DESCRIPCIÓN

TÍTULO:

COMPUESTO HETEROCÍCLICO QUE CONTIENE NITRÓGENO QUE TIENE UN GRUPO OXIMA, HERBICIDA AGRÍCOLA U HORTÍCOLA QUE COMPRENDE EL COMPUESTO Y MÉTODO PARA USAR EL COMPUESTO O EL HERBICIDA

CAMPO TÉCNICO

[0001] La presente invención se refiere a un compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno que tiene un grupo oxima y una de sus sales, un herbicida agrícola u hortícola que comprende el compuesto o su sal como un ingrediente activo y un método para usar el compuesto o su sal o el herbicida.

ARTE PREVIO

[0002] La literatura de patente 1 describe ciertos tipos de compuestos heterocíclicos condensados que contienen nitrógeno que tienen un grupo oxima que presentan actividad insecticida. Sin embargo, la literatura no describe la estructura específica del compuesto de la presente invención, ni revela o sugiere compuestos útiles como herbicidas.

LISTA DE REFERENCIA

Literatura de patente

[0003] Literatura de patente 1: WO 2017/065183

SÍNTESIS DE LA INVENCIÓN

PROBLEMA TÉCNICO

[0004] Un suministro de alimentos estable y seguro es esencial para resolver la crisis alimenticia que se anticipa en un futuro cercano debido al crecimiento de la población global población. El suministro estable y seguro de alimentos requiere la eliminación o el control económico y eficaz de las malezas que interfieren en el cultivo y la cosecha. Por lo tanto, cada vez es más importante desarrollar nuevos herbicidas y reguladores

del crecimiento de las plantas que puedan aportar soluciones a este problema. Para responder a tales demandas sociales, la presente invención pretende proporcionar un herbicida novedoso que tenga tanto una alta seguridad para los cultivos como una excelente actividad herbicida contra las malezas. Además, en vista del envejecimiento de los agricultores, existe una demanda de diversos tipos de métodos de aplicación que ahorren trabajo y de la creación de herbicidas agrícolas u hortícolas adecuados para tales métodos de aplicación.

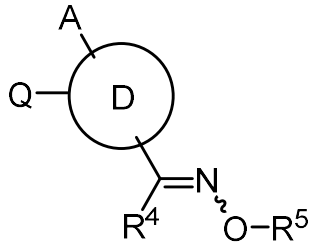
SOLUCIÓN AL PROBLEMA

[0005] Después de llevar a cabo una extensa investigación para desarrollar un nuevo herbicida agrícola u hortícola, los presentes inventores descubrieron que el compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno que tiene un grupo oxima representado por la fórmula general (1) de la presente invención o una sal de la misma es útil como herbicida agrícola u hortícola. Basándose en este hallazgo, los presentes inventores completaron la presente invención.

[0005] Es decir, la presente invención incluye lo siguiente.

[1] Un compuesto representado por la fórmula general (1):

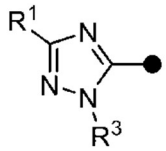
[Quím. 1]



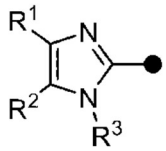
(1)

{en donde Q representa un grupo representado por los siguientes Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q10, Q11, Q12, Q13, Q14, Q15, Q16, Q17 o Q18:

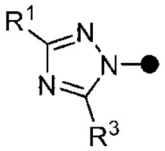
[Quím. 2]



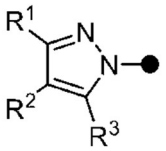
Q1



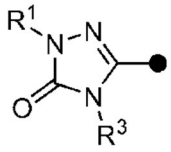
Q2



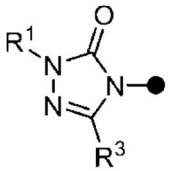
Q3



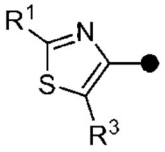
Q4



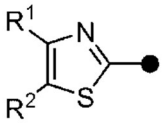
Q5



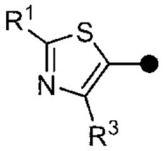
Q6



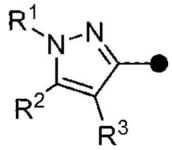
Q7



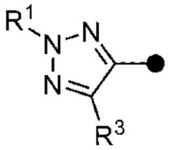
Q8



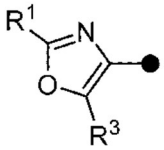
Q9



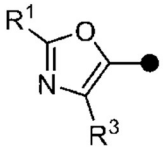
Q10



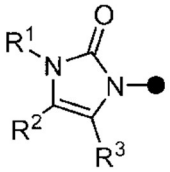
Q11



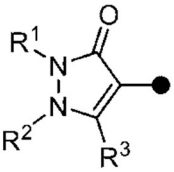
Q12



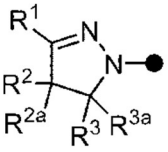
Q13



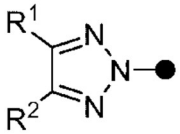
Q14



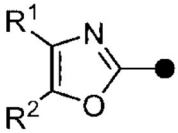
Q15



Q16



Q17



Q18

(en donde R^1 representa

(a1) un átomo de halógeno;

(a2) un grupo alquilo (C_1–C_6);

(a3) un grupo alquenilo (C_2–C_6);

(a4) un grupo alquinilo (C_2–C_6);
(a5) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6);
(a6) un grupo haloalquilo (C_1–C_6);
(a7) un grupo haloalquenilo (C_2–C_6);
(a8) un grupo haloalquinilo (C_2–C_6);
(a9) un grupo halocicloalquilo (C_3–C_6);
(a10) un grupo dioxolanilo;
(a11) un grupo dioxanilo;
(a12) un grupo dioxepanilo;
(a13) un grupo dihidropiranilo;
(a14) un grupo tetrahidropiranilo;
(a15) un grupo tetrahidrotiopiranilo;
(a16) un grupo piperidinilo;
(a17) un grupo piperidinilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un grupo alquilo (C_1–C_6), un grupo alquil (C_1–C_6)–carbonilo y un grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo;
(a18) un grupo tienilo;
(a19) un grupo tienilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, de un grupo Y de sustituyentes;
(a20) un grupo tiazolilo;
(a21) un grupo tiazolilo sustituido que tiene 1 o 2 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a22) un grupo tiadiazolilo;
(a23) un grupo tiadiazolilo sustituido que tiene un sustituyente en el anillo, seleccionado del grupo Y de sustituyentes;
(a24) un grupo pirazolilo;
(a25) un grupo pirazolilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;

(a26) un grupo fenilo;
(a27) un grupo fenilo sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a28) un grupo piridilo;
(a29) un grupo piridilo sustituido que tiene 1 a 4 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a30) un grupo piridazinilo;
(a31) un grupo piridazinilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a32) un grupo pirimidinilo;
(a33) un grupo pirimidinilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a34) un grupo pirazinilo;
(a35) un grupo pirazinilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a36) un grupo amino;
(a37) un grupo carboxilo;
(a38) un grupo alcoxi (C_1–C_6);
(a39) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6);
(a40) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilo;
(a41) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfinilo;
(a42) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfonilo;
(a43) un grupo cicloalquenilo (C_3–C_6);
(a44) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–alquilo (C_1–C_6);
(a45) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilalquilo (C_1–C_6);
(a46) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfinilalquilo (C_1–C_6);
(a47) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfonilalquilo (C_1–C_6);
(a48) un grupo alquil (C_1–C_6)–carbonilo;
(a49) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo;

(a50) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–carbonilo;
(a51) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6)–carbonilo;
(a52) un grupo fenilcarbonilo;
(a53) un grupo fenilcarbonilo sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a54) un grupo fenilaminocarbonilo;
(a55) un grupo fenilaminocarbonilo sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a56) un grupo benzhidrilidenamino;
(a57) un grupo oxopirrolidinilo;
(a58) un grupo oxopiridilo;
(a59) un grupo oxopiridilo sustituido que tiene 1 a 4 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo (C_1–C_6);
(a60) un grupo dioxanilo sustituido que tiene 1 a 4 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo (C_1–C_6);
(a61) un grupo furanilo;
(a62) un grupo furanilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a63) un grupo isotiazolilo;
(a64) un grupo isotiazolilo sustituido que tiene 1 o 2 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a65) un grupo oxazolilo;
(a66) un grupo oxazolilo sustituido que tiene 1 o 2 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a67) un grupo isoxazolilo;

(a68) un grupo isoxazolilo sustituido que tiene 1 o 2 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a69) un grupo quinolinilo;
(a70) un grupo quinolinilo sustituido que tiene 1 a 6 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a71) un grupo benzotienilo;
(a72) un grupo benzotienilo sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a73) un grupo fenoxi;
(a74) un grupo fenoxi sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a75) un grupo fenilalquilo (C_1–C_6);
(a76) un grupo fenilalquilo (C_1–C_6) sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a77) un grupo fenilalcoxi (C_1–C_6);
(a78) un grupo fenilalcoxi (C_1–C_6) sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a79) un grupo alquil (C_1–C_6)–amino;
(a80) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6)–carbonilamino;
(a81) un grupo oxazolidinonilo;
(a82) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–alcoxi (C_1–C_6);
(a83) un grupo tetrahidrofuranilalcoxi (C_1–C_6); o
(a84) un grupo cicloalquil (C_3–C_6)–alcoxi (C_1–C_6),

R^2 representa

(b1) un átomo de hidrógeno;
(b2) un átomo de halógeno; o
(b3) un grupo alquilo (C_1–C_6),

R^{2a} representa

(b1') un átomo de hidrógeno; o

(b2') un grupo alquilo (C_1–C_6),

R^3 representa

(c1) un átomo de hidrógeno;

(c2) un átomo de halógeno;

(c3) un grupo hidroxi;

(c4) un grupo alquilo (C_1–C_6);

(c5) un grupo alquenilo (C_2–C_6);

(c6) un grupo alquinilo (C_2–C_6);

(c7) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6);

(c8) un grupo haloalquilo (C_1–C_6);

(c9) un grupo haloalquenilo (C_2–C_6);

(c10) un grupo haloalquinilo (C_2–C_6);

(c11) un grupo halocicloalquilo (C_3–C_6);

(c12) un grupo alcoxi (C_1–C_6);

(c13) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilo;

(c14) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfinilo;

(c15) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfonilo;

(c16) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6);

(c17) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–sulfanilo;

(c18) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–sulfinilo;

(c19) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–sulfonilo;

(c20) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo; o

(c21) un grupo alquil (C_1–C_6)–amino, o

R^2 y R^3 se pueden unir entre sí para formar un anillo de 5 o 6 miembros,

R^{3a} representa

(c1') un átomo de hidrógeno; o

(c2') un grupo alquilo (C_1–C_6),

el grupo Y de sustituyentes consiste en

(d1) un átomo de halógeno;

(d2) un grupo ciano;

(d3) un grupo nitro;

(d4) un grupo amino;

(d5) un grupo alquilo (C_1–C_6);
(d6) un grupo alquenilo (C_2–C_6);
(d7) un grupo alquinilo (C_2–C_6);
(d8) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6);
(d9) un grupo haloalquilo (C_1–C_6);
(d10) un grupo haloalquenilo (C_2–C_6);
(d11) un grupo haloalquinilo (C_2–C_6);
(d12) un grupo halocicloalquilo (C_3–C_6);
(d13) un grupo alcoxi (C_1–C_6);
(d14) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilo;
(d15) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfinilo;
(d16) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfonilo;
(d17) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6);
(d18) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–sulfanilo;
(d19) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–sulfinilo;
(d20) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–sulfonilo;
(d21) un grupo N–(alquil (C_1–C_6)–carbonil)amino;
(d22) un grupo N,N–di–(alquil (C_1–C_6)–carbonil)amino, en donde los grupos alquil (C_1–C_6)–carbonilo pueden ser iguales o diferentes;
(d23) un grupo dialcoxi (C_1–C_6)–fosfanilo, en donde los grupos alcoxi (C_1–C_6) pueden ser iguales o diferentes;
(d24) un grupo imidazolilo;
(d25) un grupo imidazolilo que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo (C_1–C_6);
(d26) un grupo fenilo;
(d27) un grupo fenilo que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo (C_1–C_6);
(d28) un grupo piridilo;

(d29) un grupo piridilo que tiene 1 a 4 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo (C_1–C_6);
(d30) un grupo dialquil (C_1–C_6)–amino;
(d31) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo; y
(d32) un grupo metilendioxi que se forma a partir de dos sustituyentes del grupo Y adyacentemente unidos entre sí y se puede sustituir por 1 o 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo fenilo y un grupo alquilo (C_1–C_6), y

cada círculo sólido representa la posición de enlace con D),

R^4 representa
(e1) un átomo de hidrógeno;
(e2) un grupo amino;
(e3) un grupo alquilo (C_1–C_6);
(e4) un grupo N–alquil (C_1–C_6)–amino;
(e5) un grupo N,N–dialquil (C_1–C_6)–amino, en donde los grupos alquilo (C_1–C_6) pueden ser iguales o diferentes;
(e6) un grupo N–(alquil (C_1–C_6)–carbonil)amino;
(e7) un grupo N,N–di–(alquil (C_1–C_6)–carbonil)amino, en donde los grupos alquil (C_1–C_6)–carbonilo pueden ser iguales o diferentes;
(e8) un grupo N–(haloalquil (C_1–C_6)–carbonil)amino;
(e9) un grupo N–(alcoxi (C_1–C_6)–carbonil)amino; o
(e10) un grupo N–alquil (C_1–C_6)–N–(alquil (C_1–C_6)–carbonil)amino,

R^5 representa
(f1) un grupo alquilo (C_1–C_6);
(f2) un grupo alquenilo (C_2–C_6);
(f3) un grupo alquinilo (C_2–C_6);
(f4) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6);
(f5) un grupo haloalquilo (C_1–C_6);
(f6) un grupo haloalquenilo (C_2–C_6);

(f7) un grupo haloalquinilo (C_2–C_6);

(f8) un grupo halocicloalquilo (C_3–C_6);

(f9) un grupo cicloalquil (C_3–C_6)–alquilo (C_1–C_6);

(f10) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–alquilo (C_1–C_6);

(f11) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilalquilo (C_1–C_6);

(f12) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfinilalquilo (C_1–C_6);

(f13) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfonilalquilo (C_1–C_6); o

(f14) un grupo fenilalquilo (C_1–C_6),

A representa

(g1) un grupo alcoxi (C_1–C_6);

(g2) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6);

(g3) un grupo N–alquil (C_1–C_6)–aminocarbonilo;

(g4) un grupo N,N–dialquil (C_1–C_6)–aminocarbonilo, en donde los grupos alquil (C_1–C_6)–carbonilo pueden ser iguales o diferentes;

(g5) CO_2R^7, en donde R^7 representa

(h1) un átomo de hidrógeno,

(h2) un grupo alquilo (C_1–C_6),

(h3) un grupo alquenilo (C_2–C_6),

(h4) un grupo alquinilo (C_2–C_6),

(h5) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6),

(h6) un grupo haloalquilo (C_1–C_6),

(h7) un grupo haloalquenilo (C_2–C_6),

(h8) un grupo haloalquinilo (C_2–C_6),

(h9) un grupo halocicloalquilo (C_3–C_6), o

(h10) un grupo fenilalquilo (C_1–C_6);

(g6) SO_nR^8, en donde R^8 representa

(i1) un grupo alquilo (C_1–C_6),

(i2) un grupo alquenilo (C_2–C_6),

(i3) un grupo alquinilo (C_2–C_6),

(i4) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6),

(i5) un grupo haloalquilo (C_1–C_6),

(i6) un grupo haloalquenilo (C_2–C_6),

(i7) un grupo haloalquinilo (C_2–C_6),

(i8) un grupo halocicloalquilo (C_3–C_6), o

(i9) un grupo alquil (C_1–C_6)-carbonilalquilo (C_1–C_6), y

n representa 0, 1 o 2; o

(g7) $SO_2N(R^9)R^{10}$, en donde R^9 y R^{10} representan

(j1) un átomo de hidrógeno,

(j2) un grupo alquilo (C_1–C_6),

(j3) un grupo alquenilo (C_2–C_6),

(j4) un grupo alquinilo (C_2–C_6),

(j5) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6),

(j6) un grupo haloalquilo (C_1–C_6),

(j7) un grupo haloalquenilo (C_2–C_6),

(j8) un grupo haloalquinilo (C_2–C_6),

(j9) un grupo halocicloalquilo (C_3–C_6),

(j10) un grupo fenilalquilo (C_1–C_6)

(j11) un grupo alquil (C_1–C_6)-carbonilo,

(j12) un grupo alcoxi (C_1–C_6)-carbonilo,

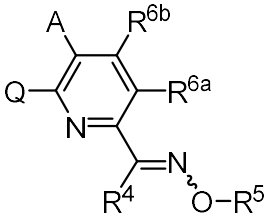
(j13) un grupo haloalquil (C_1–C_6)-carbonilo, o

(j14) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6)-carbonilo, y

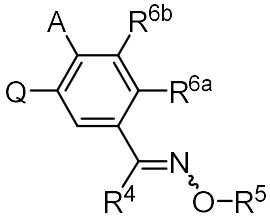
R^9 y R^{10} pueden ser iguales o diferentes, y

D sustituido con A, Q y $C(R^4)=N\sim OR^5$ representa un anillo representado por los siguientes D1, D2, D3 o D4:

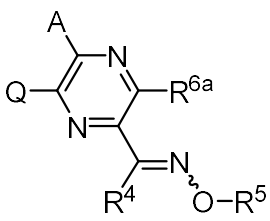
[Quím. 3]



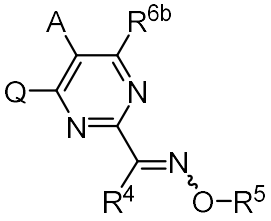
D1



D2



D3



D4

en donde R^{6a} y R^{6b} representan

(k1) un átomo de hidrógeno;

(k2) un átomo de halógeno; o

(k3) un grupo alquilo (C_1–C_6), y

R^{6a} y R^{6b} pueden ser iguales o diferentes}, o

una de sus sales.

