,44(1H, s), 7,43-6,80(3H, m), 5,55-3,80(10H, m), 3,84(3H, s), 2,12(3H, s), 2,28-1,01(23H, m).
C-242	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,62 (1H, d, J = 7,8 Hz), 7,54-7,46 (2H, m), 7,34 (1H, s), 7,33-7,28 (1H, m), 6,07 (1H, d, J = 7,3 Hz), 5,24 (1H, d, J = 17,9 Hz), 4,75 (1H, d, J = 17,4 Hz), 4,38-4,32 (2H, m), 4,14 (1H, dd, J = 13,7, 10,5 Hz), 3,93 (1H, dd, J = 13,7, 3,2 Hz), 3,48-3,37 (1H, m), 2,27-2,21 (1H, m), 2,18 (3H, s), 2,14-2,00 (2H, m), 1,86-1,53 (6H, m), 1,25 (6H, dd, J = 6,4, 4,6 Hz), 1,21 (3H, d, J = 6,4 Hz), 1,05 (6H, dd, J = 6,9, 5,0 Hz).
C-243	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,50-7,46 (2H, m), 7,38-7,33 (2H, m), 7,21 (1H, s), 6,09 (1H, d, J = 7,7 Hz), 5,75 (1H, t, J = 2,0 Hz), 5,07 (1H, d, J = 18,1 Hz), 4,71 (1H, d, J = 17,7 Hz), 4,38-4,28 (2H, m), 4,12 (1H, dd, J = 13,4, 10,6 Hz), 3,91 (1H, dd, J = 13,6, 3,2 Hz), 2,79-2,70 (2H, m), 2,61-2,52 (2H, m), 2,28-2,20 (1H, m), 2,17 (3H, s), 2,14-2,05 (2H, m), 1,25 (6H, dd, J = 6,3, 4,1 Hz), 1,20 (3H, d, J = 6,8 Hz), 1,06 (6H, t, J = 6,6 Hz).
D-2	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,07(1H, s), 7,24-6,78(5H, m), 5,13-3,21(9H, m), 3,82(3H, s), 2,08(3H, s), 1,35-1,22(9H, m).
D-3	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,66(1H, s), 7,58-7,00(3H, m), 6,72(1H, s), 5,67-1,84(8H, m), 2,15(3H, s), 1,33-1,00(24H, m).

D-5	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,41 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 7,26 (1H, s), 7,16 (1H, dd, *J* = 9,2, 2,7 Hz), 6,94 (1H, td, *J* = 8,4, 3,1 Hz), 6,79 (1H, dd, *J* = 8,9, 4,4 Hz), 6,31 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 5,24-5,19 (1H, m), 5,17 (2H, s), 4,67 (2H, q, *J* = 8,5 Hz), 4,36-4,30 (1H, m), 4,19-4,14 (1H, m), 4,01 (1H, dd, *J* = 14,2, 7,3 Hz), 3,83 (3H, s), 3,61 (1H, d, *J* = 5,0 Hz), 2,13 (3H, s), 1,25 (6H, d, *J* = 6,4 Hz).
D-9	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,26 (1H, s), 7,17-6,80(3H, m), 5,21-3,56 (8H, m), 3,84 (3H, s), 3,36 (6H, s), 2,11 (3H, s), 1,25 (6H, d, *J* = 6,3 Hz).
D-12	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,25-7,20 (2H, m), 6,95 (1H, td, *J* = 8,5, 2,4 Hz), 6,80 (1H, dd, *J* = 9,2, 4,1 Hz), 5,23 (1H, dd, *J* = 7,1, 3,4 Hz), 4,38-4,27 (2H, m), 4,19-4,11 (1H, m), 3,95 (1H, tt, *J* = 10,8, 3,8 Hz), 3,86 (3H, d, *J* = 1,8 Hz), 3,78 (1H, dd, *J* = 13,3, 2,7 Hz), 2,91 (1H, td, *J* = 9,8, 5,6 Hz), 2,36 (6H, d, *J* = 2,7 Hz), 2,12 (3H, d, *J* = 3,7 Hz), 1,93 (1H, dd, *J* = 13,5, 6,6 Hz), 1,28-1,25 (6H, m), 1,11 (1H, dd, *J* = 6,9, 3,2 Hz), 1,02 (6H, dq, *J* = 14,1, 4,0 Hz).
D-13	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,31 (1H, s), 7,29-7,24 (1H, m), 7,00-6,93 (1H, m), 6,81 (1H, dd, *J* = 9,1, 4,1 Hz), 5,34 (1H, dt, *J* = 10,1, 3,4 Hz), 4,61-4,55 (1H, m), 4,47-4,05 (6H, m), 3,87 (3H, s), 3,68 (1H, dd, *J* = 13,8, 8,4 Hz), 2,85 (6H, s), 2,12 (3H, s), 1,26 (6H, dd, *J* = 6,1, 1,1 Hz).
D-14	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,31 (1H, s), 7,23 (1H, dd, *J* = 8,9, 3,0 Hz), 7,01-6,91 (1H, m), 6,81 (1H, dd, *J* = 8,7, 4,1 Hz), 5,30-5,23 (1H, m), 4,49-4,40 (1H, m), 4,39-4,17 (5H, m), 3,86 (3H, s), 3,85-3,79 (1H, m), 3,63-3,58 (1H, m), 2,54-2,47 (1H, m), 2,12 (3H, s), 1,27-1,24 (6H, m), 1,15-1,11 (6H, m).

D-18	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,25-7,18 (2H, m), 6,96 (1H, tdd, *J* = 9,8, 4,5, 2,9 Hz), 6,80 (1H, dq, *J* = 8,8, 2,0 Hz), 5,24-5,21 (1H, m), 4,37-4,30 (1H, m), 4,20-4,09 (2H, m), 3,99 (1H, dq, *J* = 19,5, 6,0 Hz), 3,86 (3H, d, *J* = 2,3 Hz), 3,80 (2H, dd, *J* = 13,1, 6,8 Hz), 3,13 (1H, dd, *J* = 13,1, 6,8 Hz), 2,27 (6H, d, *J* = 2,3 Hz), 2,12 (3H, d, *J* = 2,7 Hz), 1,31-1,16 (6H, m), 0,96-0,83 (3H, m).
D-19	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,49-7,48 (2H, m), 6,95 (1H, td, *J* = 8,5, 3,3 Hz), 6,80 (1H, dd, *J* = 9,1, 4,1 Hz), 5,89 (1H, d, *J* = 3,2 Hz), 5,21 (1H, d, *J* = 9,5 Hz), 4,96 (1H, ddd, *J* = 12,8, 7,4, 5,1 Hz), 4,40-4,27 (3H, m), 3,86 (3H, s), 3,78 (1H, dd, *J* = 12,9, 4,3 Hz), 3,67-3,62 (2H, m), 3,46-3,42 (1H, m), 2,56-2,49 (1H, m), 2,26-2,23 (1H, m), 2,15 (3H, s), 2,05 (1H, s), 1,93 (1H, td, *J* = 12,2, 7,7 Hz), 1,75 (1H, dd, *J* = 12,7, 7,2 Hz), 1,28 (6H, d, *J* = 6,3 Hz), 0,98 (6H, d, *J* = 6,8 Hz).
D-20	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,41-7,37 (2H, m), 6,93 (1H, td, *J* = 8,4, 3,2 Hz), 6,80 (1H, dd, *J* = 8,8, 4,3 Hz), 5,96 (1H, d, *J* = 5,4 Hz), 5,68 (1H, t, *J* = 6,1 Hz), 5,06-5,00 (1H, m), 4,67 (1H, dd, *J* = 13,1, 3,2 Hz), 4,39-4,32 (2H, m), 3,87 (3H, s), 3,77 (1H, dd, *J* = 13,1, 4,1 Hz), 3,62 (1H, td, *J* = 9,5, 2,7 Hz), 3,44 (1H, dd, *J* = 17,9, 9,7 Hz), 3,02 (1H, dd, *J* = 13,1, 10,4 Hz), 2,56-2,50 (1H, m), 2,26 (1H, t, *J* = 10,0 Hz), 2,10 (3H, s), 2,10 (1H, tt, *J* = 19,9, 7,2 Hz), 1,91 (1H, ddd, *J* = 21,1, 11,3, 6,3 Hz), 1,75 (1H, dd, *J* = 12,7, 6,3 Hz), 1,25 (6H, t, *J* = 4,3 Hz), 0,99 (6H, dd, *J* = 6,8, 0,9 Hz).
D-29	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,03-7,37(5H, m), 5,11-3,80(7H, m), 3,93(3H, s), 2,14(3H, s), 1,35-1,20(18H, m).
D-35	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,40-6,70(4H, m), 5,35-0,95(25H, m), 3,84(3H, s), 2,14(3H, s).