[0006] [2] El compuesto o su sal de acuerdo con en punto anterior [1], en donde

Q y D son como se definen en el punto anterior [1],

R^1 es

(a1) un átomo de halógeno;

(a2) un grupo alquilo (C_1–C_6);

(a3) un grupo alquenilo (C_2–C_6);

(a5) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6);

(a9) un grupo halocicloalquilo (C_3–C_6);

(a10) un grupo dioxolanilo;

(a11) un grupo dioxanilo;

(a12) un grupo dioxepanilo;

(a13) un grupo dihidropiranilo;

(a14) un grupo tetrahidropiranilo;

(a15) un grupo tetrahidrotiopiranilo;

(a16) un grupo piperidinilo;

(a17) un grupo piperidinilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un grupo alquilo (C_1–C_6), un grupo alquil (C_1–C_6)–carbonilo y un grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo;

(a18) un grupo tienilo;

(a19) un grupo tienilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, de un grupo Y de sustituyentes;

(a20) un grupo tiazolilo;

(a21) un grupo tiazolilo sustituido que tiene 1 o 2 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;

(a22) un grupo tiadiazolilo;

(a23) un grupo tiadiazolilo sustituido que tiene un sustituyente en el anillo, seleccionado del grupo Y de sustituyentes;

(a24) un grupo pirazolilo;
(a25) un grupo pirazolilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a26) un grupo fenilo;
(a27) un grupo fenilo sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a28) un grupo piridilo;
(a29) un grupo piridilo sustituido que tiene 1 a 4 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a30) un grupo piridazinilo;
(a31) un grupo piridazinilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a32) un grupo pirimidinilo;
(a33) un grupo pirimidinilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a34) un grupo pirazinilo;
(a35) un grupo pirazinilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a36) un grupo amino;
(a37) un grupo carboxilo;
(a38) un grupo alcoxi (C_1–C_6);
(a39) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6);
(a40) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilo;
(a41) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfinilo;
(a42) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfonilo;
(a43) un grupo cicloalquenilo (C_3–C_6);
(a44) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–alquilo (C_1–C_6);
(a45) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilalquilo (C_1–C_6);

(a46) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfinilalquilo (C_1–C_6);
(a47) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfonilalquilo (C_1–C_6);
(a48) un grupo alquil (C_1–C_6)–carbonilo;
(a49) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo;
(a50) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–carbonilo;
(a51) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6)–carbonilo;
(a52) un grupo fenilcarbonilo;
(a53) un grupo fenilcarbonilo sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a54) un grupo fenilaminocarbonilo;
(a55) un grupo fenilaminocarbonilo sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a56) un grupo benzhidrilidenamino;
(a57) un grupo oxopirrolidinilo;
(a58) un grupo oxopiridilo;
(a59) un grupo oxopiridilo sustituido que tiene 1 a 4 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo (C_1–C_6);
(a60) un grupo dioxanilo sustituido que tiene 1 a 4 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo (C_1–C_6);
(a61) un grupo furanilo;
(a62) un grupo furanilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a63) un grupo isotiazolilo;
(a64) un grupo isotiazolilo sustituido que tiene 1 o 2 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a69) un grupo quinolinilo;

(a70) un grupo quinolinilo sustituido que tiene 1 a 6 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a71) un grupo benzotienilo;
(a72) un grupo benzotienilo sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a73) un grupo fenoxi;
(a74) un grupo fenoxi sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a75) un grupo fenilalquilo (C_1–C_6);
(a76) un grupo fenilalquilo (C_1–C_6) sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a77) un grupo fenilalcoxi (C_1–C_6);
(a78) un grupo fenilalcoxi (C_1–C_6) sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a79) un grupo alquil (C_1–C_6)-amino;
(a80) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6)-carbonilamino;
(a81) un grupo oxazolidinonilo;
(a82) un grupo alcoxi (C_1–C_6)-alcoxi (C_1–C_6);
(a83) un grupo tetrahidrofuranilalcoxi (C_1–C_6); o
(a84) un grupo cicloalquil (C_3–C_6)-alcoxi (C_1–C_6),

R^2 es

(b1) un átomo de hidrógeno;
(b2) un átomo de halógeno; o
(b3) un grupo alquilo (C_1–C_6),

R^{2a} es

(b1') un átomo de hidrógeno; o
(b2') un grupo alquilo (C_1–C_6),

R^3 es

(c1) un átomo de hidrógeno;

(c2) un átomo de halógeno;

(c3) un grupo hidroxi;

(c4) un grupo alquilo (C_1–C_6);

(c5) un grupo alquenilo (C_2–C_6);

(c6) un grupo alquinilo (C_2–C_6);

(c7) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6);

(c8) un grupo haloalquilo (C_1–C_6);

(c12) un grupo alcoxi (C_1–C_6);

(c13) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilo;

(c14) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfinilo;

(c15) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfonilo;

(c16) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6);

(c17) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–sulfanilo;

(c18) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–sulfinilo;

(c19) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–sulfonilo;

(c20) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo; o

(c21) un grupo alquil (C_1–C_6)–amino, o

R^2 y R^3 se pueden unir entre sí para formar un anillo de 5 o 6 miembros,

R^{3a} es

(c1') un átomo de hidrógeno; o

(c2') un grupo alquilo (C_1–C_6),

el grupo Y de sustituyentes consiste en

(d1) un átomo de halógeno;

(d2) un grupo ciano;

(d3) un grupo nitro;

(d4) un grupo amino;

(d5) un grupo alquilo (C_1–C_6);

(d8) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6);

(d9) un grupo haloalquilo (C_1–C_6);

(d13) un grupo alcoxi (C_1–C_6);

(d14) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilo;

(d15) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfinilo;

(d16) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfonilo;

(d17) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6);
(d18) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–sulfanilo;
(d19) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–sulfinilo;
(d20) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–sulfonilo;
(d21) un grupo N–(alquil (C_1–C_6)–carbonil)amino;
(d22) un grupo N,N–di–(alquil (C_1–C_6)–carbonil)amino, en donde los grupos alquil (C_1–C_6)–carbonilo pueden ser iguales o diferentes;
(d23) un grupo dialcoxi (C_1–C_6)–fosfanilo, en donde los grupos alcoxi (C_1–C_6) pueden ser iguales o diferentes;
(d24) un grupo imidazolilo;
(d25) un grupo imidazolilo que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo (C_1–C_6);
(d26) un grupo fenilo;
(d27) un grupo fenilo que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo (C_1–C_6);
(d28) un grupo piridilo;
(d29) un grupo piridilo que tiene 1 a 4 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo (C_1–C_6);
(d30) un grupo dialquil (C_1–C_6)–amino;
(d31) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo; y
(d32) un grupo metilendioxi que se forma a partir de dos sustituyentes del grupo Y adyacentemente unidos entre sí y se puede sustituir por 1 o 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo fenilo y un grupo alquilo (C_1–C_6),

R^4 es
(e1) un átomo de hidrógeno;
(e2) un grupo amino;
(e3) un grupo alquilo (C_1–C_6);

(e4) un grupo N-alquil (C_1-C_6)-amino;

(e5) un grupo N,N-dialquil (C_1-C_6)-amino, en donde los grupos alquilo (C_1-C_6) pueden ser iguales o diferentes;

(e6) un grupo N-(alquil (C_1-C_6)-carbonil)amino;

(e7) un grupo N,N-di-(alquil (C_1-C_6)-carbonil)amino, en donde los grupos alquil (C_1-C_6)-carbonilo pueden ser iguales o diferentes; o

(e8) un grupo N-(haloalquil (C_1-C_6)-carbonil)amino,

R^5 es

(f1) un grupo alquilo (C_1-C_6);

(f2) un grupo alquenilo (C_2-C_6);

(f3) un grupo alquinilo (C_2-C_6);

(f4) un grupo cicloalquilo (C_3-C_6);

(f5) un grupo haloalquilo (C_1-C_6);

(f9) un grupo cicloalquil (C_3-C_6)-alquilo (C_1-C_6);

(f10) un grupo alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6);

(f11) un grupo alquil (C_1-C_6)-sulfanilalquilo (C_1-C_6);

(f12) un grupo alquil (C_1-C_6)-sulfinilalquilo (C_1-C_6); o

(f13) un grupo alquil (C_1-C_6)-sulfonilalquilo (C_1-C_6),

A es

(g1) un grupo alcoxi (C_1-C_6);

(g3) un grupo N-alquil (C_1-C_6)-aminocarbonilo;

(g4) un grupo N,N-dialquil (C_1-C_6)-aminocarbonilo, en donde los grupos alquil (C_1-C_6)-carbonilo pueden ser iguales o diferentes;

(g5') CO_2R^7, en donde R^7 representa

(h1) un átomo de hidrógeno,

(h2) un grupo alquilo (C_1-C_6),

(h3) un grupo alquenilo (C_2-C_6),

(h4) un grupo alquinilo (C_2-C_6),

(h5) un grupo cicloalquilo (C_3-C_6),

(h6) un grupo haloalquilo (C_1-C_6), o

(h10) un grupo fenilalquilo (C_1-C_6);

(g6') SO_nR^8, en donde R^8 representa

(i1) un grupo alquilo (C_1–C_6),

(i2) un grupo alquenilo (C_2–C_6),

(i3) un grupo alquinilo (C_2–C_6),

(i4) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6),

(i5) un grupo haloalquilo (C_1–C_6), o

(i9) un grupo alquil (C_1–C_6)-carbonilalquilo (C_1–C_6), y

n representa 0, 1 o 2; o

(g7') $SO_2N(R^9)R^{10}$, en donde R^9 y R^{10} representan

(j1) un átomo de hidrógeno,

(j2) un grupo alquilo (C_1–C_6),

(j3) un grupo alquenilo (C_2–C_6),

(j4) un grupo alquinilo (C_2–C_6),

(j5) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6),

(j11) un grupo alquil (C_1–C_6)-carbonilo,

(j12) un grupo alcoxi (C_1–C_6)-carbonilo,

(j13) un grupo haloalquil (C_1–C_6)-carbonilo, o

(j14) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6)-carbonilo, y

R^9 y R^{10} pueden ser iguales o diferentes, y

R^{6a} y R^{6b} son cada uno

(k1) un átomo de hidrógeno;

(k2) un átomo de halógeno; o

(k3) un grupo alquilo (C_1–C_6), y

R^{6a} y R^{6b} pueden ser iguales o diferentes.

[0007] [3] El compuesto o su sal de acuerdo con el punto anterior [1], en donde Q y D son como se definen en el punto anterior [1],

R^1 es

(a1) un átomo de halógeno;

(a2) un grupo alquilo (C_1–C_6);

(a3) un grupo alquenilo (C_2–C_6);

(a5) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6);

(a13) un grupo dihidropiranilo;

(a14) un grupo tetrahidropiranilo;

(a16) un grupo piperidinilo;

(a18) un grupo tienilo;
(a19) un grupo tienilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, de un grupo Y de sustituyentes;
(a20) un grupo tiazolilo;
(a21) un grupo tiazolilo sustituido que tiene 1 o 2 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a22) un grupo tiadiazolilo;
(a23) un grupo tiadiazolilo sustituido que tiene un sustituyente en el anillo, seleccionado del grupo Y de sustituyentes;
(a24) un grupo pirazolilo;
(a25) un grupo pirazolilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, de un grupo Y de sustituyentes;
(a26) un grupo fenilo;
(a27) un grupo fenilo sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a28) un grupo piridilo;
(a29) un grupo piridilo sustituido que tiene 1 a 4 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a32) un grupo pirimidinilo;
(a34) un grupo pirazinilo;
(a36) un grupo amino;
(a37) un grupo carboxilo;
(a38) un grupo alcoxi (C_1–C_6);
(a39) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6);
(a40) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilo;
(a42) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfonilo;
(a43) un grupo cicloalquenilo (C_3–C_6);
(a44) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–alquilo (C_1–C_6);

(a45) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilalquilo (C_1–C_6);
(a46) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfinilalquilo (C_1–C_6);
(a47) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfonilalquilo (C_1–C_6);
(a48) un grupo alquil (C_1–C_6)–carbonilo;
(a49) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo;
(a52) un grupo fenilcarbonilo;
(a54) un grupo fenilaminocarbonilo;
(a56) un grupo benzhidrilidenamino;
(a57) un grupo oxopirrolidinilo;
(a58) un grupo oxopiridilo;
(a59) un grupo oxopiridilo sustituido que tiene 1 a 4 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo (C_1–C_6);
(a60) un grupo dioxanilo sustituido que tiene 1 a 4 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo (C_1–C_6);
(a61) un grupo furanilo;
(a63) un grupo isotiazolilo;
(a64) un grupo isotiazolilo sustituido que tiene 1 o 2 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a69) un grupo quinolinilo;
(a71) un grupo benzotienilo;
(a74) un grupo fenoxi sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a75) un grupo fenilalquilo (C_1–C_6);
(a82) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–alcoxi (C_1–C_6);
(a83) un grupo tetrahidrofuranilalcoxi (C_1–C_6); o
(a84) un grupo cicloalquil (C_3–C_6)–alcoxi (C_1–C_6),

R^2 es

(b1) un átomo de hidrógeno;

(b2) un átomo de halógeno; o

(b3) un grupo alquilo (C_1–C_6),

R^{2a} es

(b1') un átomo de hidrógeno,

R^3 es

(c1) un átomo de hidrógeno;

(c2) un átomo de halógeno;

(c3) un grupo hidroxi;

(c4) un grupo alquilo (C_1–C_6);

(c5) un grupo alquenilo (C_2–C_6);

(c8) un grupo haloalquilo (C_1–C_6);

(c12) un grupo alcoxi (C_1–C_6);

(c13) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilo;

(c14) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfinilo;

(c15) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfonilo; o

(c20) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo, o

R^2 y R^3 se pueden unir entre sí para formar un anillo de 5 o 6 miembros,

R^{3a} es

(c1') un átomo de hidrógeno,

el grupo Y de sustituyentes consiste en

(d1) un átomo de halógeno;

(d2) un grupo ciano;

(d3) un grupo nitro;

(d4) un grupo amino;

(d5) un grupo alquilo (C_1–C_6);

(d8) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6);

(d9) un grupo haloalquilo (C_1–C_6);

(d13) un grupo alcoxi (C_1–C_6);

(d14) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilo;

(d17) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6);

(d21) un grupo N–(alquil (C_1–C_6)–carbonil)amino;

(d24) un grupo imidazolilo;

(d26) un grupo fenilo;

(d28) un grupo piridilo;

(d30) un grupo dialquil (C_1–C_6)–amino;

(d31) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo; y

(d32) un grupo metilendioxi que se forma a partir de dos sustituyentes del grupo Y adyacentemente unidos entre sí y se puede sustituir por 1 o 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo fenilo y un grupo alquilo (C_1–C_6),

R^4 es

(e2) un grupo amino;

(e3) un grupo alquilo (C_1–C_6);

(e6) un grupo N–(alquil (C_1–C_6)–carbonil)amino;

(e7) un grupo N,N–di–(alquil (C_1–C_6)–carbonil)amino, en donde los grupos alquil (C_1–C_6)–carbonilo pueden ser iguales o diferentes; o

(e8) un grupo N–(haloalquil (C_1–C_6)–carbonil)amino,

R^5 es

(f1) un grupo alquilo (C_1–C_6);

(f5) un grupo haloalquilo (C_1–C_6); o

(f10) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–alquilo (C_1–C_6),

A es

(g1) un grupo alcoxi (C_1–C_6);

(g4) un grupo N,N–dialquil (C_1–C_6)–aminocarbonilo, en donde los grupos alquil (C_1–C_6)–carbonilo pueden ser iguales o diferentes;

(g5”) CO_2R^7, en donde R^7 representa

(h1) un átomo de hidrógeno, o

(h2) un grupo alquilo (C_1–C_6);

(g6”) SO_nR^8, en donde R^8 representa

(i1) un grupo alquilo (C_1–C_6), o

(i9) un grupo alquil (C_1–C_6)–carbonilalquilo (C_1–C_6), y

n representa 2; o

(g7”) $SO_2N(R^9)R^{10}$, en donde R^9 y R^{10} representan

(j1) un átomo de hidrógeno,

(j2) un grupo alquilo (C_1–C_6),

(j11) un grupo alquil (C_1–C_6)–carbonilo, o

(j12) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo, y

R^9 y R^{10} pueden ser iguales o diferentes, y

R^{6a} y R^{6b} son cada uno

(k1) un átomo de hidrógeno.

[0008] [4] El compuesto o su sal de acuerdo con el punto anterior [1], en donde

R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^{6a}, R^{6b}, A y el grupo Y de sustituyentes son como se definen en el punto anterior [1],

Q es Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9 o Q10, y

D es D1 o D2.

[5] El compuesto o su sal de acuerdo con el punto anterior [1], en donde

R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^{6a}, R^{6b}, A y el grupo Y de sustituyentes son como se definen en el punto anterior [1],

Q es Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8 o Q10, y

D es D1.

[6] El compuesto o su sal de acuerdo con el punto anterior [2], en donde

R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^{6a}, R^{6b}, A y el grupo Y de sustituyentes son como se definen en el punto anterior [2],

Q es Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9 o Q10, y

D es D1 o D2.

[7] El compuesto o su sal de acuerdo con el punto anterior [2], en donde

R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^{6a}, R^{6b}, A y el grupo Y de sustituyentes son como se definen en el punto anterior [2],

Q es Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8 o Q10, y

D es D1.

[8] El compuesto o su sal de acuerdo con el punto anterior [3], en donde

R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^{6a}, R^{6b}, A y el grupo Y de sustituyentes son como se definen en el punto anterior [3],

Q es Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9 o Q10, y

D es D1 o D2.

[9] El compuesto o su sal de acuerdo con el punto anterior [3], en donde

R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^{6a}, R^{6b}, A y el grupo Y de sustituyentes son como se definen en el punto anterior [3],

Q es Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8 o Q10, y

D es D1.

[0009] [10] Un herbicida agrícola u hortícola que comprende el compuesto o su sal de acuerdo con cualquiera de los puntos anteriores [1] a [9] como un ingrediente activo.

[11] Un método para usar un herbicida agrícola u hortícola, que comprende el tratamiento de malezas, suelo, arrozales o medios de cultivo con una cantidad eficaz del herbicida agrícola u hortícola de acuerdo con el punto anterior [10].

[12] Un método para controlar malezas, que comprende el tratamiento de malezas, suelo, arrozales o medios de cultivo con una cantidad eficaz del herbicida agrícola u hortícola de acuerdo con el punto anterior [10].

EFECTOS VENTAJOSOS DE LA INVENCIÓN

[0010] El compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno que tiene un grupo oxima de la presente invención o una de sus sales es un herbicida agrícola u hortícola muy eficaz.

DESCRIPCIÓN DE LAS FORMAS DE REALIZACIÓN

[0011] En las definiciones de la fórmula general (1) que representan el compuesto de la presente invención, “halo” significa “átomo de halógeno” y usualmente se ejemplifica por un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo o un átomo de flúor.

[0012] El grupo "alquilo (C_1–C_6)" se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o de cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n–propilo, un grupo isopropilo, un grupo n–butilo, un grupo isobutilo, un grupo sec–butilo, un grupo ter–butilo, un grupo n–pentilo, un grupo isopentilo, un grupo ter–pentilo, un grupo neopentilo, un grupo 2,3–dimetilpropilo, un grupo 1–etilpropilo, un grupo 1–metilbutilo, un grupo 2–metilbutilo, un grupo n–hexilo, un grupo isohexilo, un grupo 2–hexilo, un grupo 3–hexilo, un grupo 2–metilpentilo, un grupo 3–metilpentilo, un grupo 1,1,2–trimetil propilo, un grupo 3,3–dimetilbutilo o similares.

[0013] El "grupo alquenilo (C_2–C_6)" se refiere a un grupo alquenilo de cadena lineal o de cadena ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo vinilo, un grupo alilo, un grupo isopropenilo, un grupo 1–butenilo, un grupo 2–butenilo, un grupo 2–metil–2–propenilo, un grupo 1–metil–2–propenilo, un grupo 2–metil–1–propenilo, un grupo pentenilo, un grupo 1–hexenilo, un grupo 3,3–dimetil–1–butenilo o similares. El "grupo alquinilo (C_2–C_6)" se refiere a un grupo alquinilo de cadena lineal o de cadena ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo etinilo, un grupo 1–propinilo, un grupo 2–propinilo, un grupo 1–butinilo, un grupo 2–butinilo, un grupo 3–butinilo, un grupo 3–metil–1–propinilo, un grupo 2–metil–3–propinilo, un grupo pentinilo, un grupo 1–hexinilo, un grupo 3–metil–1–butinilo, un grupo 3,3–dimetil–1–butinilo o similares.

[0014] El "grupo cicloalquilo (C_3–C_6)" se refiere a un grupo alquilo cíclico de 3 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo o similares. El "gri`p alcoxi (C_1–C_6)" se refiere a un grupo alcoxi de cadena lineal o de cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n–propoxi, un grupo isopropoxi, un grupo n–butoxi, un grupo sec–butoxi, un grupo ter–butoxi, un grupo

n-pentiloxi, un grupo isopentiloxi, un grupo ter-pentiloxi, un grupo neopentiloxi, un grupo 2,3-dimetilpropiloxi, un grupo 1-etilpropiloxi, un grupo 1-metilbutiloxi, un grupo n-hexiloxi, un grupo isohexiloxi, un grupo 1,1,2-trimetilpropiloxi o similares. El "grupo alquenil (C_2-C_6)-oxi" se refiere a un grupo alqueniloxi de cadena lineal o de cadena ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo propeniloxi, un grupo buteniloxi, un grupo penteniloxi, un grupo hexeniloxi o similares. El "grupo alquinil (C_2-C_6)-oxi" se refiere a un grupo alquiniloxi de cadena lineal o de cadena ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo propiniloxi, un grupo butiniloxi, un grupo pentiniloxi, un grupo hexiniloxi o similares.

[0015] El "grupo alquil (C_1-C_6)-sulfanilo" se refiere a un grupo alquilsulfanilo de cadena lineal o de cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo n-propiltio, un grupo isopropiltio, un grupo n-butiltio, un grupo sec-butiltio, un grupo ter-butiltio, un grupo n-pentiltio, un grupo isopentiltio, un grupo ter-pentiltio, un grupo neopentiltio, un grupo 2,3-dimetilpropiltio, un grupo 1-etilpropiltio, un grupo 1-metilbutiltio, un grupo n-hexiltio, un grupo isohexiltio, un grupo 1,1,2-trimetilpropiltio o similares.