D-37	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,44-6,80(4H, m), 5,41-1,00(25H, m), 3,86(3H, s), 2,20(3H, s).
D-40	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,51-7,47 (1H, m), 7,41-7,18 (4H, m), 7,08-6,97 (4H, m), 5,01-4,93 (3H, m), 4,37 (1H, dq, *J* = 14,7, 4,2 Hz), 3,82-3,78 (6H, m), 3,33-3,31 (3H, m), 2,17-2,16 (3H, m), 1,30-1,24 (6H, m).
D-47	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,73-6,77(8H, m), 5,23-3,60(7H, m), 3,80(3H, s), 2,11(3H, s), 1,70(6H, d, J= 6,3Hz).
D-52	RMN de $_{1}H$ ($CDCl_3$) δ: 7,43-6,78(8H, m), 5,22-3,43(7H, m), 3,81(3H, s), 3,79(3H, s), 2,12(3H, s), 1,23(6H, d, J= 6,3Hz).
D-57	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 8,52-6,96(8H, m), 5,30(2H, s), 5,18(2H, s), 4,39-4,31(1H, m), 3,96(3H, s), 2,19(3H, s) 1,26 (6H, d, J= 6,3Hz).
D-63	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,25-7,18 (3H, m), 7,07 (1H, dd, *J* = 7,3, 1,4 Hz), 7,00 (1H, s), 6,90-6,83 (4H, m), 4,33-4,27 (1H, m), 4,23-4,19 (2H, m), 3,95 (2H, t, *J* = 6,9 Hz), 3,86 (3H, s), 3,80 (3H, s), 3,00-2,93 (4H, m), 2,06 (3H, s), 1,23 (6H, d, *J* = 6,0 Hz).
D-65	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,25 (1H, s), 7,21 (1H, dd, *J* = 8,7, 3,2 Hz), 7,01-6,92 (1H, m), 6,81 (1H, dd, *J* = 8,9, 4,4 Hz), 5,25-5,17 (1H, m), 4,37-4,30 (1H, m), 4,25 (4H, s), 4,14-4,07 (1H, m), 3,97 (1H, dd, *J* = 14,2, 7,3 Hz), 3,85 (3H, s), 3,54-3,46 (1H, m), 2,38-2,28 (4H, m), 2,12 (3H, s), 1,75-1,66 (4H, m), 1,26 (6H, d, *J* = 6,4 Hz).

D-66	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,34 (1H, s), 7,18 (1H, dd, *J* = 9,1, 3,2 Hz), 7,00-6,95 (1H, m), 6,81 (1H, dd, *J* = 8,8, 4,3 Hz), 5,24 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 4,34 (1H, td, *J* = 12,5, 6,0 Hz), 4,16-4,03 (1H, m), 3,95 (1H, dd, *J* = 14,0, 7,7 Hz), 3,86 (3H, s), 3,03 (1H, d, *J* = 5,4 Hz), 2,79 (2H, t, *J* = 7,2 Hz), 2,12 (3H, s), 1,78-1,71 (2H, m), 1,43-1,31 (4H, m), 1,26 (6H, d, *J* = 6,3 Hz), 0,91 (3H, t, *J* = 7,0 Hz).
D-74	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,40 (1H, s), 7,19-6,82 (3H, m), 5,25-3,94 (5H, m), 4,82 (2H, s), 3,86 (3H, s), 2,05 (3H, s), 1,29 - 1,21 (6H, m)
D-80	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,62 (1H, dd, *J* = 8,7, 3,2 Hz), 7,30 (1H, s), 7,29-7,24 (1H, m), 6,99 (1H, dd, *J* = 9,2, 3,7 Hz), 5,11 (2H, s), 4,36-4,30 (1H, m), 4,25 (4H, s), 3,97 (3H, s), 2,39-2,25 (4H, m), 2,18 (3H, s), 1,76-1,63 (4H, m), 1,25 (6H, d, *J* = 6,4 Hz).
D-83	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,61 (1H, s), 7,22-7,10 (3H, m), 6,90(1H, s), 5,94-2,20 (6H, m), 2,39 (3H, s), 2,22 (3H, s), 2,15(3H, s), 1,29-1,05 (15H, d, m).
D-84	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,62 (1H, dd, *J* = 8,7, 3,2 Hz), 7,29 (1H, s), 7,29-7,24 (1H, m), 6,99 (1H, dd, *J* = 9,2, 4,1 Hz), 5,11 (2H, s), 4,36-4,30 (1H, m), 4,24 (4H, br s), 3,97 (3H, s), 2,18 (3H, s), 1,85 (3H, s), 1,78 (3H, s), 1,25 (6H, d, *J* = 6,4 Hz).
D-85	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,28 (1H, s), 7,20-6,77 (3H, m), 5,94-3,36 (9H, m), 3,86 (3H, s), 2,13 (3H, s), 1,26 (6H, d, *J* = 6,3 Hz).

D-86	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,77 (1H, dd, *J* = 7,5, 2,9 Hz), 7,66-7,60 (2H, m), 7,52 (1H, dd, *J* = 9,1, 5,4 Hz), 7,44 (1H, d, *J* = 5,4 Hz), 7,26-7,20 (1H, m), 7,01-6,94 (1H, m), 6,82 (1H, dd, *J* = 8,8, 4,3 Hz), 6,26-6,19 (1H, m), 5,89 (1H, d, *J* = 5,0 Hz), 5,36-5,21 (1H, m), 4,67-4,42 (3H, m), 4,40-4,32 (1H, m), 4,30-4,10 (2H, m), 3,91-3,78 (4H, m), 3,53-3,38 (1H, m), 2,19-2,04 (3H, m), 1,27 (6H, dd, *J* = 6,3, 1,8 Hz).
D-87	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,84-7,78 (2H, m), 7,76-7,69 (2H, m), 7,63 (1H, dd, *J* = 8,8, 3,4 Hz), 7,37 (1H, s), 7,32-7,20 (1H, m), 6,98 (1H, dd, *J* = 9,1, 4,1 Hz), 5,15 (2H, s), 4,50-4,39 (4H, m), 4,40-4,29 (1H, m), 3,97 (3H, s), 2,18 (3H, s), 1,25 (6H, d, *J* = 6,3 Hz).
D-88	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,35 (1H, d, *J* = 5,9 Hz), 7,28-7,22 (1H, m), 6,99-6,91 (1H, m), 6,80 (1H, dd, *J* = 8,8, 4,3 Hz), 5,36-5,24 (1H, m), 4,49-4,00 (5H, m), 3,88-3,84 (3H, m), 3,82-3,59 (1H, m), 2,80-2,62 (3H, m), 2,39-2,15 (2H, m), 2,14 (3H, s), 1,30-1,19 (12H, m).
D-89	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,34 (1H, s), 7,20 (1H, dd, *J* = 9,1, 3,2 Hz), 7,00-6,94 (1H, m), 6,81 (1H, dd, *J* = 8,8, 4,3 Hz), 5,30-5,19 (1H, m), 4,42-4,27 (1H, m), 4,24-4,01 (3H, m), 3,94-3,81 (1H, m), 3,86 (3H, s), 3,48 (1H, br s), 3,17-2,98 (3H, m), 2,31-2,15 (2H, m), 2,13 (3H, s), 1,37 (6H, d, *J* = 6,8 Hz), 1,26 (6H, d, *J* = 6,3 Hz).
D-90	RMN de ^{1}H ($CDCl_3$) δ: 7,27 (1H, s), 7,19 (1H, dd, *J* = 9,1, 3,2 Hz), 6,96 (1H, td, *J* = 8,4, 3,2 Hz), 6,81 (1H, dd, *J* = 9,1, 4,1 Hz), 5,26-5,17 (1H, m), 4,39-4,28 (1H, m), 4,17-3,95 (4H, m), 3,86 (3H, s), 3,43 (1H, d, *J* = 5,4 Hz), 2,98-2,91 (1H, m), 2,58 (2H, t, *J* = 7,5 Hz), 2,13 (3H, s), 1,90 (2H, td, *J* = 14,2, 6,6 Hz), 1,26 (12H, d, *J* = 6,3 Hz).

[0299]

Prueba biológica

La utilidad del compuesto de dihidropirimidina de la presente invención como ingrediente activo para fungicidas agrícolas y hortícolas se ilustra en los Ejemplos de prueba a continuación.

Los compuestos de dihidropirimidina usados en las pruebas se muestran mediante la prueba en las Tablas 9 y 10 a continuación. Los números de compuestos en la Tabla 9 corresponden cada uno a los números de compuestos en las Tablas 2 a 4. Los números de compuestos en la Tabla 10 corresponden cada uno a los números de compuestos en las Tablas 6 y 7.

[0300]

Tabla 9

Sarna			Mildiú		Roya marrón	Moho gris
A-1	A-40	A-94	A-1	A-84	A-1	A-42
A-2	A-42	A-95	A-2	A-86	A-2	A-58
A-3	A-44	A-96	A-10	A-90	A-10	A-60
A-5	A-46	A-97	A-11	A-91	A-11	A-63
A-6	A-48	A-98	A-14	A-92	A-14	A-75
A-7	A-49	A-99	A-17	A-93	A-17	A-76
A-8	A-51	A-100	A-18	A-94	A-23	A-102
A-9	A-58	A-101	A-23	A-95	A-24	
A-10	A-60	A-102	A-24	A-96	A-25	
A-11	A-61	A-103	A-31	A-97	A-48	
A-13	A-63	A-104	A-38	A-99	A-60	
A-14	A-67	A-105	A-42	A-100	A-61	
A-15	A-70	A-107	A-46	A-101	A-63	
A-16	A-71	B-3	A-48	A-102	A-64	
A-17	A-72	B-7	A-49	A-105	A-69	
A-18	A-75	B-8	A-51	B-1	A-70	