[0016] El "grupo alquil (C_1-C_6)-sulfinilo" se refiere a un grupo alquilsulfinilo de cadena lineal o de cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metilsulfinilo, un grupo etilsulfinilo, un grupo n-propilsulfinilo, un grupo isopropilsulfinilo, un grupo n-butilsulfinilo, un grupo sec-butilsulfinilo, un grupo ter-butilsulfinilo, un grupo n-pentilsulfinilo, un grupo isopentilsulfinilo, un grupo ter-pentilsulfinilo, un grupo neopentilsulfinilo, un grupo 2,3-dimetilpropilsulfinilo, un grupo 1-etilpropilsulfinilo, un grupo 1-metilbutilsulfinilo, un grupo n-hexilsulfinilo, un

grupo isohexilsulfinilo, un grupo 1,1,2-trimetilpropilsulfinilo o similares.

[0017] El "alquil (C_1–C_6)–sulfonilo" se refiere a un grupo alquilsulfonilo de cadena lineal o de cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo n–propilsulfonilo, un grupo isopropilsulfonilo, un grupo n–butilsulfonilo, un grupo sec–butilsulfonilo, un grupo ter–butilsulfonilo, un grupo n–pentilsulfonilo, un grupo isopentilsulfonilo, un grupo ter–pentilsulfonilo, un grupo neopentilsulfonilo, un grupo 2,3–dimetilpropilsulfonilo, un grupo 1–etilpropilsulfonilo, un grupo 1–metilbutilsulfonilo, un grupo n–hexilsulfonilo, un grupo isohexilsulfonilo, un grupo 1,1,2–trimetilpropilsulfonilo o similares.

[0018] El "grupo alquil (C_1–C_6)–carbonilo" se refiere a un grupo alquilcarbonilo de 2 a 7 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo alquilcarbonilo en donde el grupo alquilo es un grupo alquilo (C_1–C_6) como se definió con anterioridad, tales como un grupo acetilo, un grupo propanoilo, un grupo butanoilo, un grupo 2–metilpropanoilo, un grupo pentanoilo, un grupo 2–metilbutanoilo, un grupo 3–metilbutanoilo, un grupo pivaloilo, un grupo hexanoilo o similares.

[0019] El "grupo alquil (C_1–C_6)–carboniloxi" se refiere a un grupo alquilcarboniloxi de 2 a 7 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo alquilcarboniloxi, en donde el grupo alquilo es un grupo alquilo (C_1–C_6) como se definió con anterioridad, tales como un grupo acetiloxi, un grupo propanoiloxi, un grupo butanoiloxi, un grupo 2–metilpropanoiloxi, un grupo pentanoiloxi, un grupo 2–metilbutanoiloxi, un grupo 3–metilbutanoiloxi, un grupo pivaloiloxi, un grupo hexanoiloxi o similares.

[0020] El "grupo N–alquil (C_1–C_6)–aminocarbonilo" se refiere a un grupo alquilaminocarbonilo de 2 a 7 átomos de carbono en donde el grupo alquilo es un grupo alquilo de cadena lineal o

de cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo N–metilaminocarbonilo, un grupo N–etilaminocarbonilo, un grupo N–n–propilaminocarbonilo, un grupo N–isopropilaminocarbonilo, un grupo N–n–butilaminocarbonilo, un grupo N–isobutilaminocarbonilo, un grupo N–sec–butilaminocarbonilo, un grupo N–ter–butilaminocarbonilo, un grupo N–n–pentilaminocarbonilo, un grupo N–isopentilaminocarbonilo, un grupo N–ter–pentilaminocarbonilo, un grupo N–neopentilaminocarbonilo, un grupo N–n–hexilaminocarbonilo, un grupo N–isohexilaminocarbonilo o similares.

[0021] El "grupo N,N–dialquil (C_1–C_6)–aminocarbonilo" se refiere a un grupo dialquilaminocarbonilo de 3 a 13 átomos de carbono, en donde los grupos alquilo son grupos alquilo de cadena lineal o de cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, grupo N,N–dimetilaminocarbonilo, grupo N,N–dietilaminocarbonilo, grupo N,N–di–n–propilaminocarbonilo, grupo N,N–diisopropilaminocarbonilo, grupo N,N–di–n–butilaminocarbonilo, grupo N,N–di–sec–butilaminocarbonilo, grupo N,N–di–ter–butilaminocarbonilo, grupo N–metil–N–etilaminocarbonilo, grupo N–metil–N–n–propilaminocarbonilo, grupo N–metil–N–isopropilaminocarbonilo, grupo N–metil–N–n–butilaminocarbonilo, grupo N–metil–N–sec–butilaminocarbonilo, grupo N–metil–N–ter–butilaminocarbonilo, grupo N–metil–N–n–pentilaminocarbonilo, grupo N–metil–N–isopentilaminocarbonilo, grupo N–metil–N–ter–pentilaminocarbonilo, grupo N–metil–N–neopentilaminocarbonilo, grupo N–metil–N–(2,3–dimetilpropil)aminocarbonilo, grupo N–metil–N–(1–etilpropil)aminocarbonilo, grupo N–metil–N–(1–metilbutil)aminocarbonilo, grupo N–metil–N–n–hexilaminocarbonilo, grupo N–metil–N–isohexilaminocarbonilo, grupo N–metil–N–(1,1,2–trimetilpropil)aminocarbonilo o similares.

[0022] El "grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo" se refiere a un grupo alcoxicarbonilo de 2 a 7 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo alcoxicarbonilo en donde el grupo alcoxi es un grupo alcoxi (C_1–C_6) como se definió con anterioridad, tales como un grupo metoxicarbonilo, un grupo etoxicarbonilo, un grupo n–propoxicarbonilo, un grupo isopropoxicarbonilo, un grupo n–butoxicarbonilo, un grupo isobutoxicarbonilo, un grupo sec–butoxicarbonilo, un grupo ter–butoxicarbonilo, un grupo pentiloxicarbonilo o similares.

[0023] Los grupos antes mencionados "grupo alquilo (C_1–C_6)", "grupo alquenilo (C_2–C_6)", "grupo alquinilo (C_2–C_6)", "grupo alcoxi (C_1–C_6)", "grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilo", "grupo alquil (C_1–C_6)–sulfinilo", "alquil (C_1–C_6)–sulfonilo", "grupo cicloalquilo (C_3–C_6)", "grupo alquil (C_1–C_6)–carbonilo", "grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo", "grupo alquil (C_1–C_6)–carboniloxi", etc. pueden estar sustituidos con uno o más átomos de halógeno en una posición sustituible y en el caso en que cualquiera de los grupos antes enumerados esté sustituido con dos o más átomos de halógeno, te átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes.

[0024] Los grupos antes mencionados sustituidos con uno o más átomos de halógeno se expresan como un "grupo haloalquilo (C_1–C_6)", un "grupo haloalquenilo (C_2–C_6)", un "grupo haloalquinilo (C_2–C_6)", un "grupo haloalcoxi (C_1–C_6)", un "grupo haloalquil (C_1–C_6)–sulfanilo", un "grupo haloalquil (C_1–C_6)–sulfinilo", un "grupo haloalquil (C_1–C_6)–sulfonilo", un "grupo halocicloalquilo (C_3–C_6)", un "grupo haloalquil (C_1–C_6)–carbonilo", un "grupo haloalcoxi (C_1–C_6)–carbonilo", un "grupo haloalquil (C_1–C_6)–carboniloxi", etc.

[0025] En la presente invención, las expresiones "(C_1–C_6)", "(C_2–C_6)", "(C_3–C_6)", etc. representan cada uno el intervalo del número de átomos de carbono en cada grupo. La misma definición se mantiene para grupos en los que dos o más de los grupos antes mencionados se acoplan y, por ejemplo, el "grupo alcoxi (C_1–

C_6)-alquilo (C_1-C_6)" significa que un grupo alcoxi de cadena lineal o de cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono se une a un grupo alquilo de cadena lineal o de cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono.

[0026] Los ejemplos de la sal del compuesto representado por la fórmula general (1) de la presente invención incluyen sales de ácidos inorgánicos, tales como clorhidratos, sulfatos, nitratos y fosfatos; sales de ácidos orgánicos, tales como acetatos, fumaratos, maleatos, oxalatos, metansulfonatos, bencensulfonatos y p-toluensulfonatos; y sales con una base inorgánica u orgánica tales como un ion sodio, un ion potasio, un ion calcio y un ion trimetilamonio.

[0027] El compuesto representado por la fórmula general (1) de la presente invención y una de sus sales pueden tener uno o más centros quirales en la fórmula estructural y pueden existir como dos o más tipos de isómeros ópticos o diastereómeros. Todos los isómeros ópticos y mezclas de los isómeros en cualquier relación también están incluidos en la presente invención. Además, el compuesto representado por la fórmula general (1) de la presente invención y una de sus sales pueden existir como dos tipos de isómeros geométricos debido a un enlace doble de carbono-carbono y un enlace doble de carbono-nitrógeno en la fórmula estructural. Todos los isómeros geométricos y mezclas de los isómeros en cualquier relación también están incluidos en la presente invención. En otras palabras, el grupo oxima en el compuesto representado por la fórmula general (1) de la presente invención puede estar en forma de un isómero E (entgegen), isómero Z (zusammen) o una mezcla de estos isómeros.

[0028] Las formas de realización preferidas del compuesto representado por la fórmula general (1) de la presente invención se muestran más abajo.

Q es preferentemente Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9 o Q10 y más preferentemente, Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8 o Q10.

[0029] R^1 es preferentemente

(a1) un átomo de halógeno;

(a2) un grupo alquilo (C_1–C_6);

(a3) un grupo alquenilo (C_2–C_6);

(a5) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6);

(a9) un grupo halocicloalquilo (C_3–C_6);

(a10) un grupo dioxolanilo;

(a11) un grupo dioxanilo;

(a12) un grupo dioxepanilo;

(a13) un grupo dihidropiranilo;

(a14) un grupo tetrahidropiranilo;

(a15) un grupo tetrahidrotiopiranilo;

(a16) un grupo piperidinilo;

(a17) un grupo piperidinilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un grupo alquilo (C_1–C_6), un grupo alquil (C_1–C_6)–carbonilo y un grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo;

(a18) un grupo tienilo;

(a19) un grupo tienilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, de un grupo Y de sustituyentes;

(a20) un grupo tiazolilo;

(a21) un grupo tiazolilo sustituido que tiene 1 o 2 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;

(a22) un grupo tiadiazolilo;

(a23) un grupo tiadiazolilo sustituido que tiene un sustituyente en el anillo, seleccionado del grupo Y de sustituyentes;

(a24) un grupo pirazolilo;

(a25) un grupo pirazolilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;

(a26) un grupo fenilo;
(a27) un grupo fenilo sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a28) un grupo piridilo;
(a29) un grupo piridilo sustituido que tiene 1 a 4 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a30) un grupo piridazinilo;
(a31) un grupo piridazinilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a32) un grupo pirimidinilo;
(a33) un grupo pirimidinilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a34) un grupo pirazinilo;
(a35) un grupo pirazinilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a36) un grupo amino;
(a37) un grupo carboxilo;
(a38) un grupo alcoxi (C_1–C_6);
(a39) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6);
(a40) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilo;
(a41) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfinilo;
(a42) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfonilo;
(a43) un grupo cicloalquenilo (C_3–C_6);
(a44) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–alquilo (C_1–C_6);
(a45) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilalquilo (C_1–C_6);
(a46) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfinilalquilo (C_1–C_6);
(a47) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfonilalquilo (C_1–C_6);
(a48) un grupo alquil (C_1–C_6)–carbonilo;
(a49) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo;

(a50) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–carbonilo;
(a51) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6)–carbonilo;
(a52) un grupo fenilcarbonilo;
(a53) un grupo fenilcarbonilo sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a54) un grupo fenilaminocarbonilo;
(a55) un grupo fenilaminocarbonilo sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a56) un grupo benzhidrilidenamino;
(a57) un grupo oxopirrolidinilo;
(a58) un grupo oxopiridilo;
(a59) un grupo oxopiridilo sustituido que tiene 1 a 4 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo (C_1–C_6);
(a60) un grupo dioxanilo sustituido que tiene 1 a 4 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo (C_1–C_6);
(a61) un grupo furanilo;
(a62) un grupo furanilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a63) un grupo isotiazolilo;
(a64) un grupo isotiazolilo sustituido que tiene 1 o 2 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a69) un grupo quinolinilo;
(a70) un grupo quinolinilo sustituido que tiene 1 a 6 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a71) un grupo benzotienilo;

(a72) un grupo benzotienilo sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a73) un grupo fenoxi;
(a74) un grupo fenoxi sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a75) un grupo fenilalquilo (C_1–C_6);
(a76) un grupo fenilalquilo (C_1–C_6) sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a77) un grupo fenilalcoxi (C_1–C_6);
(a78) un grupo fenilalcoxi (C_1–C_6) sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a79) un grupo alquil (C_1–C_6)–amino;
(a80) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6)–carbonilamino;
(a81) un grupo oxazolidinonilo;
(a82) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–alcoxi (C_1–C_6);
(a83) un grupo tetrahidrofuranilalcoxi (C_1–C_6); o
(a84) un grupo cicloalquil (C_3–C_6)–alcoxi (C_1–C_6).

R^1 es, más preferentemente,
(a1) un átomo de halógeno;
(a2) un grupo alquilo (C_1–C_6);
(a3) un grupo alquenilo (C_2–C_6);
(a5) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6);
(a13) un grupo dihidropiranilo;
(a14) un grupo tetrahidropiranilo;
(a16) un grupo piperidinilo;
(a18) un grupo tienilo;
(a19) un grupo tienilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, de un grupo Y de sustituyentes;
(a20) un grupo tiazolilo;

(a21) un grupo tiazolilo sustituido que tiene 1 o 2 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a22) un grupo tiadiazolilo;
(a23) un grupo tiadiazolilo sustituido que tiene un sustituyente en el anillo, seleccionado del grupo Y de sustituyentes;
(a24) un grupo pirazolilo;
(a25) un grupo pirazolilo sustituido que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, de un grupo Y de sustituyentes;
(a26) un grupo fenilo;
(a27) un grupo fenilo sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a28) un grupo piridilo;
(a29) un grupo piridilo sustituido que tiene 1 a 4 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a32) un grupo pirimidinilo;
(a34) un grupo pirazinilo;
(a36) un grupo amino;
(a37) un grupo carboxilo;
(a38) un grupo alcoxi (C_1–C_6);
(a39) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6);
(a40) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilo;
(a42) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfonilo;
(a43) un grupo cicloalquenilo (C_3–C_6);
(a44) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–alquilo (C_1–C_6);
(a45) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilalquilo (C_1–C_6);
(a46) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfinilalquilo (C_1–C_6);
(a47) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfonilalquilo (C_1–C_6);
(a48) un grupo alquil (C_1–C_6)–carbonilo;
(a49) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo;

(a52) un grupo fenilcarbonilo;
(a54) un grupo fenilaminocarbonilo;
(a56) un grupo benzhidrilidenamino;
(a57) un grupo oxopirrolidinilo;
(a58) un grupo oxopiridilo;
(a59) un grupo dioxanilo sustituido que tiene 1 a 4 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo (C_1–C_6);
(a60) un grupo dioxanilo sustituido que tiene 1 a 4 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo (C_1–C_6);
(a61) un grupo furanilo;
(a63) un grupo isotiazolilo;
(a64) un grupo isotiazolilo sustituido que tiene 1 o 2 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a69) un grupo quinolinilo;
(a71) un grupo benzotienilo;
(a74) un grupo fenoxi sustituido que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo Y de sustituyentes;
(a75) un grupo fenilalquilo (C_1–C_6);
(a82) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–alcoxi (C_1–C_6);
(a83) un grupo tetrahidrofuranilalcoxi (C_1–C_6); o
(a84) un grupo cicloalquil (C_3–C_6)–alcoxi (C_1–C_6).
[0030] R^2 es preferentemente
(b1) un átomo de hidrógeno;
(b2) un átomo de halógeno; o
(b3) un grupo alquilo (C_1–C_6).
R^2 es, más preferentemente,
(b1) un átomo de hidrógeno; o
(b2) un átomo de halógeno.

[0031] R^{2a} es preferentemente

(b1') un átomo de hidrógeno; o

(b2') un grupo alquilo (C_1–C_6).

R^{2a} es, más preferentemente,

(b1') un átomo de hidrógeno.

[0032] R^3 es preferentemente

(c1) un átomo de hidrógeno;

(c2) un átomo de halógeno;

(c3) un grupo hidroxi;

(c4) un grupo alquilo (C_1–C_6);

(c5) un grupo alquenilo (C_2–C_6);

(c6) un grupo alquinilo (C_2–C_6);

(c7) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6);

(c8) un grupo haloalquilo (C_1–C_6);

(c12) un grupo alcoxi (C_1–C_6);

(c13) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilo;

(c14) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfinilo;

(c15) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfonilo;

(c16) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6);

(c17) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–sulfanilo;

(c18) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–sulfinilo;

(c19) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–sulfonilo;

(c20) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo; o

(c21) un grupo alquil (C_1–C_6)–amino, o

R^2 y R^3 se pueden unir entre sí para formar un anillo de 5 o 6 miembros.

R^3 es, más preferentemente,

(c1) un átomo de hidrógeno;

(c2) un átomo de halógeno;

(c3) un grupo hidroxi;

(c4) un grupo alquilo (C_1–C_6);

(c5) un grupo alquenilo (C_2–C_6);

(c8) un grupo haloalquilo (C_1–C_6);

(c12) un grupo alcoxi (C_1–C_6);

(c13) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilo;

(c14) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfinilo;

(c15) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfonilo; o

(c20) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo, o

R^2 y R^3 se pueden unir entre sí para formar un anillo de 5 o 6 miembros.

[0033] R^{3a} es preferentemente

(c1') un átomo de hidrógeno; o

(c2') un grupo alquilo (C_1–C_6).

R^{3a} es, más preferentemente,

(c1') un átomo de hidrógeno.

[0034] El grupo Y de sustituyentes consiste preferentemente en

(d1) un átomo de halógeno;

(d2) un grupo ciano;

(d3) un grupo nitro;

(d4) un grupo amino;

(d5) un grupo alquilo (C_1–C_6);

(d8) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6);

(d9) un grupo haloalquilo (C_1–C_6);

(d13) un grupo alcoxi (C_1–C_6);

(d14) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilo;

(d15) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfinilo;

(d16) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfonilo;

(d17) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6);

(d18) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–sulfanilo;

(d19) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–sulfinilo;

(d20) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–sulfonilo;

(d21) un grupo N–(alquil (C_1–C_6)–carbonil)amino;

(d22) un grupo N,N–di–(alquil (C_1–C_6)–carbonil)amino, en donde los grupos alquil (C_1–C_6)–carbonilo pueden ser iguales o diferentes;

(d23) un grupo dialcoxi (C_1–C_6)–fosfanilo, en donde los grupos alcoxi (C_1–C_6) pueden ser iguales o diferentes;

(d24) un grupo imidazolilo;
(d25) un grupo imidazolilo que tiene 1 a 3 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo (C_1–C_6);
(d26) un grupo fenilo;
(d27) un grupo fenilo que tiene 1 a 5 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo (C_1–C_6);
(d28) un grupo piridilo;
(d29) un grupo piridilo que tiene 1 a 4 sustituyentes en el anillo, cada uno seleccionado, de modo independiente, del grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo alquilo (C_1–C_6);
(d30) un grupo dialquil (C_1–C_6)-amino;
(d31) un grupo alcoxi (C_1–C_6)-carbonilo; y
(d32) un grupo metilendioxi que se forma a partir de dos sustituyentes del grupo Y adyacentemente unidos entre sí y se puede sustituir por 1 o 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo fenilo y un grupo alquilo (C_1–C_6).