A-19	A-76	B-9	A-58	B-3	A-76	
A-20	A-79		A-60		A-80	
A-21	A-80		A-61		A-91	
A-22	A-81		A-63		A-93	
A-23	A-83		A-69		A-95	
A-24	A-84		A-70		A-99	
A-25	A-85		A-71		A-100	
A-26	A-87		A-75			
A-31	A-88		A-76			
A-36	A-90		A-79			
A-37	A-91		A-80			
A-38	A-93		A-81			

[0301]

Tabla 10

Sarna			Mildiú			Roya marrón		Moho gris
C-2	C-89	C-180	C-2	C-95	C-197	C-2	C-168	C-2
C-4	C-90	C-182	C-4	C-97	C-199	C-4	C-170	C-4
C-6	C-91	C-183	C-6	C-99	C-202	C-6	C-174	C-24
C-10	C-93	C-184	C-10	C-101	C-207	C-10	C-176	C-56
C-12	C-95	C-186	C-12	C-103	C-208	C-22	C-182	C-58
C-14	C-97	C-188	C-14	C-105	C-210	C-24	C-197	C-60
C-15	C-99	C-189	C-15	C-107	C-211	C-33	C-199	C-62
C-17	C-101	C-191	C-22	C-109	C-213	C-43	C-210	C-101
C-22	C-103	C-197	C-24	C-111	C-219	C-45	D-11	C-112
C-24	C-105	C-199	C-29	C-112	D-1	C-47	D-20	C-126
C-25	C-107	C-202	C-30	C-115	D-3	C-49	D-22	C-148
C-28	C-109	C-207	C-32	C-117	D-11	C-54	D-48	C-154
C-29	C-111	C-208	C-33	C-122	D-20	C-56	D-50	C-168

C-30	C-112	C-210	C-34	C-124	D-22	C-58		C-199
C-32	C-115	C-211	C-36	C-126	D-34	C-60		C-202
C-34	C-117	C-213	C-39	C-127	D-35	C-63		C-210
C-36	C-122	C-219	C-43	C-129	D-37	C-67		D-11
C-39	C-124	C-220	C-45	C-135	D-44	C-69		
C-41	C-126	C-221	C-47	C-137	D-56	C-75		
C-43	C-127	D-3	C-49	C-141		C-79		
C-45	C-129	D-7	C-51	C-146		C-81		
C-47	C-135	D-8	C-54	C-148		C-83		
C-49	C-137	D-11	C-56	C-151		C-87		
C-51	C-141	D-13	C-58	C-154		C-89		
C-54	C-144	D-14	C-60	C-158		C-93		
C-56	C-148	D-16	C-62	C-160		C-95		
C-58	C-151	D-20	C-63	C-166		C-97		
C-60	C-152	D-22	C-65	C-168		C-99		
C-62	C-154	D-33	C-67	C-170		C-101		
C-63	C-156	D-34	C-69	C-172		C-103		
C-65	C-158	D-35	C-71	C-173		C-107		
C-67	C-160	D-36	C-73	C-174		C-109		
C-69	C-162	D-37	C-75	C-176		C-112		
C-71	C-166	D-39	C-77	C-177		C-115		
C-73	C-168	D-43	C-79	C-179		C-117		
C-75	C-170	D-52	C-81	C-180		C-124		
C-77	C-172	D-53	C-83	C-182		C-126		
C-79	C-173	D-54	C-85	C-183		C-129		
C-81	C-174	D-56	C-87	C-186		C-135		
C-83	C-176	D-57	C-89	C-188		C-148		
C-85	C-177	D-63	C-90	C-191		C-154		
C-87	C-179		C-93	C-194		C-166		

[0302]

Preparación de emulsión para prueba

Se mezclaron y disolvieron 5 partes en peso del compuesto de dihidropirimidina de la presente invención, 93,5 partes en peso de N,N-dimetilformamida y 1,5 partes en peso de monolaurato de polioxietilensorbitán (TWEEN® 20) para obtener una emulsión (I) que incluía el 5 % de un ingrediente activo.

[0303]

El valor de control se calculó mediante la siguiente expresión.

[0304]

Expresión 1

Valor de control (%) = 100 - {relación del área de la lesión en el grupo tratado/relación del área de la lesión en el grupo no tratado} × 100

[0305]

Ejemplo de prueba 1 Prueba de control de la sarna de manzana

Se añadió agua a la emulsión (I) de manera que la concentración del compuesto de dihidropirimidina alcanzó 125 ppm para disolver la emulsión y se obtuvo una solución de fármaco. Posteriormente, la solución de fármaco se roció sobre plántulas de manzana (variedad: "Orin", etapa de hoja: 3 a 4) cultivados en macetas para plántulas. Después de secar al aire, las plántulas se inocularon con conidiosporas de un patógeno de la sarna del manzano (*Venturia inaequalis*) (grupo tratado). Como control, las plántulas de manzana que no se rociaron con la solución de fármaco se inocularon de la misma manera (grupo sin tratar). Las plántulas se dejaron reposar en una habitación humidificada a 20°C usando un ciclo de luz/oscuridad de 12 horas.

El día 2 semanas después de la inoculación, se observaron visualmente las hojas de las plántulas de manzano para determinar la relación del área de la lesión y se calculó el valor de control.

[0306]

Los compuestos de dihidropirimidina descritos en la Tabla 9 y la

Tabla 10 se sometieron a la prueba de control de la sarna de la manzana. Todos los compuestos demostraron valores de control del 75 % o más.

[0307]

Ejemplo de prueba 2 Prueba de control del mildiú del trigo

Se añadió agua a la emulsión (I) de manera que la concentración del compuesto de dihidropirimidina alcanzó 125 ppm para disolver la emulsión y se obtuvo una solución de fármaco. Posteriormente, la solución de fármaco se roció sobre plántulas de trigo (variedad: "Chihoku", etapa de hoja: 1 a 2) cultivado en macetas para plántulas. Después de secar al aire, se rociaron sobre las mismas conidiosporas de un patógeno del mildiú del trigo (*Erysiphe graminis f. Sp. Tritici*) para la inoculación (grupo tratado). Como control, las plántulas de trigo que no se rociaron con la solución de fármaco se inocularon de la misma manera que se describió anteriormente (grupo sin tratar). Las plántulas se dejaron reposar en un invernadero a 20°C.

En los 6 días posteriores a la inoculación, se observaron visualmente las hojas de las plántulas de trigo para determinar la relación del área de lesión, y se calculó el valor de control.

[0308]

Los compuestos de dihidropirimidina descritos en la Tabla 9 y la Tabla 10 se sometieron a la prueba de control del mildiú del trigo. Todos los compuestos demostraron valores de control del 75 % o más.

[0309]

Ejemplo de prueba 3 Prueba de control de la roya marrón del trigo

Se añadió agua a la emulsión (I) de manera que la concentración del compuesto de dihidropirimidina alcanzó 125 ppm para disolver la emulsión y se obtuvo una solución de fármaco. Posteriormente, la solución de fármaco se roció sobre plántulas de trigo (variedad: "Norin 61", etapa hoja: 1 a 2) cultivado en macetas para plántulas. Después de secar al aire, se rociaron uredosporas de un patógeno de la roya marrón del trigo (*Puccinia recondita*) sobre plántulas de trigo rociadas con la

solución de fármaco para la inoculación (grupo tratado). Como control, las plántulas de trigo que no se rociaron con la solución de fármaco se inocularon de la misma manera que se describió anteriormente (grupo sin tratar). Las plántulas se dejaron reposar en un invernadero a 20°C.

En los 12 días posteriores a la inoculación, se observaron visualmente las hojas de las plántulas de trigo para determinar la relación del área de lesión, y se calculó el valor de control.

[0310]

Los compuestos de dihidropirimidina descritos en la Tabla 9 y la Tabla 10 se sometieron a la prueba de control de la roya marrón del trigo. Todos los compuestos demostraron valores de control del 75 % o más.

[0311]

Ejemplo de prueba 4 Prueba de control de moho gris de pepino

Se añadió agua a la emulsión (I) de manera que la concentración del compuesto de dihidropirimidina alcanzó 125 ppm para disolver la emulsión y se obtuvo una solución de fármaco. Posteriormente, la solución de fármaco se roció sobre plántulas de pepino (variedad: tipo "rastrero", etapa de cotiledón) cultivados en macetas de plántulas. Después de secar al aire, se dejó caer una suspensión de conidiosporas de un patógeno del moho gris del pepino (*Botrytis cinerea*) para la inoculación (grupo tratado). Como control, las plántulas de pepino que no se rociaron con la solución de fármaco se inocularon goteando de la misma manera que se describió anteriormente (grupo no tratado). Las plántulas se dejaron reposar en una habitación humidificada a 20°C.

En los 4 días posteriores a la inoculación, se observaron visualmente las hojas de las plántulas de pepino para determinar la relación del área de lesión, y se calculó el valor de control.

[0312]

Los compuestos de dihidropirimidina descritos en la Tabla 9 y la Tabla 10 se sometieron a la prueba de control del moho gris del pepino. Todos los compuestos demostraron valores de control del 75 % o más.