El grupo Y de sustituyentes más preferentemente, consiste en
(d1) un átomo de halógeno;
(d2) un grupo ciano;
(d3) un grupo nitro;
(d4) un grupo amino;
(d5) un grupo alquilo (C_1–C_6);
(d8) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6);
(d9) un grupo haloalquilo (C_1–C_6);
(d13) un grupo alcoxi (C_1–C_6);
(d14) un grupo alquil (C_1–C_6)-sulfanilo;
(d17) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6);
(d21) un grupo N-(alquil (C_1–C_6)-carbonil)amino;
(d24) un grupo imidazolilo;

(d26) un grupo fenilo;
(d28) un grupo piridilo;
(d30) un grupo dialquil (C_1–C_6)–amino;
(d31) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo; y
(d32) un grupo metilendioxi que se forma a partir de dos sustituyentes del grupo Y adyacentemente unidos entre sí y se puede sustituir por 1 o 2 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo fenilo y un grupo alquilo (C_1–C_6).
[0035] R^4 es preferentemente
(e1) un átomo de hidrógeno;
(e2) un grupo amino;
(e3) un grupo alquilo (C_1–C_6);
(e4) un grupo N–alquil (C_1–C_6)–amino;
(e5) un grupo N,N–dialquil (C_1–C_6)–amino, en donde los grupos alquilo (C_1–C_6) pueden ser iguales o diferentes;
(e6) un grupo N–(alquil (C_1–C_6)–carbonil)amino;
(e7) un grupo N,N–di–(alquil (C_1–C_6)–carbonil)amino, en donde los grupos alquil (C_1–C_6)–carbonilo pueden ser iguales o diferentes; o
(e8) un grupo N–(haloalquil (C_1–C_6)–carbonil)amino.
R^4 es, más preferentemente,
(e2) un grupo amino;
(e3) un grupo alquilo (C_1–C_6);
(e6) un grupo N–(alquil (C_1–C_6)–carbonil)amino;
(e7) un grupo N,N–di–(alquil (C_1–C_6)–carbonil)amino, en donde los grupos alquil (C_1–C_6)–carbonilo pueden ser iguales o diferentes; o
(e8) un grupo N–(haloalquil (C_1–C_6)–carbonil)amino.
[0036] R^5 es preferentemente
(f1) un grupo alquilo (C_1–C_6);
(f2) un grupo alquenilo (C_2–C_6);
(f3) un grupo alquinilo (C_2–C_6);
(f4) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6);

(f5) un grupo haloalquilo (C_1–C_6);

(f9) un grupo cicloalquil (C_3–C_6)–alquilo (C_1–C_6);

(f10) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–alquilo (C_1–C_6);

(f11) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfanilalquilo (C_1–C_6);

(f12) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfinilalquilo (C_1–C_6); o

(f13) un grupo alquil (C_1–C_6)–sulfonilalquilo (C_1–C_6).

R^5 es, más preferentemente,

(f1) un grupo alquilo (C_1–C_6);

(f5) un grupo haloalquilo (C_1–C_6); o

(f10) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–alquilo (C_1–C_6).

[0037] A es preferentemente

(g1) un grupo alcoxi (C_1–C_6);

(g3) un grupo N–alquil (C_1–C_6)–aminocarbonilo;

(g4) un grupo N,N–dialquil (C_1–C_6)–aminocarbonilo, en donde los grupos alquil (C_1–C_6)–carbonilo pueden ser iguales o diferentes;

(g5') CO_2R^7, en donde R^7 representa

(h1) un átomo de hidrógeno,

(h2) un grupo alquilo (C_1–C_6),

(h3) un grupo alquenilo (C_2–C_6),

(h4) un grupo alquinilo (C_2–C_6),

(h5) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6),

(h6) un grupo haloalquilo (C_1–C_6), o

(h10) un grupo fenilalquilo (C_1–C_6);

(g6') SO_nR^8, en donde R^8 representa

(i1) un grupo alquilo (C_1–C_6),

(i2) un grupo alquenilo (C_2–C_6),

(i3) un grupo alquinilo (C_2–C_6),

(i4) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6),

(i5) un grupo haloalquilo (C_1–C_6), o

(i9) un grupo alquil (C_1–C_6)–carbonilalquilo (C_1–C_6), y

n representa 0, 1 o 2; o

(g7') $SO_2N(R^9)R^{10}$, en donde R^9 y R^{10} representan

(j1) un átomo de hidrógeno,

(j2) un grupo alquilo (C_1–C_6),

(j3) un grupo alquenilo (C_2–C_6),

(j4) un grupo alquinilo (C_2–C_6),

(j5) un grupo cicloalquilo (C_3–C_6),

(j11) un grupo alquil (C_1–C_6)–carbonilo,

(j12) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo,

(j13) un grupo haloalquil (C_1–C_6)–carbonilo, o

(j14) un grupo haloalcoxi (C_1–C_6)–carbonilo, y

R^9 y R^{10} pueden ser iguales o diferentes.

A es, más preferentemente,

(g1) un grupo alcoxi (C_1–C_6);

(g4) un grupo N,N–dialquil (C_1–C_6)–aminocarbonilo, en donde los grupos alquil (C_1–C_6)–carbonilo pueden ser iguales o diferentes;

(g5") CO_2R^7, en donde R^7 representa

(h1) un átomo de hidrógeno, o

(h2) un grupo alquilo (C_1–C_6);

(g6") SO_nR^8, en donde R^8 representa

(i1) un grupo alquilo (C_1–C_6), o

(i9) un grupo alquil (C_1–C_6)–carbonilalquilo (C_1–C_6), y

n representa 2; o

(g7") $SO_2N(R^9)R^{10}$, en donde R^9 y R^{10} representan

(j1) un átomo de hidrógeno,

(j2) un grupo alquilo (C_1–C_6),

(j11) un grupo alquil (C_1–C_6)–carbonilo, o

(j12) un grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo, y

R^9 y R^{10} pueden ser iguales o diferentes.

[0038] D es preferentemente D1 o D2 y más preferentemente, D1.

[0039] R^{6a} y R^{6b} representan preferentemente

(k1) un átomo de hidrógeno;

(k2) un átomo de halógeno; o

(k3) un grupo alquilo (C_1–C_6).

R^{6a} y R^{6b} más preferentemente, representan

(k1) un átomo de hidrógeno.

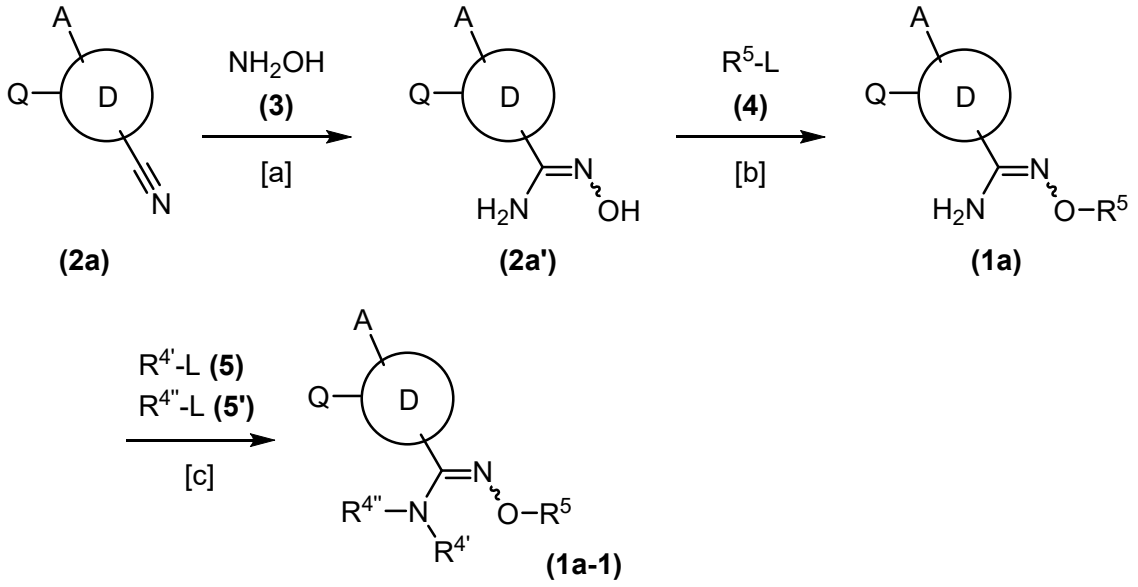
[0040] R^{6a} y R^{6b} pueden ser iguales o diferentes.

[0041] Los compuestos de la presente invención se pueden producir de acuerdo con, por ejemplo, los métodos de producción descritos más abajo que son ejemplos no limitativos.

[0042] Método de producción 1

Los compuestos representados por las fórmulas generales (1a) y (1a–1) de la presente invención se pueden producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (2a) a través de las etapas [a], [b] y [c] descritas más abajo.

[Quím. 4]



[0043] En la fórmula, A, D, Q y R^5 son iguales que antes; L representa un grupo saliente tales como cloro, bromo, yodo o un grupo alquil (C_1–C_6)–carboniloxi; y $R^{4'}$ y $R^{4''}$ representan un grupo alquilo (C_1–C_6), un grupo alquil (C_1–C_6)–carbonilo, un grupo haloalquil (C_1–C_6)–carbonilo o un grupo alcoxi (C_1–C_6)–carbonilo y $R^{4'}$ y $R^{4''}$ pueden ser iguales o diferentes.

[0044] Método de producción en la etapa [a]

El compuesto representado por la fórmula general (2a') se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (2a) con el compuesto representado por la fórmula general (3) o una de sus sales en presencia de una base y un solvente inerte.

[0045] Los ejemplos de la base que se pueden usar en esta reacción incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrógeno-carbonato de sodio e hidrógeno-carbonato de potasio; acetatos tales como acetato de sodio y acetato de potasio; alcóxidos de metal alcalino tales como ter-butóxido de potasio, metóxido de sodio y etóxido de sodio; y bases orgánicas que incluyen aminas terciarias tales como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina y 1,8-diazabiciclo[5,4,0]undec-7-eno (DBU) y compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y N,N-dimetil-4-aminopiridina. La cantidad de la base usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (2a).

[0046] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos saturados de cadena o cíclicos tales como pentano, hexano y ciclohexano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; nitrilos tales como acetonitrilo y propionitrilo; ésteres tales como acetato de metilo; cetonas tales como acetona y metiletilcetona; solventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona; y alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol y 2-propanol. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,1

a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (2a).

[0047] Como esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares y no es igual en cada caso, pero se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente etapa sin aislamiento del compuesto de interés.

[0048] Método de producción en la etapa [b]

El compuesto representado por la fórmula general (1a) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (2a') con el compuesto representado por la fórmula general (4) en presencia de un solvente inerte y a base.

[0049] Los ejemplos de la base que se pueden usar en esta reacción incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrógeno-carbonato de sodio, hidrógeno-carbonato de potasio e hidruro de sodio; acetatos tales como acetato de sodio y acetato de potasio; alcóxidos de metal alcalino tales como ter-butóxido de potasio, metóxido de sodio y etóxido de sodio; aminas terciarias tales como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina y DBU; y compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y N,N-dimetil-4-aminopiridina. La cantidad de la base usada está

usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (2a').

[0050] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metiletilcetona; y solventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos solventes inertes pueden usarse solos y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (2a').

[0051] Como esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares y no es igual en cada caso, pero se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede

emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

[0052] Método de producción en la etapa [c]

El compuesto representado por la fórmula general (1a-1) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (1a) con el compuesto representado por la fórmula general (5) y/o (5') en presencia de un solvente inerte y a base.

[0053] Los ejemplos de la base que se pueden usar en esta reacción incluyen alquil-litios tales como metil-litio, n-butil-litio, sec-butil-litio y ter-butil-litio; compuestos organometálicos tales como hexametildisilazano de litio y hexametildisilazano de sodio; hidróxidos tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio e hidróxido de calcio; carbonatos tales como carbonato de litio, hidrógeno-carbonato de litio, carbonato de sodio, hidrógeno-carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrógeno-carbonato de potasio, carbonato de calcio y carbonato de magnesio; acetatos tales como acetato de litio, acetato de sodio y acetato de potasio; alcóxidos tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, ter-butóxido de sodio y ter-butóxido de potasio; hidruros de metal tales como hidruro de sodio e hidruro de potasio; y bases orgánicas tales como piridina, picolina, lutidina, trietilamina, tributilamina y N,N-diisopropiletilamina. La cantidad de la base usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (1a).

[0054] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como

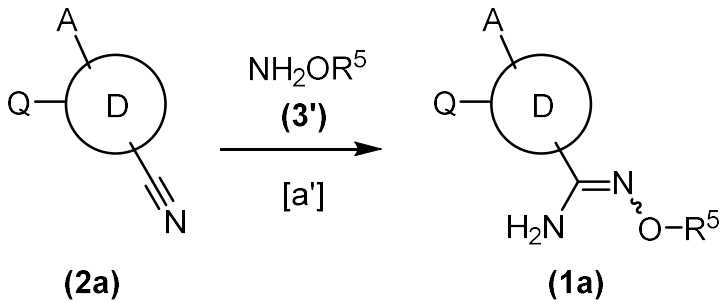
clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metiletilcetona; y solventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos solventes inertes pueden usarse solos y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (1a).

[0055] Como esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares y no es igual en cada caso, pero se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

[0056] Método de producción 2

El compuesto representado por la fórmula general (1a) se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (2a) a la etapa [a’] descrita más abajo.

[Quím. 5]



(2a) (1a)

[0057] En la fórmula, A, D, Q y R^5 son iguales que antes.

[0058] Método de producción en la etapa [a']

El compuesto representado por la fórmula general (1a) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (2a) con el compuesto representado por la fórmula general (3') o una de sus sales en presencia de una base y un solvente inerte.

[0059] Los ejemplos de la base que se pueden usar en esta reacción incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrógeno-carbonato de sodio e hidrógeno-carbonato de potasio; acetatos tales como acetato de sodio y acetato de potasio; alcóxidos de metal alcalino tales como ter-butóxido de potasio, metóxido de sodio y etóxido de sodio; y bases orgánicas que incluyen aminas terciarias tales como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina y DBU y compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y N,N-dimetil-4-aminopiridina. La cantidad de la base usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (2a).

[0060] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos saturados de cadena o cíclicos tales como pentano, hexano y ciclohexano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno,

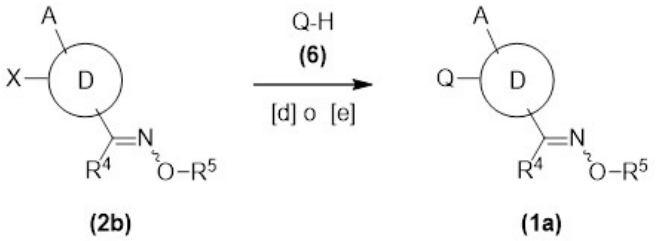
cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; nitrilos tales como acetonitrilo y propionitrilo; ésteres tales como acetato de metilo; cetonas tales como acetona y metiletilcetona; solventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona; y alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol y 2-propanol. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,1 a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (2a).

[0061] Como esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares y no es igual en cada caso, pero se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

[0062] Método de producción 3

El compuesto representado por la fórmula general (1a) se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (2b) a la etapa [d] o [e] descrita más abajo.

[Quím. 6]



(2b) (1a)

[0063] En la fórmula, A, D, Q, R^4 y R^5 son iguales que antes; y X representa un grupo saliente tales como cloro, bromo o yodo.

[0064] Método de producción en la etapa [d]

El compuesto representado por la fórmula general (1a) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (2b) con el compuesto representado por la fórmula general (6) en presencia de una base y un solvente inerte.

[0065] Los ejemplos de la base que se pueden usar en esta reacción incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrógeno-carbonato de sodio, hidrógeno-carbonato de potasio e hidruro de sodio; acetatos tales como acetato de sodio y acetato de potasio; alcóxidos de metal alcalino tales como ter-butóxido de potasio, metóxido de sodio y etóxido de sodio; bases orgánicas que incluyen aminas terciarias tales como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina y DBU y compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y N,N-dimetil-4-aminopiridina; alquil-litios tales como metil-litio, n-butil-litio, sec-butil-litio y ter-butil-litio; y compuestos organometálicos tales como hexametildisilazano de litio y hexametildisilazano de sodio. La cantidad de la base usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (2b).

[0066] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos saturados de

cadena o cíclicos tales como pentano, hexano y ciclohexano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; nitrilos tales como acetonitrilo y propionitrilo; ésteres tales como acetato de metilo; cetonas tales como acetona y metiletilcetona; solventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona; y alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol y 2-propanol. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,1 a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (2b).

[0067] Como esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de 0 °C al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares y no es igual en cada caso, pero se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

[0068] Método de producción en la etapa [e]

El compuesto representado por la fórmula general (1a) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado

por la fórmula general (2b) con el compuesto representado por la fórmula general (6) en presencia de un catalizador de metal y un solvente inerte.

[0069] Los ejemplos del catalizador de metal que se pueden usar en esta reacción incluyen un catalizador de paladio, un catalizador de níquel, un catalizador de hierro, un catalizador de rutenio, un catalizador de platino, un catalizador de rodio y un catalizador de iridio. Tal catalizador de metal se puede usar en forma de un metal; un metal soportado; una sal metálica tales como un cloruro de metal, un bromuro de metal, un yoduro de metal, un nitrato de metal, un sulfato de metal, un carbonato de metal, un oxalato de metal, un acetato de metal y un óxido de metal; o un compuesto complejo tales como un complejo de olefina, un complejo de fosfina, un complejo de amina, y un complejo de acetilacetonato.

[0070] Entre estos catalizadores de metal, se prefieren en particular los catalizadores de paladio. Los ejemplos del catalizador de paladio incluyen metales de paladio tales como negro de paladio y esponja de paladio; metales de paladio soportados tales como paladio/alúmina, paladio/carbón, paladio/sílice y paladio/zeolita de tipo Y; sales metálicas de paladio tales como cloruro de paladio, bromuro de paladio, yoduro de paladio y acetato de paladio; y compuestos de complejo de paladio tales como dímero de cloruro de π-alilpaladio, acetilacetonato de paladio, diclorobis(acetonitrilo)paladio, diclorobis(benzonitrilo)paladio, bis(dibencilidenacetona)paladio, tris(dibencilidenacetona)dipaladio, tris(dibencilidenacetona)dipaladio (aducto de cloroformo), diclorodiamina paladio, diclorobis(trifenilfosfina)paladio, diclorobis(triciclohexilfosfina)paladio, tetrakis(trifenilfosfina)paladio, dicloro[1,2-bis(difenilfosfino)etano]paladio, dicloro[1,3-bis(difenilfosfino)propano]paladio, dicloro[1,4-

bis(difenilfosfino)butano]paladio, dicloro[1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio y un complejo de [(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaladio-diclorometano. La cantidad del catalizador de metal usada se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de una cantidad molar de 0,001 a 0,5 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (2b).

[0071] Estos catalizadores de paladio se pueden usar solos o en combinación con una fosfina terciaria. Los ejemplos de la fosfina terciaria que se pueden usar en combinación con el catalizador de paladio incluyen trifenilfosfina, trimetilfosfina, trietilfosfina, tributilfosfina, tri(ter-butil)fosfina, triciclohexilfosfina, tri-o-tolilfosfina, trioctilfosfina, 9,9-dimetil-4,5-bis(difenilfosfino)xanteno, 2-(di-ter-butilfosfino)bifenilo, 2-(diciclohexilfosfino)bifenilo, 1,2-bis(difenilfosfino)etano, 1,3-bis(difenilfosfino)propano, 1,4-bis(difenilfosfino)butano, 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno, (R)-(+)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo, (S)-(-)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo y (±)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo. La cantidad de la fosfina terciaria usada se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de una cantidad molar de 0,5 a 10 veces respecto del catalizador de metal.