[0313]

Ejemplo de prueba 5 Prueba de tratamiento de semillas del mildiú de trigo

La emulsión (I) se utilizó para tratar semillas de manera que (peso del compuesto de dihidropirimidina)/(peso de las semillas) alcanzara 100 g/100 kg en base a las semillas de trigo (variedad: "Chihoku"). Estas semillas se diseminaron en macetas y, después de 8 a 10 días, se rociaron sobre las mismas conidiosporas de un patógeno del mildiú del trigo (*Erysiphe graminis f. Sp. Tritici*) para la inoculación (grupo tratado). Como control, las plántulas de trigo que no se trataron con el fármaco se inocularon de la misma manera que se describió anteriormente (grupo sin tratar).. Las plántulas se dejaron reposar en un invernadero a 20°C.

En los 7 días posteriores a la inoculación, se observaron visualmente las hojas de las plántulas de trigo para determinar la relación del área de lesión, y se calculó el valor de control.

[0314]

Los compuestos de dihidropirimidina descritos en la Tabla 11 se sometieron a la prueba de tratamiento de semillas de mildiú de trigo. Todos los compuestos demostraron valores de control del 75 % o más.

[0315]

Tabla 11

Número de compuesto			
A-58	C-89	C-135	C-210
A-60	C-93	C-148	
A-61	C-95	C-154	
A-75	C-97	C-160	
A-76	C-99	C-170	
C-54	C-101	C-176	
C-56	C-107	C-179	
C-73	C-112	C-197	

C-83	C-115	C-199	
C-85	C-117	C-207	

[0316]

Ejemplo de prueba 6 Prueba de tratamiento de riego de suelos del mildiú de trigo

Macetas (5,5 cm × 5,5 cm) en las que las semillas de trigo (variedad: Chihoku) se difundieron y se regaron con 10 ml de una solución de fármaco preparada añadiendo agua a la emulsión (I) para tener una concentración del compuesto de dihidropirimidina de 100 ppm. Después de 8 a 10 días, se rociaron sobre las mismas conidiosporas de un patógeno del mildiú del trigo (*Erysiphe graminis f. Sp. Tritici*) para la inoculación (grupo tratado). Como control, las plántulas de trigo que no se trataron con el fármaco se inocularon de la misma manera que se describió anteriormente (grupo sin tratar).. Las plántulas se dejaron reposar en un invernadero a 20°C.

En los 7 días posteriores a la inoculación, se observaron visualmente las hojas de las plántulas de trigo para determinar la relación del área de lesión, y se calculó el valor de control.

[0317]

Los compuestos de dihidropirimidina descritos en la Tabla 12 se sometieron a la prueba de tratamiento de riego de suelos con mildiú de trigo. Todos los compuestos demostraron valores de control del 75 % o más.

[0318]

Tabla 12

Número de compuesto		
A-58	C-101	C-197
A-60	C-107	C-199
A-75	C-117	C-207

A-76	C-148	C-210
C-67	C-154	
C-73	C-160	
C-83	C-170	
C-93	C-179	
C-95	C-182	
C-99	C-191	

[0319]

La utilidad del compuesto de dihidropirimidina de la presente invención como ingrediente activo de nematicidas se ilustra en un ejemplo de prueba a continuación.

Ejemplo de prueba 7 Eficacia contra *Meloidogyne incognita*

Se vertió una suspensión que contenía aproximadamente 50/0,16 ml de larvas de segundo estadio (L2) de *Meloidogyne incognita* en una microplaca de 96 pocillos a 160 µl por pocillo. Luego, se vertió una solución de fármaco preparada añadiendo agua a la emulsión (I) para tener una concentración del compuesto de dihidropirimidina de 125 ppm a 40 µl por pocillo. La placa se dejó reposar a 20°C durante 4 días.

Se determinó la mortalidad y se calculó la tasa de mortalidad de nematodos. Aquellos individuos que no mostraron movimiento durante 10 segundos se consideraron muertos. La prueba se repitió dos veces.

[0320]

Los compuestos de los números de compuestos A-28, A-64, C-92 y C-145 se sometieron a la prueba de eficacia contra *Meloidogyne incognita*. Todos los compuestos demostraron una tasa de mortalidad por nematodos en *Meloidogyne incognita* del 60 % o más.

[0321]

La utilidad del compuesto de dihidropirimidina de la presente invención como ingrediente activo para agentes antifúngicos médicos/animales se ilustra en los Ejemplos de prueba a continuación.

Ejemplo de prueba 8 Prueba antimicrobiana contra *Fusarium graminearum*

Se añadió agua a la emulsión (I) de manera que la concentración del compuesto de dihidropirimidina alcanzó 125 ppm para disolver la emulsión y se obtuvo una solución de fármaco.