[0072] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente la reacción y los ejemplos incluyen alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol y 2-propanol; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, dioxano y 1,2-dimetoxietano (DME); hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno

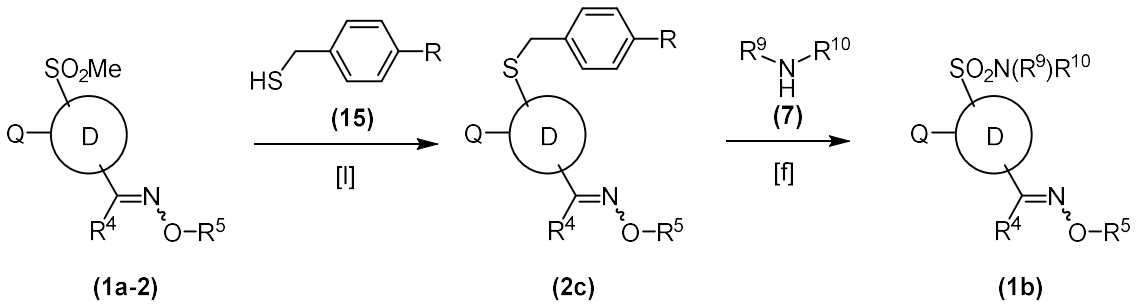
y diclorobenceno; nitrilos tales como acetonitrilo; ésteres tales como acetato de etilo; solventes polares tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona; y agua. Uno de estos solventes inerte puede usarse solos y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (2b).

[0073] Como esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares, pero se selecciona básicamente de ser apropiado del intervalo de algunos minutos a 48 horas. Esta reacción se puede llevar a cabo bajo la atmósfera de un gas inerte tales como gas nitrógeno y gas argón. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

[0074] Método de producción 4

El compuesto representado por la fórmula general (1b) se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (1a-2) a través de las etapas [l] y [f] descrita más abajo.

[Quím. 7]



[0075] En la fórmula, D, Q, R^4, R^5, R^9 y R^{10} son iguales que antes; y R representa un grupo alquilo (C_1–C_4) tales como un grupo ter-butilo o un átomo de hidrógeno.

[0076] Método de producción en la etapa [l]

El compuesto representado por la fórmula general (2c) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (1a–2) con el compuesto tiol representado por la fórmula general (15) en presencia de una base y un solvente inerte.

[0077] Los ejemplos de la base que se pueden usar en esta reacción incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrógeno-carbonato de sodio e hidrógeno-carbonato de potasio; acetatos tales como acetato de sodio y acetato de potasio; alcóxidos de metal alcalino tales como ter-butóxido de potasio, metóxido de sodio y etóxido de sodio; aminas terciarias tales como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina y DBU; y compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y N,N-dimetil-4-aminopiridina. La cantidad de la base usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (1a–2). En el caso de usar una sal alcalina del compuesto representado por la fórmula general (15), no es necesario usar una base.

[0078] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos

tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metiletilcetona; y solventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (1a-2).

[0079] Como esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de -20 °C al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero está básicamente en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente etapa sin aislamiento del compuesto de interés.

[0080] Método de producción en la etapa [f]

El compuesto representado por la fórmula general (1b) de la presente invención se puede producir por clorosulfonilación del compuesto representado por la fórmula general (2c) con un

agente halogenante en presencia de un solvente inerte, seguido de aminación con el compuesto representado por la fórmula general (7) en presencia de un solvente inerte con o sin una base.

[0081] Los ejemplos del agente halogenante que se pueden usar en el clorosulfonilación incluyen cloruro de tionilo, cloro, cloruro de sulfurilo, 1,3-dicloro-5,5-dimetilhidantoína y N-clorosuccinimida. La cantidad del agente halogenante usado se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de una cantidad molar de 0,5 a 5 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (2c).

[0082] El solvente inerte usado en el clorosulfonilación puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; nitrilos tales como acetonitrilo y propionitrilo; ácidos orgánicos tales como ácido propiónico; y agua. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (2c).

[0083] Como la clorosulfonilación es una reacción equimolar de los reactivos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero está básicamente en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, cuando el producto clorosulfonilado es estable,

el producto se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del producto. Cuando el producto clorosulfonilado es inestable, la mezcla de posreacción se usa directamente en la siguiente reacción sin purificación.

[0084] Los ejemplos de la base que se pueden usar en la aminación incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrógeno-carbonato de sodio e hidrógeno-carbonato de potasio; acetatos tales como acetato de sodio y acetato de potasio; alcóxidos de metal alcalino tales como ter-butóxido de potasio, metóxido de sodio y etóxido de sodio; aminas terciarias tales como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina y DBU; y compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y N,N-dimetil-4-aminopiridina. La cantidad de la base usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (2c).

[0085] El solvente inerte usado en la aminación puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; alcoholes tales como metanol, etanol, propanol y alcohol isopropílico; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; y solventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre

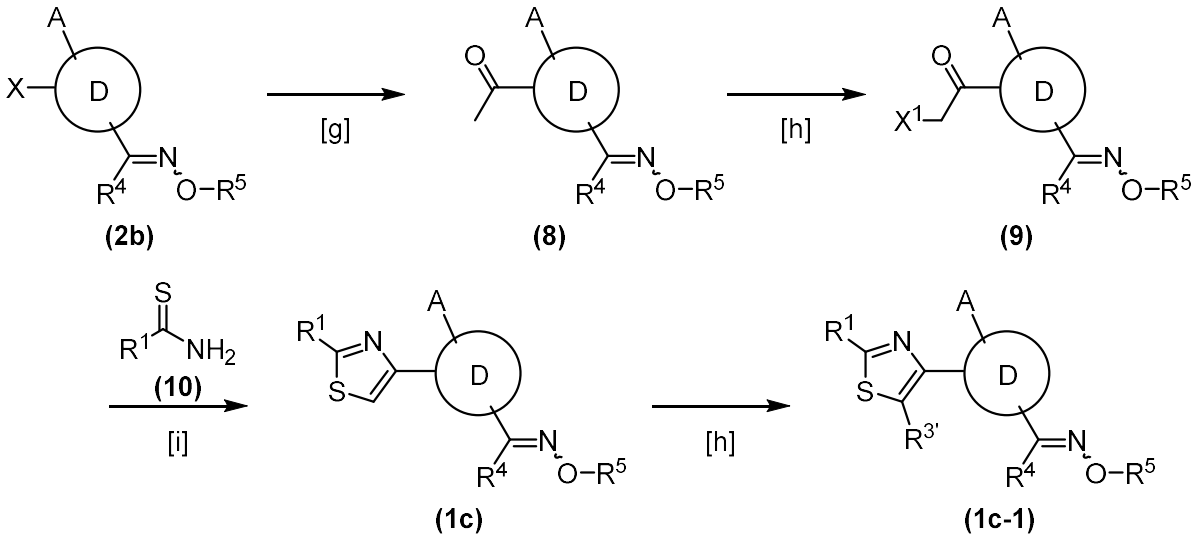
que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (2c).

[0086] Como la aminación es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de 0 °C al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero está básicamente en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

[0087] Método de producción 5

Entre los ejemplos del compuesto representado por la fórmula general (1), los compuestos representados por las fórmulas generales (1c) y (1c-1), en donde Q es Q7 antes definido se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (2b) a través de las etapas [g], [h] y [i] descrita más abajo.

[Quím. 8]



[0088] En la fórmula, A, D, R^1, R^4 y R^5 son iguales que antes; $R^{3'}$ representa un átomo de halógeno; X representa un grupo saliente tales como cloro, bromo o yodo; y X^1 representa un átomo de halógeno tales como cloro, bromo o yodo.

[0089] Método de producción en la etapa [g]

El compuesto representado por la fórmula general (8) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (2b) con tributil(1-etoxivinil)estaño en presencia de un catalizador de paladio y un solvente inerte, seguido de tratamiento ácido.

[0090] Los ejemplos del catalizador de paladio que se pueden usar en esta reacción incluyen cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II), paladio(II) acetato, cloruro de paladio(II), tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0) y bis(tri-ter-butilfosfina)paladio(0). La cantidad del catalizador de paladio usada está en el intervalo de una cantidad molar de 0,001 a 0,5 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (2b).

[0091] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metiletilcetona; alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol y 2-propanol; y solventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos solventes inertes puede usarse

solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (2b).

[0092] Los ejemplos del ácido que se pueden usar en esta reacción incluyen ácidos inorgánicos tales como ácido clorhídrico, ácido sulfúrico y ácido nítrico; ácidos orgánicos tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido trifluoroacético y ácido benzoico; y ácidos sulfónicos tales como ácido metansulfónico y ácido trifluorometansulfónico. La cantidad del ácido usado está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (2b).

[0093] Como esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de 0 °C al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares y no es igual en cada caso, pero se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

[0094] Método de producción en la etapa [h]

El compuesto representado por la fórmula general (9) se puede producir halogenando el compuesto representado por la fórmula general (8) con un agente halogenante en presencia de un solvente inerte. El compuesto representado por la fórmula

general (1c–1) se puede producir halogenando el compuesto representado por la fórmula general (1c) con un agente halogenante en presencia de un solvente inerte.

[0095] Los ejemplos del agente halogenante incluyen moléculas de halógeno tales como cloro, bromo y yodo; sales de haluro de amonio formadas de moléculas de halógeno; succinimidas halogenadas tales como N–clorocosuccinimida y N–bromocosuccinimida; hidantoínas halogenadas tales como diiodohidantoína; y cloruro de sulfurilo. La cantidad del agente halogenante usado está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 0,5 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (8) o (1c–1).

[0096] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente la reacción y los ejemplos incluyen alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol y 2–propanol; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, tetrahidrofurano y dioxano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; ésteres tales como acetato de etilo; y solventes polares tales como N,N–dimetilformamida, N,N–dimetilacetamida, 1,3–dimetil–2–imidazolidinona, agua y ácido acético. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (8) o (1c–1).

[0097] La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de –30 °C al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares y no es igual en cada caso, pero se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa

la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente etapa sin aislamiento del compuesto de interés.

[0098] Método de producción en la etapa [i]

El compuesto representado por la fórmula general (1c) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (9) con el compuesto representado por la fórmula general (10) en presencia de un solvente inerte con o sin una base.

[0099] La base usada en esta reacción puede ser una base inorgánica o una base orgánica. Los ejemplos de la base inorgánica incluyen hidróxidos de metal alcalino tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio; hidruros de metal alcalino tales como hidruro de sodio e hidruro de potasio; alcóxidos de metal alcalino tales como etóxido de sodio y ter-butóxido de potasio; y carbonatos tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio e hidrógeno-carbonato de sodio. Los ejemplos de la base orgánica incluyen trietilamina, piridina y DBU. La cantidad de la base usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 0,01 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (9).

[0100] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol y 2-propanol; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; y solventes polares tales como

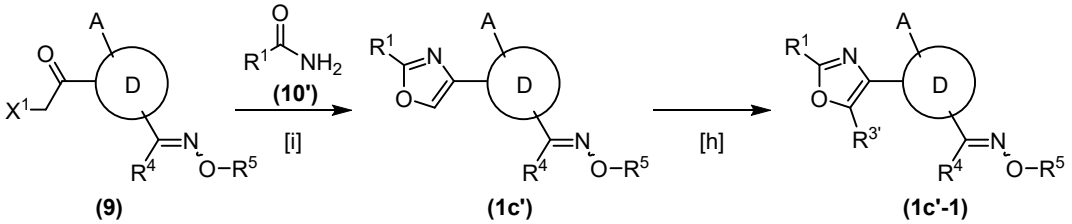
dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (9).

[0101] Como esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero se selecciona básicamente de ser apropiado del intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

[0102] Método de producción 6

Entre los ejemplos del compuesto representado por la fórmula general (1), los compuestos representados por las fórmulas generales (1c') y (1c'-1), en donde Q es el Q12 antes definido se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (9) a través de las etapas [i] y [h] descrita más abajo. Las condiciones de reacción para las etapas [i] y [h] son las mismas que las descritas con anterioridad.

[Quím. 9]

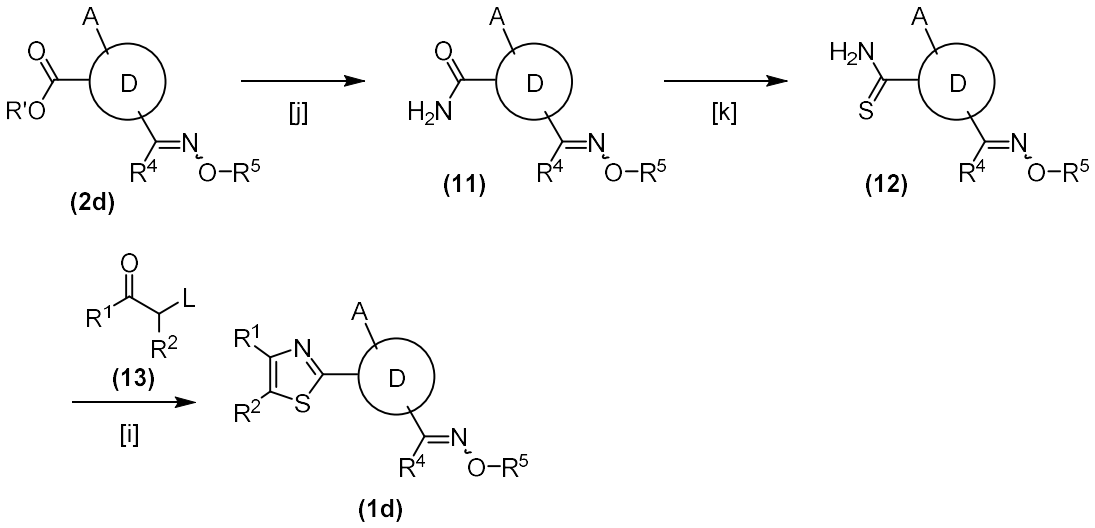


[0103] En la fórmula, A, D, R^1, R^4 y R^5 son iguales que antes; $R^{3'}$ representa un átomo de halógeno; y X^1 representa un átomo de halógeno tales como cloro, bromo o yodo.

[0104] Método de producción 7

Entre los ejemplos del compuesto representado por la fórmula general (1), el compuesto representado por la fórmula general (1d), en donde Q es el Q8 antes definido se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (2d) a través de las etapas [j], [k] y [i] descrita más abajo. Las condiciones de reacción para la etapa [i] son las mismas que las descritas con anterioridad.

[Quím. 10]



[0105] En la fórmula, A, D, R^1, R^2, R^4 y R^5 son iguales que antes; R' representa un grupo alquilo (C_1–C_6) tales como un grupo metilo o un grupo etilo; y L representa un grupo saliente tales como cloro, bromo, yodo o un grupo alquil (C_1–C_6)-carboniloxi.

[0106] Método de producción en la etapa [j]

El compuesto representado por la fórmula general (11) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (2d) con amoníaco en presencia de un solvente inerte con o sin una base.

[0107] La cantidad del amoníaco usada en esta reacción está usualmente en el intervalo de una cantidad molar aproximadamente 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (2d).

[0108] La base usada en esta reacción puede ser una base inorgánica o una base orgánica. Los ejemplos de la base inorgánica incluyen hidróxidos de metal alcalino tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio; hidruros de metal alcalino tales como hidruro de sodio e hidruro de potasio; alcóxidos de metal alcalino tales como etóxido de sodio y ter-butóxido de potasio; y carbonatos tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio e hidrógeno-carbonato de sodio. Los ejemplos de la base orgánica incluyen trietilamina, piridina y DBU. La cantidad de la base usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 0,01 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (2d).

[0109] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos alifáticos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, dioxano y tetrahidrofurano; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; y otros solventes inertes tales como dimetilsulfóxido, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, acetona, metiletilcetona y agua. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L

respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (2d).

[0110] La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de 0 °C al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares y no es igual en cada caso, pero se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se usa directamente en la siguiente reacción sin purificación.

[0111] Método de producción en la etapa [k]

El compuesto representado por la fórmula general (12) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (11) con un agente sulfurante en presencia de un solvente inerte.

[0112] Los ejemplos del agente sulfurante que se pueden usar en esta reacción incluyen reactivo de Lawesson y pentasulfuro de difósforo. La cantidad del agente sulfurante usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1,0 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (11).

[0113] Esta reacción puede llevarse a cabo con o sin un solvente. El solvente usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos saturados de cadena o cíclicos tales como pentano, hexano y ciclohexano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y

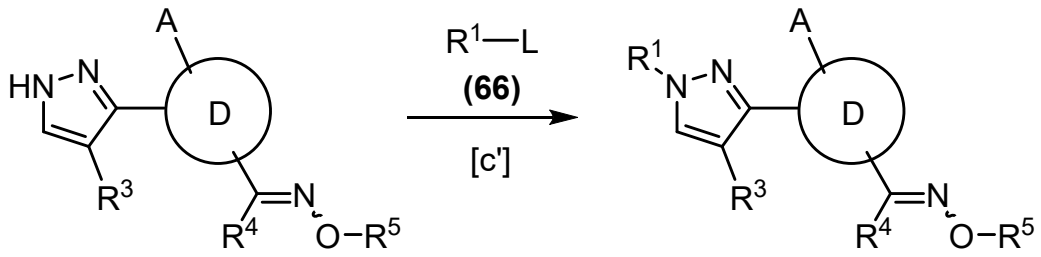
tetrahidrofurano; nitrilos tales como acetonitrilo y propionitrilo; solventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona; y alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol y 2-propanol. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente usado se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,1 a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (11).

[0114] La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de aproximadamente 0 °C al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares y no es igual en cada caso, pero se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

[0115] Método de producción 8

Entre los ejemplos del compuesto representado por la fórmula general (1), el compuesto representado por las fórmulas generales (1e), en donde Q es el Q10 antes definido se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (2e) a la etapa [c'] descrita más abajo.

[Quím. 11]



(2e) **(1e)**

[0116] En la fórmula, A, D, R^1, R^3, R^4 y R^5 son iguales que antes; y L representa un grupo saliente tales como cloro, bromo, yodo o un grupo alquil (C_1–C_6)–carboniloxi.

[0117] Método de producción en la etapa [c']

El compuesto representado por la fórmula general (1e) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (2e) con el compuesto representado por la fórmula general (66) en presencia de un solvente inerte y una base con o sin acetato de cobre.

[0118] El acetato de cobre usado en esta reacción puede ser un hidrato. La cantidad del acetato de cobre usada está usualmente en el intervalo de cantidad molar de 0,1 a 1 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (2e).

[0119] Los ejemplos de la base que se pueden usar en esta reacción incluyen alquil–litios tales como metil–litio, n–butil–litio, sec–butil–litio y ter–butil–litio; compuestos organometálicos tales como hexametildisilazano de litio y hexametildisilazano de sodio; hidróxidos tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio e hidróxido de calcio; carbonatos tales como carbonato de litio, hidrógeno–carbonato de litio, carbonato de sodio, hidrógeno–carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrógeno–carbonato de potasio, carbonato de calcio y carbonato de magnesio; acetatos tales como acetato de litio, acetato de sodio y acetato de potasio; alcóxidos tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, ter–butóxido de sodio y ter–butóxido de potasio; hidruros de metal tales como hidruro de sodio e hidruro de potasio; y bases orgánicas tales como piridina, picolina, lutidina, trietilamina, tributilamina y N,N–diisopropiletilamina. La cantidad de la base usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (2e).

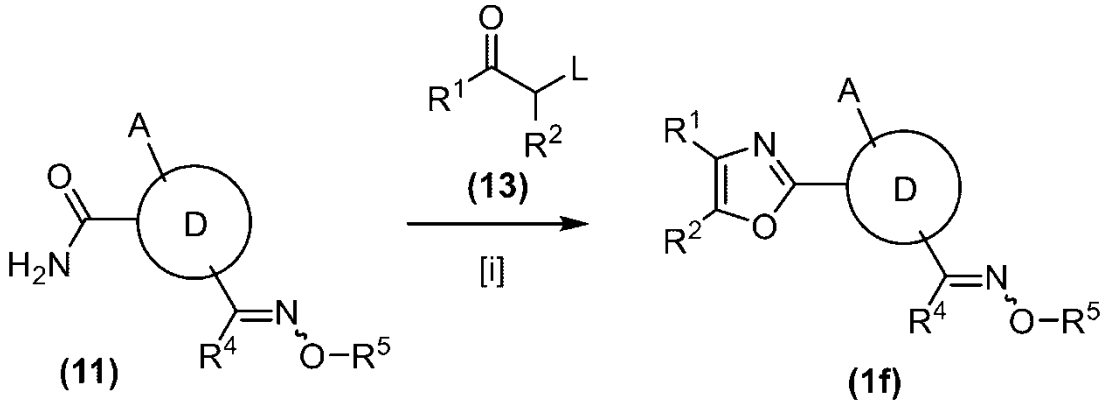
[0120] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metiletilcetona; y solventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (2e).

[0121] Como esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares y no es igual en cada caso, pero se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

[0122] Método de producción 9

Entre los ejemplos del compuesto representado por la fórmula general (1), el compuesto representado por la fórmula general (1f), en donde Q es el antes definido Q18 se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (11) a la etapa [i] descrita más abajo. Las condiciones de reacción para la etapa [i] son las mismas que las descritas con anterioridad.

[Quím. 12]

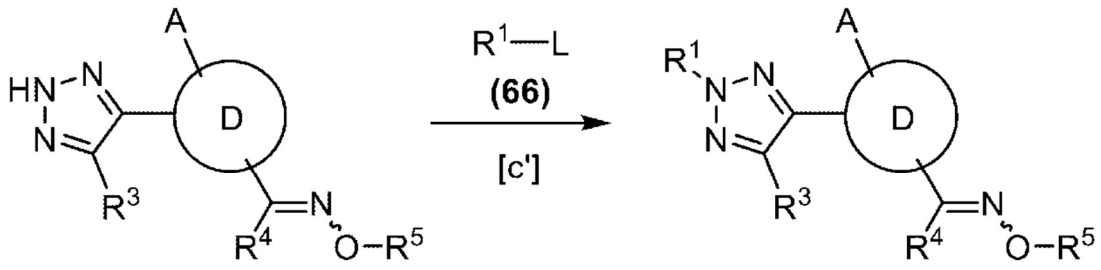


[0123] En la fórmula, A, D, R^1, R^2, R^4 y R^5 son iguales que antes; y L representa un grupo saliente tales como cloro, bromo, yodo o un grupo alquil (C_1–C_6)–carboniloxi.

[0124] Método de producción 10

Entre los ejemplos del compuesto representado por la fórmula general (1), el compuesto representado por la fórmula general (1g), en donde Q es el antes definido Q11 se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (2f) a la etapa [c'] descrita más abajo. Las condiciones de reacción para la etapa [c'] son las mismas que las descritas con anterioridad.

[Quím. 13]



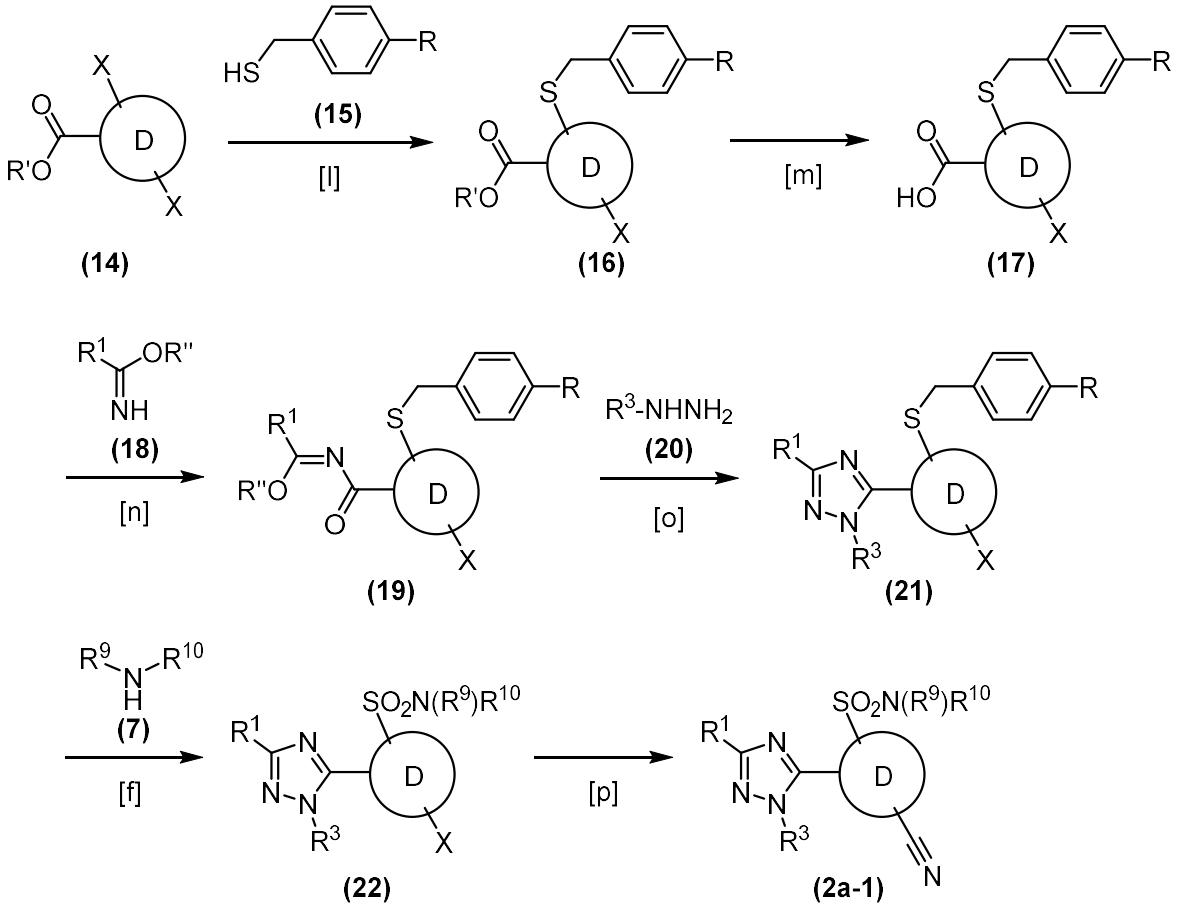
(2f) **(1g)**

[0125] En la fórmula, A, D, R^1, R^3, R^4 y R^5 son iguales que antes; y L representa un grupo saliente tales como cloro, bromo, yodo o un grupo alquil (C_1–C_6)–carboniloxi.

[0126] Método de producción 1 para el compuesto de partida

Entre los ejemplos del compuesto representado por la fórmula general (2a) como el compuesto de partida para los Métodos de producción 1 y 2, el compuesto representado por la fórmula general (2a–1), en donde Q es el Q1 antes definido y A es $SO_2N(R^9)R^{10}$ antes definido se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (14) a través de las etapas [l], [m], [n], [o], [f] y [p] descrita más abajo. Las condiciones de reacción para las etapas [l] y [f] son las mismas que las descritas con anterioridad.

[Quím. 14]



[0127] En la fórmula, D, R^1, R^3, R^9 y R^{10} son iguales que antes; R representa un grupo alquilo (C_1–C_4) tales como un grupo ter-butilo o un átomo de hidrógeno; R' y R" representan un grupo alquilo (C_1–C_6) tales como un grupo metilo o un grupo etilo; y X representa un grupo saliente tales como cloro, bromo o yodo.

[0128] Método de producción en la etapa [m]

El compuesto representado por la fórmula general (17) se puede producir hidrolizando el compuesto representado por la fórmula general (16) en presencia de una base, agua y un solvente inerte.

[0129] Los ejemplos de la base que se pueden usar en esta reacción incluyen bases orgánicas tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de calcio y otros hidróxidos. La cantidad de la base usada está usualmente

en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (16).

[0130] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos saturados de cadena o cíclicos tales como pentano, hexano y ciclohexano; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, tetrahidrofurano (THF) y dioxano; y solventes no polares que incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (16).

[0131] La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de 0 °C al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares y no es igual en cada caso, pero se selecciona básicamente de ser apropiado del intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente etapa sin aislamiento del compuesto de interés.

[0132] Método de producción en la etapa [n]

El compuesto representado por la fórmula general (19) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (17) con el compuesto representado por la fórmula general (18) en presencia de una base, un agente de condensación y un solvente inerte.

[0133] Los ejemplos del agente de condensación que se pueden usar en esta condensación incluyen reactivos activantes de ácido tales como fosgeno, tricloruro de fósforo, oxicloruro de fósforo, cloruro de oxalilo y cloruro de tionilo; carbodiimidas tales como N,N'-diciclohexilcarbodiimida (DCC) y 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDCI); y otros reactivos tales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-carbonildiimidazol, 2-cloropiridin-1-metoyoduro (reactivo de Mukaiyama), 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetracloruro de carbono, hexafluorofosfato de bromotripirrolidinofosfonio (BROP), hexafluorofosfato de O-(1H-benzotriazol-1-iloxi)tris(dimetilamino)fosfonio (BOP), tetrafluoroborato de N,N,N',N'-bis(tetrametilen)clorouronio, hexafluorofosfato de O-(1H-benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio (HBTU), hexafluorofosfato de O-(1H-benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-bis(tetrametilen)uronio, tetrafluoroborato de O-(1H-benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio (TBTU), tetrafluoroborato de O-(1H-benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-bis(tetrametilen)uronio, hexafluorofosfato de O-(7-azabenzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio (HATU), 1-hidroxibenzotriazol (HOBt), anhídrido propilfosfónico (T_3P) y sal de 4-(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)-4-metilmorfolinio (DMT-MM). Uno de estos agentes de condensación se puede usar solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del agente de condensación usada se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de una cantidad molar de 0,5 a 5 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (17).

[0134] Los ejemplos de la base que se pueden usar en la condensación incluyen carbonatos tales como carbonato de litio, hidrógeno-carbonato de litio, carbonato de sodio, hidrógeno-carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrógeno-carbonato de potasio, carbonato de calcio y carbonato

de magnesio; acetatos tales como acetato de litio, acetato de sodio y acetato de potasio; y bases orgánicas tales como piridina, picolina, lutidina, trietilamina, tributilamina y N,N-diisopropiletilamina. La cantidad de la base usada se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de una cantidad molar de 0,5 a 5 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (17). En algunos casos, la base se puede usar como el solvente.

[0135] El solvente inerte usado en la condensación puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos saturados de cadena o cíclicos tales como pentano, hexano y ciclohexano; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, THF y dioxano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; nitrilos tales como acetonitrilo e isopropilnitrilo; y solventes polares tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (17). En el caso en que la base se use también como el solvente, no es necesario usar otro solvente.

[0136] Como la condensación es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de 0 °C al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares y no es igual en cada caso,

pero se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente etapa sin aislamiento del compuesto de interés.

[0137] Método de producción en la etapa [o]

El compuesto representado por la fórmula general (21) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (19) con el compuesto representado por la fórmula general (20) o una de sus sales en presencia de un solvente inerte con o sin una base.

[0138] Los ejemplos de la base que se pueden usar en esta reacción incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrógeno-carbonato de sodio e hidrógeno-carbonato de potasio; acetatos tales como acetato de sodio y acetato de potasio; alcóxidos de metal alcalino tales como ter-butóxido de potasio, metóxido de sodio y etóxido de sodio; aminas terciarias tales como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina y DBU; y compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y N,N-dimetil-4-aminopiridina. La cantidad de la base usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (19).

[0139] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos

tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; alcoholes tales como metanol, etanol, propanol y alcohol isopropílico; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metiletilcetona; y solventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (19).

[0140] Como esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero está básicamente en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente etapa sin aislamiento del compuesto de interés.

[0141] Método de producción en la etapa [p]

El compuesto representado por la fórmula general (2a-1) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (22) con un agente cianizante en presencia de una base y un solvente inerte con o sin a catalizador de metal.

[0142] Los ejemplos del agente cianizante que se pueden usar en esta reacción incluyen cianuro de sodio, cianuro de potasio, cianuro de trimetilsililo y cianuro de zinc. La cantidad de agente cianizante usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (22).

[0143] Los ejemplos de la base que se pueden usar en esta reacción incluyen carbonatos tales como carbonato de litio, hidrógeno-carbonato de litio, carbonato de sodio, hidrógeno-carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrógeno-carbonato de potasio, carbonato de calcio y carbonato de magnesio; acetatos tales como acetato de litio, acetato de sodio y acetato de potasio; y bases orgánicas tales como piridina, picolina, lutidina, trietilamina, tributilamina, N,N-diisopropiletilamina y 1,4-diazabiciclo[2,2,2]octano. La cantidad de la base usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 5 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (22).

[0144] Los ejemplos del catalizador de metal que se pueden usar en esta reacción incluyen un catalizador de paladio, un catalizador de níquel, un catalizador de hierro, un catalizador de rutenio, un catalizador de platino, un catalizador de rodio y un catalizador de iridio. Tal catalizador de metal se puede usar en forma de un metal; un metal soportado; una sal metálica tales como un cloruro de metal, un bromuro de metal, un yoduro de metal, un nitrato de metal, un sulfato de metal, un carbonato de metal, un oxalato de metal, un acetato de metal y un óxido de metal; o un compuesto complejo tales como un complejo de olefina, un complejo de fosfina, un complejo de amina, y un complejo de acetilacetonato.

[0145] Entre estos catalizadores de metal, se prefieren en particular los catalizadores de paladio. Los ejemplos del catalizador de paladio incluyen metales de paladio tales como negro de paladio y esponja de paladio; y metales de paladio

soportados tales como paladio/alúmina, paladio/carbón, paladio/sílice y paladio/zeolita de tipo Y. También se incluyen sales metálicas de paladio tales como cloruro de paladio, bromuro de paladio, yoduro de paladio y acetato de paladio. Otros ejemplos del catalizador de paladio incluyen compuestos de complejo de paladio tales como dímero de cloruro de π-alilpaladio dimer, acetilacetonato de paladio, diclorobis(acetonitrilo)paladio, diclorobis(benzonitrilo)paladio, bis(dibencilidenacetona)paladio, tris(dibencilidenacetona)dipaladio, tris(dibencilidenacetona)dipaladio (aducto de cloroformo), diclorodiamina paladio, diclorobis(trifenilfosfina)paladio, diclorobis(triciclohexilfosfina)paladio, tetrakis(trifenilfosfina)paladio, dicloro[1,2-bis(difenilfosfino)etano]paladio, dicloro[1,3-bis(difenilfosfino)propano]paladio, dicloro[1,4-bis(difenilfosfino)butano]paladio, dicloro[1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio y un complejo de [(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaladio-diclorometano. La cantidad del catalizador de metal usada se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de una cantidad molar de 0,001 a 0,5 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (22).

[0146] Estos catalizadores de paladio se pueden usar solos o en combinación con una fosfina terciaria. Los ejemplos de la fosfina terciaria que se pueden usar en combinación con el catalizador de paladio incluyen trifenilfosfina, trimetilfosfina, trietilfosfina, tributilfosfina, tri(ter-butil)fosfina, triciclohexilfosfina, tri-o-tolilfosfina, trioctilfosfina, 9,9-dimetil-4,5-bis(difenilfosfino)xanteno, 2-(di-ter-butilfosfino)bifenilo, 2-(diciclohexilfosfino)bifenilo, 1,2-bis(difenilfosfino)etano, 1,3-bis(difenilfosfino)propano, 1,4-

bis(difenilfosfino)butano, 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno, (R)-(+)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo, (S)-(-)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo y (±)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo. La cantidad de la fosfina terciaria usada se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de una cantidad molar de 0,5 a 10 veces respecto del catalizador de metal.

[0147] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente la reacción y los ejemplos incluyen alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol y 2-propanol; hidrocarburos saturados de cadena o cíclicos tales como pentano, hexano y ciclohexano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano, tetrahidrofurano y ciclopentil metil éter; ésteres tales como acetato de etilo; nitrilos tales como acetonitrilo y propionitrilo; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metiletilcetona; solventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona; y agua. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (22).

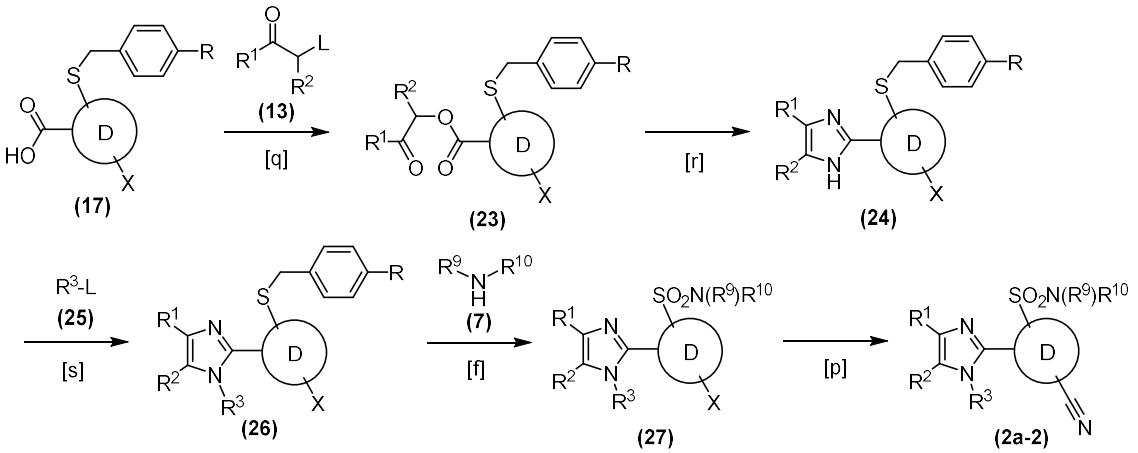
[0148] La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de 0 °C al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de

reacción, la temperatura de reacción, y similares y no es igual en cada caso, pero se selecciona básicamente de ser apropiado del intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente reacción sin aislamiento del compuesto de interés.

[0149] Método de producción 2 para el compuesto de partida

Entre los ejemplos del compuesto representado por la fórmula general (2a) como el compuesto de partida para los Métodos de producción 1 y 2, el compuesto representado por la fórmula general (2a-2), en donde Q es el Q2 antes definido y A es $SO_2N(R^9)R^{10}$ antes definido se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (17) a través de las etapas [q], [r], [s], [f] y [p] descrita más abajo. Las condiciones de reacción para las etapas [f] y [p] son las mismas que las descritas con anterioridad.

[Quím. 15]



[0150] En la fórmula, D, R^1, R^2, R^3, R^9 y R^{10} son iguales que antes; R representa un grupo alquilo (C_1–C_4) tales como un grupo ter-butilo o un átomo de hidrógeno; X representa un grupo saliente tales como cloro, bromo o yodo; y L representa un grupo

saliente tales como cloro, bromo, yodo o un grupo alquil (C_1-C_6)-carboniloxi.

[0151] Método de producción en la etapa [q]

El compuesto representado por la fórmula general (23) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (17) con el compuesto representado por la fórmula general (13) en presencia de una base y un solvente inerte.

[0152] Los ejemplos de la base que se pueden usar en esta reacción incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrógeno-carbonato de sodio e hidrógeno-carbonato de potasio; acetatos tales como acetato de sodio y acetato de potasio; alcóxidos de metal alcalino tales como ter-butóxido de potasio, metóxido de sodio y etóxido de sodio; aminas terciarias tales como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina y DBU; y compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y N,N-dimetil-4-aminopiridina. La cantidad de la base usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (17).

[0153] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metiletilcetona; y solventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos solventes inertes puede usarse

solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (17).

[0154] Como esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero está básicamente en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente etapa sin aislamiento del compuesto de interés.

[0155] Método de producción en la etapa [r]

El compuesto representado por la fórmula general (24) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (23) con una fuente de nitrógeno en presencia de un ácido y un solvente inerte.

[0156] Los ejemplos de la fuente de nitrógeno que se pueden usar en esta reacción incluyen amoníaco, amonio carbamato, amonio acetato y amonio carbonato. La cantidad de la fuente de nitrógeno usada se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 20 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (23).

[0157] Los ejemplos del ácido que se pueden usar en esta reacción incluyen ácidos inorgánicos tales como ácido clorhídrico, ácido sulfúrico y ácido nítrico; ácidos orgánicos

tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido trifluoroacético y ácido benzoico; sulfónicos tales como metansulfónico, trifluorometansulfónico y p-toluensulfónico; y ácido fosfórico. La cantidad del ácido usado se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de una cantidad molar de 0,01 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (23). En algunos casos, el ácido también se puede usar como el solvente.