Se añadieron esporas de *Fusarium graminearum* y se dispersaron en un medio de extracto de levadura de sacarosa de patata, y se añadió adicionalmente la solución de fármaco descrita anteriormente y se mezcló con el mismo de manera que la concentración del compuesto de dihidropirimidina en la solución de cultivo alcanzó 15,6 ppm. La solución resultante se dispensó en una microplaca de 96 pocillos y se cultivó en la oscuridad a 20°C durante 4 días.

Después del cultivo, se midió la turbidez a una longitud de onda de 405 nm mediante un lector de microplacas y se comparó con la del caso sin tratar para determinar la tasa de inhibición del crecimiento de *Fusarium graminearum* (%).

[0322]

Los compuestos de dihidropirimidina descritos en la Tabla 13 se sometieron a la prueba antimicrobiana contra *Fusarium graminearum*. Todos los compuestos demostraron excelentes tasas de inhibición del crecimiento del 50 % o más.

[0323]

Tabla 13

Número de compuesto					
A-2	A-92	C-32	C-85	C-151	D-5
A-14	A-93	C-33	C-87	C-154	D-7
A-15	A-95	C-34	C-89	C-156	D-8
A-17	A-96	C-36	C-93	C-158	D-9
A-23	A-97	C-39	C-95	C-160	D-11
A-24	A-99	C-41	C-97	C-162	D-13

A-37	A-100	C-43	C-99	C-168	D-14
A-38	A-101	C-45	C-101	C-170	D-20
A-42	A-102	C-47	C-103	C-172	D-22
A-46	A-105	C-49	C-105	C-176	D-39
A-49	A-106	C-54	C-107	C-179	D-40
A-51	A-107	C-56	C-109	C-182	D-41
A-58	B-7	C-58	C-111	C-183	D-43
A-60	B-8	C-60	C-112	C-186	D-48
A-61	C-2	C-62	C-115	C-188	D-49
A-63	C-4	C-63	C-117	C-194	D-50
A-64	C-6	C-67	C-122	C-197	D-52
A-69	C-10	C-69	C-124	C-199	D-53
A-70	C-12	C-71	C-126	C-202	D-54
A-75	C-14	C-73	C-127	C-207	D-55
A-76	C-15	C-75	C-129	C-210	D-56
A-79	C-22	C-77	C-135	C-213	D-63
A-83	C-24	C-79	C-137	C-219	
A-88	C-25	C-81	C-141	D-1	
A-90	C-29	C-83	C-148	D-2	

[0324]

Ejemplo de prueba 9 Prueba antimicrobiana contra *Aspergillus niger*

Se añadieron esporas de *Aspergillus niger* y se dispersaron en un medio Vogel, y se añadió un compuesto de dihidropirimidina disuelto en dimetilsulfóxido y se mezcló con el mismo a 25 ppm. La solución resultante se dispensó en una microplaca de 96 pocillos y se cultivó en la oscuridad a 25°C durante 4 días.

Después del cultivo, se midió la turbidez a una longitud de onda de 405 nm mediante un lector de microplacas y se comparó con la del caso

no tratado para determinar la inhibición del crecimiento de *Aspergillus niger* (%).

[0325]

Los compuestos de dihidropirimidina descritos en la Tabla 14 se sometieron a la prueba antimicrobiana contra *Aspergillus niger*. Todos los compuestos demostraron excelentes tasas de inhibición del crecimiento del 50 % o más.

[0326]

Tabla 14

Número de compuesto				
A-1	A-95	C-89	C-168	D-54
A-7	A-96	C-93	C-170	D-56
A-14	A-97	C-95	C-172	
A-23	A-100	C-99	C-176	
A-24	A-101	C-101	C-179	
A-37	A-102	C-103	C-182	
A-38	C-43	C-107	C-186	
A-42	C-54	C-109	C-188	
A-51	C-56	C-112	C-194	
A-58	C-58	C-115	C-197	
A-60	C-60	C-117	C-199	
A-61	C-62	C-124	C-202	
A-63	C-63	C-126	C-207	
A-75	C-69	C-129	C-210	
A-76	C-73	C-135	C-213	
A-79	C-75	C-137	D-11	
A-80	C-77	C-141	D-20	
A-88	C-79	C-148	D-22	
A-90	C-81	C-154	D-52	
A-93	C-83	C-160	D-53	

Aplicación industrial

[0327]

Dado que aquellos seleccionados al azar entre los compuestos de dihidropirimidina de la presente invención ejercen los efectos descritos anteriormente, el compuesto de dihidropirimidina de la presente invención, incluidos los compuestos que no se ejemplifican, son compuestos que tienen el efecto antimicrobiano y bactericida y el efecto nematicida, que no causan fitotoxicidad para las plantas y poca influencia en los seres humanos, el ganado y los peces, y son útiles como pesticidas, nematicidas y agentes antifúngicos médicos/animales.