[0158] El solvente inerte usado en la deshidratación puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metiletilcetona; y solventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (23) obtenido por la condensación. En el caso de usar el ácido como el solvente, no es necesario usar otro solvente.

[0159] La temperatura de reacción en la deshidratación está usualmente en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero se selecciona básicamente de ser apropiado del intervalo de

algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente etapa sin aislamiento del compuesto de interés.

[0160] Método de producción en la etapa [s]

El compuesto representado por la fórmula general (26) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (24) con el compuesto representado por la fórmula general (25) en presencia de un solvente inerte y a base.

[0161] Los ejemplos de la base que se pueden usar en esta reacción incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrógeno-carbonato de sodio, hidrógeno-carbonato de potasio e hidruro de sodio; acetatos tales como acetato de sodio y acetato de potasio; alcóxidos de metal alcalino tales como ter-butóxido de potasio, metóxido de sodio y etóxido de sodio; aminas terciarias tales como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina y DBU; y compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y N,N-dimetil-4-aminopiridina. La cantidad de la base usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (24).

[0162] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos

tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metiletilcetona; y solventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (24).

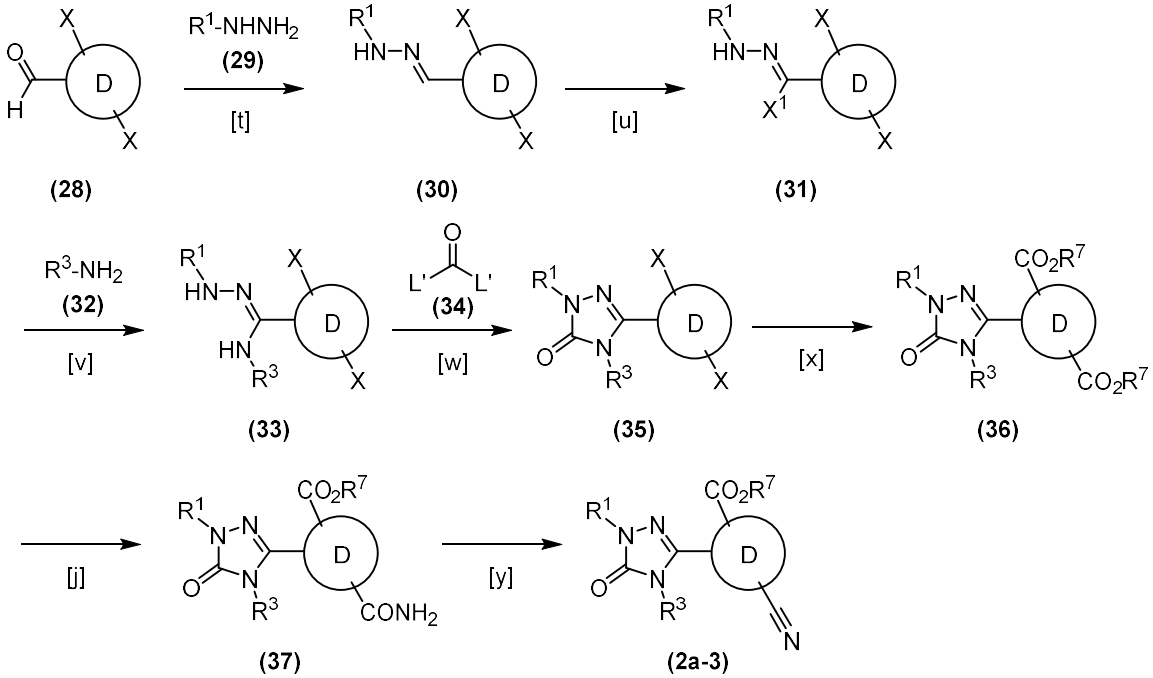
[0163] Como esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares y no es igual en cada caso, pero se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

[0164] Método de producción 3 para el compuesto de partida

Entre los ejemplos del compuesto representado por la fórmula general (2a) como el compuesto de partida para los Métodos de producción 1 y 2, el compuesto representado por la fórmula general (2a-3), en donde Q es el Q5 antes definido y A es CO_2R^7 antes definido se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (28) a través de las etapas [t], [u], [v], [w], [x], [j] y [i] descrita más abajo. Las

condiciones de reacción para la etapa [j] son las mismas que las descritas con anterioridad.

[Quím. 16]



[0165] En la fórmula, D, R^1, R^3 y R^7 son iguales que antes; X representa un grupo saliente tales como cloro, bromo o yodo; X^1 representa un átomo de halógeno tales como cloro, bromo o yodo; y L' representa un grupo saliente tales como cloro, bromo, yodo, un grupo haloalcoxi (C_1–C_6) o un grupo imidazolilo.

[0166] Método de producción en la etapa [t]

El compuesto representado por la fórmula general (30) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (28) con el compuesto representado por la fórmula general (29) en presencia de un solvente inerte con o sin un ácido.

[0167] Los ejemplos del ácido que se pueden usar en esta reacción incluyen ácidos inorgánicos tales como ácido clorhídrico, ácido sulfúrico y ácido nítrico; ácidos orgánicos tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido trifluoroacético y ácido benzoico; ácidos sulfónicos tales como ácido metansulfónico, ácido trifluorometansulfónico y ácido p-toluensulfónico; y ácido

fosfórico. La cantidad del ácido usado está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 0,01 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (28).

[0168] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol y 2-propanol; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; y solventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (28) obtenido por la condensación.

[0169] Como esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero se selecciona básicamente de ser apropiado del intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de

posreacción se puede usar directamente en la siguiente etapa sin aislamiento del compuesto de interés.

[0170] Método de producción en la etapa [u]

El compuesto representado por la fórmula general (31) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (30) con un agente halogenante en presencia de un solvente inerte con o sin una base.

[0171] Los ejemplos del agente halogenante que se pueden usar en esta reacción incluyen N-halosuccinimidas tales como N-clorosuccinimida y N-bromosuccinimida; sales de metal alcalino hipohalogenoso tales como hipoclorito de sodio; ésteres de ácido hipohalogenoso tales como hipoclorito de ter-butilo; simples halógenos tales como gas cloro; pentacloruro de fósforo; y cloruro de sulfurilo. La cantidad del agente halogenante usado está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (30).

[0172] Los ejemplos de la base que se pueden usar en esta reacción incluyen hidruros de metal alcalino tales como hidruro de sodio; hidróxidos de metal alcalino tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio; carbonatos de metal alcalino tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de cesio; sales inorgánicas; y bases orgánicas tales como piridina, DBU y trietilamina. La cantidad de la base usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (30).

[0173] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloroformo y diclorometano; ésteres tales como acetato de etilo y acetato de metilo; éteres de cadena o cíclicos tales como tetrahidrofurano, éter dietílico, éter metil ter-butílico, 1,2-dimetoxietano y dioxano; nitrilos tales como acetonitrilo;

y solventes polares tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilpirrolidona, dimetilsulfóxido y agua. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (30).

[0174] La temperatura de reacción en esta reacción se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de -50 °C al punto de ebullición del solvente inerte usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero está básicamente en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, cuando el compuesto representado por la fórmula general (31) es estable, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente reacción sin aislamiento del compuesto de interés. Cuando el compuesto representado por la fórmula general (31) es inestable, la mezcla de posreacción se usa directamente en la siguiente etapa sin purificación.

[0175] Método de producción en la etapa [v]

El compuesto representado por la fórmula general (33) se puede producir aminando el compuesto representado por la fórmula general (31) con el compuesto representado por la fórmula general (32) en presencia de un solvente inerte con o sin una base.

[0176] Los ejemplos de la base que se pueden usar en esta reacción incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de

potasio, carbonato de cesio, hidrógeno-carbonato de sodio e hidrógeno-carbonato de potasio; acetatos tales como acetato de sodio y acetato de potasio; alcóxidos de metal alcalino tales como ter-butóxido de potasio, metóxido de sodio y etóxido de sodio; aminas terciarias tales como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina y DBU; y compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y N,N-dimetil-4-aminopiridina. La cantidad de la base usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (31).

[0177] El solvente inerte que se pueden usar en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; alcoholes tales como metanol, etanol, propanol y alcohol isopropílico; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; y solventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (31).

[0178] Como esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del

solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero está básicamente en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente etapa sin aislamiento del compuesto de interés.

[0179] Método de producción en la etapa [w]

El compuesto representado por la fórmula general (35) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (33) con el compuesto representado por la fórmula general (34) en presencia de una base y un solvente inerte.

[0180] Los ejemplos de la base que se pueden usar en esta reacción incluyen bases inorgánicas incluyendo hidróxidos de metal alcalino tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio; hidruros de metal alcalino tales como hidruro de sodio e hidruro de potasio; alcóxidos de metal alcalino tales como etóxido de sodio y ter-butóxido de potasio; y carbonatos tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio e hidrógeno-carbonato de sodio; y bases orgánicas tales como trietilamina, piridina, N,N-dimetil-4-aminopiridina y DBU. La cantidad de la base usada se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (33). En algunos casos, la base se puede usar como el solvente.

[0181] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos saturados de cadena o cíclicos tales como pentano, hexano y ciclohexano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno;

hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; nitrilos tales como acetonitrilo y propionitrilo; ésteres tales como acetato de metilo; cetonas tales como acetona y metiletilcetona; solventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona; y alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol y 2-propanol. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,1 a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (33). En el caso en que la base se use también como el solvente, no es necesario usar otro solvente.

[0182] Como esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de 0 °C al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares y no es igual en cada caso, pero se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente etapa sin aislamiento del compuesto de interés.

[0183] Método de producción en la etapa [x]

El compuesto representado por la fórmula general (36), que tiene grupos éster introducidos en las posiciones C–3 y C–6, se puede sintetizar a partir del compuesto representado por la fórmula general (35) de acuerdo con el método descrito en el documento JP 2005–272338 (reacción de Heck). Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente etapa sin aislamiento del compuesto de interés.

[0184] Método de producción en la etapa [i]

El compuesto representado por la fórmula general (2a–3) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (37) con un agente deshidratante en presencia de un solvente inerte con o sin una base.

[0185] Los ejemplos del agente deshidratante usado en esta reacción incluyen trifluoroanhídrido acético, oxicloruro de fósforo y pentóxido de fósforo. La cantidad de te agente deshidratante usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (37).

[0186] La base usada en esta reacción puede ser una base inorgánica o una base orgánica. Los ejemplos de la base inorgánica incluyen hidróxidos de metal alcalino tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio; hidruros de metal alcalino tales como hidruro de sodio e hidruro de potasio; alcóxidos de metal alcalino tales como etóxido de sodio y ter–butóxido de potasio; y carbonatos tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio e hidrógeno–carbonato de sodio. Los ejemplos de la base orgánica incluyen trietilamina, piridina y DBU. La cantidad de la base usada se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de una cantidad

molar de 0,01 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (37).

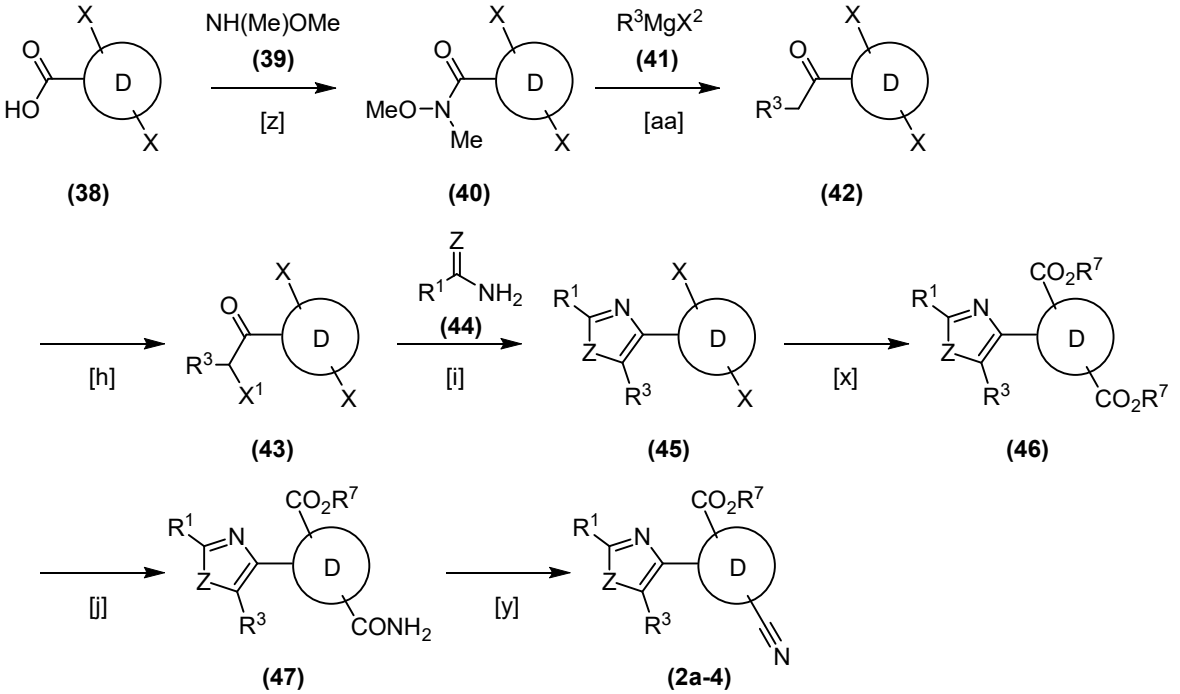
[0187] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos alifáticos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, dioxano y tetrahidrofurano; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; y otros solventes inertes tales como dimetilsulfóxido, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, acetona y metiletilcetona. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (37).

[0188] La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de 0 °C al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares y no es igual en cada caso, pero se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se usa directamente en la siguiente reacción sin purificación.

[0189] Método de producción 4 para el compuesto de partida

Entre los ejemplos del compuesto representado por la fórmula general (2a) como el compuesto de partida para los Métodos de producción 1 y 2, el compuesto representado por la fórmula general (2a-4), en donde Q es el antes definido Q7 o Q12 y A es el antes definido CO_2R^7 se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (38) a través de las etapas [z], [aa], [h], [i], [x], [j] y [i] descrita más abajo. Las condiciones de reacción para las etapas [h], [i], [x], [j] y [i] son las mismas que las descritas con anterioridad.

[Quím. 17]



[0190] En la fórmula, D, R^1, R^3 y R^7 son iguales que antes; Z representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre; X representa un grupo saliente tales como cloro, bromo o yodo; y X^1 y X^2 representan un átomo de halógeno tales como cloro, bromo o yodo.

[0191] Método de producción en la etapa [z]

El compuesto representado por la fórmula general (40) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (38) con un agente halogenante en presencia de un solvente inerte para formar un haluro de ácido y luego haciendo reaccionar el haluro de ácido con el compuesto

representado por la fórmula (39) en presencia de un solvente inerte con o sin una base.

[0192] Los ejemplos del agente halogenante que se pueden usar en esta hidrogenación incluyen cloruro de oxalilo, cloruro de tionilo, tricloruro de fósforo, tribromuro de fósforo, pentacloruro de fósforo y oxicloruro de fósforo. La cantidad del agente halogenante usado está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (38).

[0193] El solvente inerte usado en esta hidrogenación puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloroformo y diclorometano; ésteres tales como acetato de etilo y acetato de metilo; éteres de cadena o cíclicos tales como tetrahidrofurano, éter dietílico, éter metil ter-butílico, 1,2-dimetoxietano y dioxano; nitrilos tales como acetonitrilo; y solventes polares tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilpirrolidona y dimetilsulfóxido. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (38).

[0194] La temperatura de reacción en la hidrogenación está usualmente en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero está básicamente en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. Alternativamente,

la mezcla de posreacción se usa directamente en la siguiente reacción sin purificación.

[0195] Los ejemplos de la base que se pueden usar en la amidación incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrógeno-carbonato de sodio e hidrógeno-carbonato de potasio; acetatos tales como acetato de sodio y acetato de potasio; alcóxidos de metal alcalino tales como ter-butóxido de potasio, metóxido de sodio y etóxido de sodio; aminas terciarias tales como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina y DBU; y compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y N,N-dimetil-4-aminopiridina. La cantidad de la base usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (38).

[0196] El solvente inerte usado en la amidación puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; alcoholes tales como metanol, etanol, propanol y alcohol isopropílico; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; y solventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (38).

[0197] Como la amidación es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero está básicamente en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se usa directamente en la siguiente reacción sin purificación.

[0198] Método de producción en la etapa [aa]

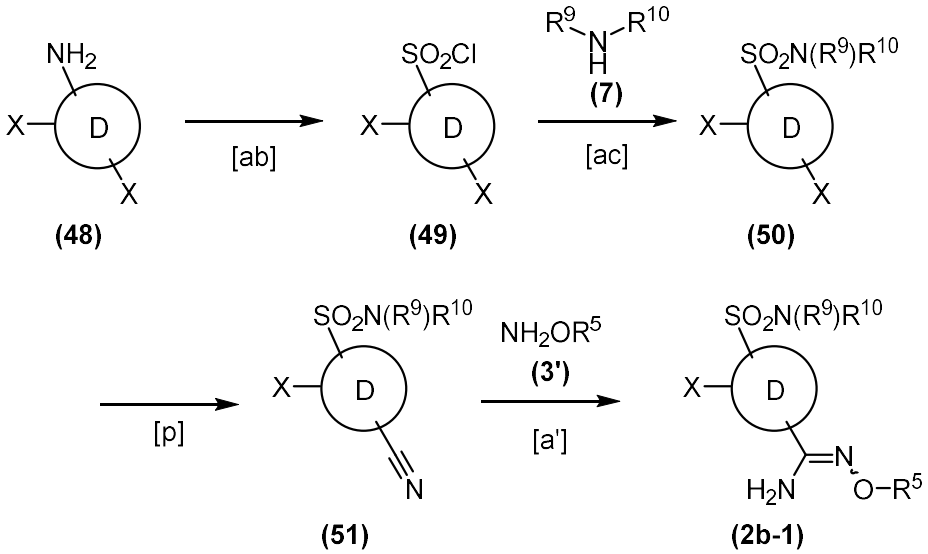
El compuesto representado por la fórmula general (42) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (40) con un compuesto de organomagnesio representado por la fórmula general (41) en presencia de un solvente inerte.

[0199] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloroformo y diclorometano; y solventes polares incluyendo éteres de cadena o cíclicos tales como tetrahidrofurano, éter dietílico, éter metil ter-butílico, 1,2-dimetoxietano y dioxano. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (40).

[0200] Como esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de −78 °C al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero está básicamente en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se usa directamente en la siguiente reacción sin purificación.

[0201] Método de producción 5 para el compuesto de partida

Entre los ejemplos del compuesto representado por la fórmula general (2b) como el compuesto de partida para el Método de producción 3, el compuesto representado por la fórmula general (2b-1), en donde A es el $SO_2N(R^9)R^{10}$ antes definido se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (48) a través de las etapas [ab], [ac], [p] y [a'] descrita más abajo. Las condiciones de reacción para las etapas [p] y [a'] son las mismas que las descritas con anterioridad. [Quím. 18]



[0202] En la fórmula, D, R^5, R^9 y R^{10} son iguales que antes; y X representa un grupo saliente tales como cloro, bromo o yodo.

[0203] Método de producción en la etapa [ab]

El compuesto representado por la fórmula general (49) se puede producir a través de clorosulfonilación del compuesto representado por la fórmula general (48) de acuerdo con el método descrito en Organic Process Research & Development, 2009, 13, 875-879 o WO 2020/041169.

[0204] Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente etapa sin aislamiento del compuesto de interés.

[0205] Método de producción en la etapa [ac]

El compuesto representado por la fórmula general (50) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (49) con el compuesto representado por la fórmula general (7) en presencia de un solvente inerte con o sin una base.

[0206] Los ejemplos de la base que se pueden usar en esta reacción incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrógeno-carbonato de sodio e hidrógeno-carbonato de potasio; acetatos tales como acetato de sodio y acetato de potasio; alcóxidos de metal alcalino tales como ter-butóxido de potasio, metóxido de sodio y etóxido de sodio; aminas terciarias tales como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina y DBU; y compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y N,N-dimetil-4-aminopiridina. La cantidad de la base usada está usualmente en

el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (49).

[0207] El solvente inerte que se pueden usar en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; alcoholes tales como metanol, etanol, propanol y alcohol isopropílico; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; y solventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (49).

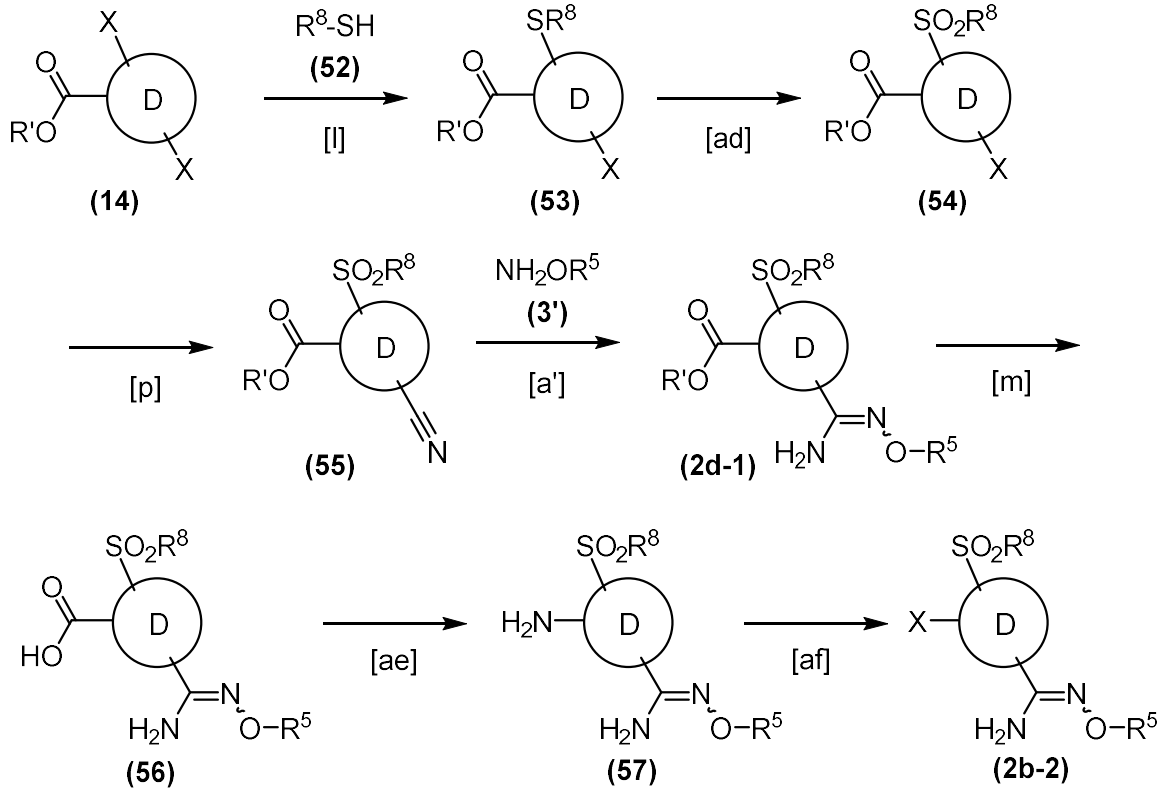
[0208] Como esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de 0 °C al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero está básicamente en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la

mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente etapa sin aislamiento del compuesto de interés.

[0209] Método de producción 6 para el compuesto de partida

Entre los ejemplos del compuesto representado por la fórmula general (2d) como el compuesto de partida para el Método de producción 7, el compuesto representado por la fórmula general (2d-1), en donde A es el SO_2R^8 antes definido se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (14) a través de las etapas [l], [ad], [p] y [a'] descrita más abajo. Entre los ejemplos del compuesto representado por la fórmula general (2b) como el compuesto de partida para el Método de producción 3, el compuesto representado por la fórmula general (2b-2), en donde A es el SO_2R^8 antes definido se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (2d-1) a través de las etapas [m], [ae] y [af] descrita más abajo. Las condiciones de reacción para las etapas [l], [p], [a'] y [m] son las mismas que las descritas con anterioridad.

[Quím. 19]



[0210] En la fórmula, D, R^5 y R^8 son iguales que antes; X representa un grupo saliente tales como cloro, bromo o yodo; y R' representa un grupo alquilo (C_1–C_6) tales como un grupo metilo o un grupo etilo.

[0211] Método de producción en la etapa [ad]

El compuesto representado por la fórmula general (54) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (53) con un agente oxidante en presencia de un solvente inerte.

[0212] Los ejemplos del agente oxidante que se pueden usar en esta reacción incluyen peróxidos tales como una solución de hidrógeno peróxido, ácido peroxibenzoico y ácido m-cloroperoxibenzoico. La cantidad de te agente oxidante usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 5 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (53).

[0213] El solvente inerte que se pueden usar en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente la reacción y los ejemplos incluyen éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, tetrahidrofurano y dioxano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; nitrilos tales como acetonitrilo; ésteres tales como acetato de etilo; ácidos orgánicos tales como ácido fórmico y ácido acético; y solventes polares tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona y agua. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de

0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (53).

[0214] La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de –10 °C al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares y no es igual en cada caso, pero se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente etapa sin aislamiento del compuesto de interés.

[0215] Método de producción en la etapa [ae]

El compuesto representado por la fórmula general (57) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (56) con difenilfosfato de azida en presencia de alcohol ter-butílico de acuerdo con el reordenamiento de Curtius, es decir, el método descrito en J. A. Quím. Soc. 1972, 94, 6203-6205, seguido del tratamiento con un ácido y un solvente inerte.

[0216] Los ejemplos del ácido que se pueden usar en esta reacción incluyen ácidos inorgánicos tales como ácido clorhídrico, ácido sulfúrico y ácido nítrico; ácidos orgánicos tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido trifluoroacético y ácido benzoico; y ácidos sulfónicos tales como metansulfónico y trifluorometansulfónico. La cantidad del ácido usado se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (56). En algunos casos, el ácido también se puede usar como el solvente.

[0217] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metiletilcetona; y solventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (56).

[0218] La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de -10 °C al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero está usualmente en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente etapa sin aislamiento del compuesto de interés.

[0219] Método de producción en la etapa [af]

El compuesto representado por la fórmula general (2b-2) se puede producir por conversión del grupo amino del compuesto representado por la fórmula general (57) a un átomo de halógeno

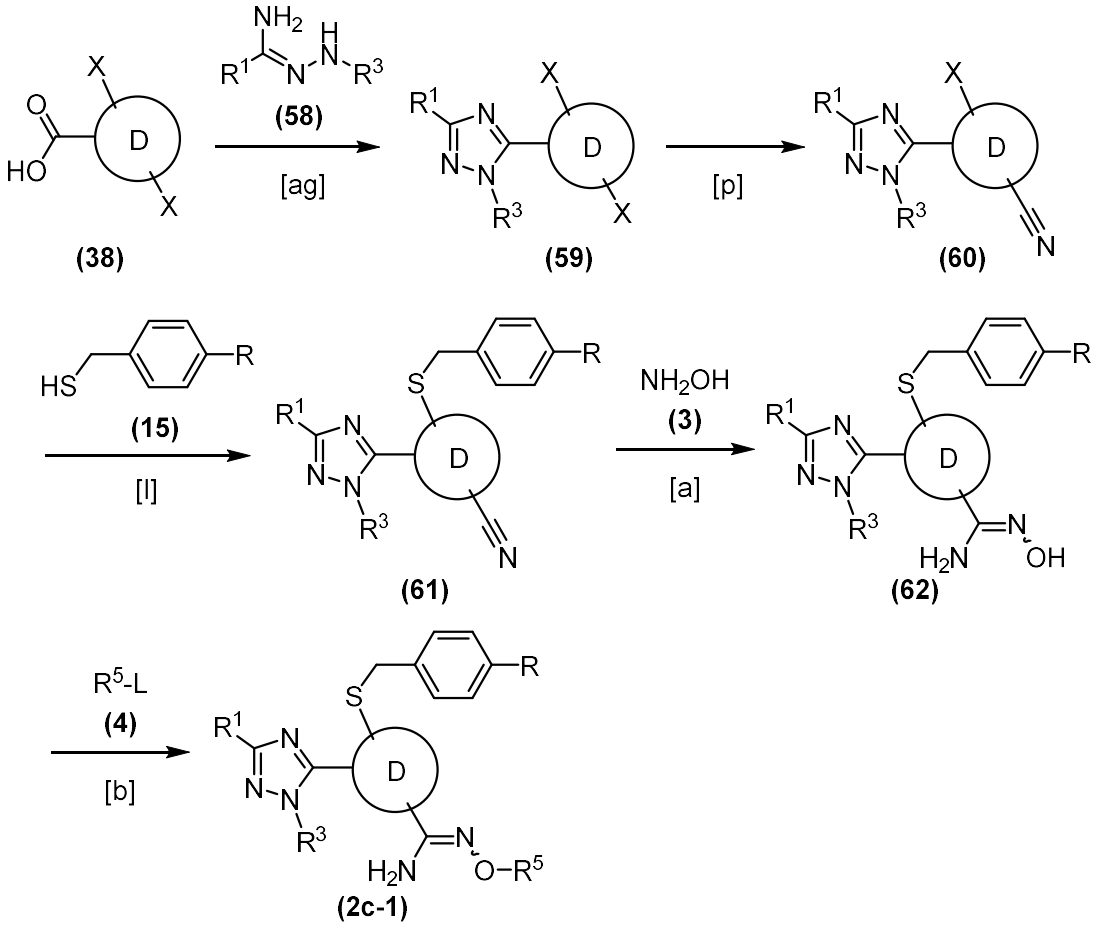
de acuerdo con el método descrito en Quím. Rev. 1988, 88, 765, es decir, la reacción de Sandmeyer.

[0220] Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

[0221] Método de producción 7 para el compuesto de partida

Entre los ejemplos del compuesto representado por la fórmula general (2c) como el compuesto de partida para el Método de producción 4, el compuesto representado por la fórmula general (2c–1), en donde Q es el Q1 antes definido se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (38) a través de las etapas [ag], [p], [l], [a] y [b] descrita más abajo. Las condiciones de reacción para las etapas [p], [l], [a] y [b] son las mismas que las descritas con anterioridad. El compuesto representado por la fórmula general (58) se puede producir por el método descrito en Chem. Ber., 1982, 115, 2807–2818 o WO 2018/160845 o su método modificado.

[Quím. 20]



[0222] En la fórmula, D, R^1, R^3 y R^5 son iguales que antes; L representa un grupo saliente tales como cloro, bromo, yodo o un grupo alquil (C_1–C_6)–carboniloxi; R representa un grupo alquilo (C_1–C_4) tales como un grupo ter–butilo o un átomo de hidrógeno; y X representa un grupo saliente tales como cloro, bromo o yodo.

[0223] Método de producción en la etapa [ag]

El compuesto representado por la fórmula general (59) se puede producir por condensación del compuesto representado por la fórmula general (38) con el compuesto representado por la fórmula general (58) en presencia de una base, un agente de condensación y un solvente inerte para formar un compuesto de amida, seguido de deshidratación en presencia de un ácido y un solvente inerte.

[0224] Los ejemplos del agente de condensación que se pueden usar en esta condensación incluyen reactivos activantes de

ácido tales como fosgeno, tricloruro de fósforo, oxicloruro de fósforo, cloruro de oxalilo y cloruro de tionilo; carbodiimidas tales como N,N'-diciclohexilcarbodiimida (DCC) y 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDCI); y otros reactivos tales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-carbonildiimidazol, 2-cloropiridin-1-metoyoduro (reactivo de Mukaiyama), 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetracloruro de carbono, hexafluorofosfato de bromotripirrolidinofosfonio (BROP), hexafluorofosfato de O-(1H-benzotriazol-1-iloxi)tris(dimetilamino)fosfonio (BOP), tetrafluoroborato de N,N,N',N'-bis(tetrametilen)clorouronio, hexafluorofosfato de O-(1H-benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio (HBTU), hexafluorofosfato de O-(1H-benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-bis(tetrametilen)uronio, tetrafluoroborato de O-(1H-benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio (TBTU), tetrafluoroborato de O-(1H-benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-bis(tetrametilen)uronio, hexafluorofosfato de O-(7-azabenzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio (HATU), 1-hidroxibenzotriazol (HOBt), anhídrido propilfosfónico (T_3P) y sal de 4-(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)-4-metilmorfolinio (DMT-MM). Uno de estos agentes de condensación se puede usar solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad de agente de condensación usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 0,5 a 5 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (38).

[0225] Los ejemplos de la base que se pueden usar en la condensación incluyen carbonatos tales como carbonato de litio, hidrógeno-carbonato de litio, carbonato de sodio, hidrógeno-carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrógeno-carbonato de potasio, carbonato de calcio y carbonato de magnesio; acetatos tales como acetato de litio, acetato de sodio y acetato de potasio; y bases orgánicas tales como piridina, picolina, lutidina, trietilamina, tributilamina y

N,N-diisopropiletilamina. La cantidad de la base usada se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de una cantidad molar de 0,5 a 5 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (38). En algunos casos, la base se puede usar como el solvente.

[0226] El solvente inerte usado en la condensación puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos saturados de cadena o cíclicos tales como pentano, hexano y ciclohexano; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, THF y dioxano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; nitrilos tales como acetonitrilo e isopropilnitrilo; y solventes polares tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (38). En el caso en que la base se use también como el solvente, no es necesario usar otro solvente.

[0227] Como la condensación es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en la condensación está usualmente en el intervalo de 0 °C al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares y no es igual en cada caso, pero se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción

por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente deshidratación sin aislamiento del compuesto de interés.

[0228] Los ejemplos del ácido que se pueden usar en la deshidratación incluyen ácidos inorgánicos tales como ácido clorhídrico, ácido sulfúrico y ácido nítrico; ácidos orgánicos tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido trifluoroacético y ácido benzoico; sulfónicos tales como metansulfónico, trifluorometansulfónico y p-toluensulfónico; y ácido fosfórico. La cantidad del ácido usado se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de una cantidad molar de 0,01 a 10 veces respecto del compuesto de amida. En algunos casos, el ácido también se puede usar como el solvente.

[0229] El solvente inerte usado en la deshidratación puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metiletilcetona; y solventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto de amida obtenido por la condensación. En el caso

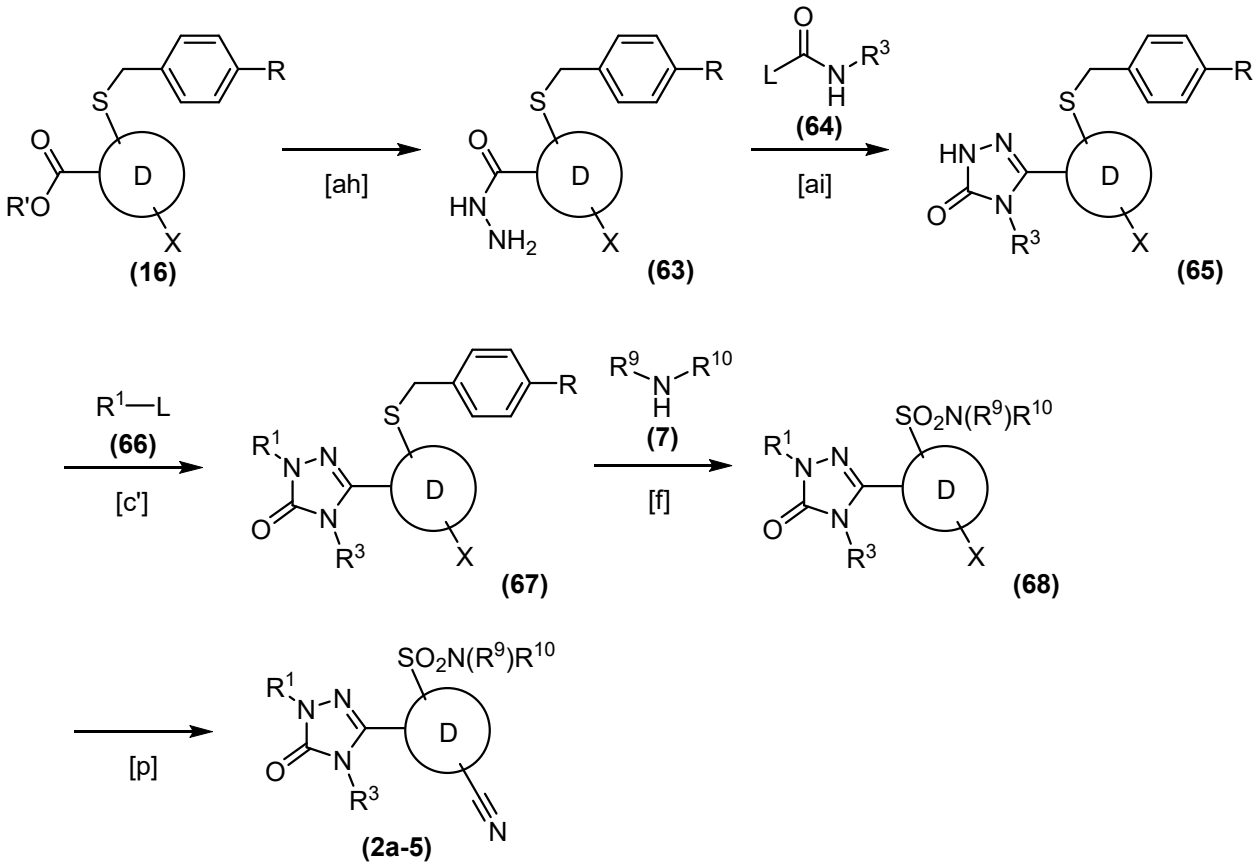
de usar el ácido como el solvente, no es necesario usar otro solvente.

[0230] La temperatura de reacción en la deshidratación está usualmente en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero se selecciona básicamente de ser apropiado del intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente etapa sin aislamiento del compuesto de interés.

[0231] Método de producción 8 para el compuesto de partida

Entre los ejemplos del compuesto representado por la fórmula general (2a) como el compuesto de partida para los Métodos de producción 1 y 2, el compuesto representado por la fórmula general (2a–5), en donde Q es el antes definido Q5 y A es el antes definido $SO_2N(R^9)R^{10}$ se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (16) a través de las etapas [ah], [ai], [c'], [f] y [p] descrita más abajo. Las condiciones de reacción para las etapas [c'], [f] y [p] son las mismas que las descritas con anterioridad.

[Quím. 21]



[0232] En la fórmula, D, R^1, R^3, R^9 y R^{10} son iguales que antes; R' representa un grupo alquilo (C_1–C_6) tales como un grupo metilo o un grupo etilo; X representa un grupo saliente tales como cloro, bromo o yodo; y L representa un grupo saliente tales como cloro, bromo, yodo o un grupo alquil (C_1–C_6)-carboniloxi.

[0233] Método de producción en la etapa [ah]

El compuesto representado por la fórmula general (63) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (16) con hidrazina en presencia de un solvente inerte con o sin una base.

[0234] La hidrazina usada en esta reacción puede estar en forma de una sal tales como clorhidrato o un hidrato. La cantidad de la hidrazina usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (16).

[0235] La base usada en esta reacción puede ser una base inorgánica o una base orgánica. Los ejemplos de la base inorgánica incluyen hidróxidos de metal alcalino tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio; hidruros de metal alcalino tales como hidruro de sodio e hidruro de potasio; alcóxidos de metal alcalino tales como etóxido de sodio y ter-butóxido de potasio; y carbonatos tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio e hidrógeno-carbonato de sodio. Los ejemplos de la base orgánica incluyen trietilamina, piridina y DBU. La cantidad de la base usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 0,01 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (16).

[0236] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos alifáticos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, dioxano y tetrahidrofurano; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; y otros solventes inertes tales como dimetilsulfóxido, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, acetona, metiletilcetona y agua. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (16).

[0237] La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de 0 °C al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de

reacción, la temperatura de reacción, y similares y no es igual en cada caso, pero se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se usa directamente en la siguiente reacción sin purificación.

[0238] Método de producción en la etapa [ai]

El compuesto representado por la fórmula general (65) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (63) con el compuesto representado por la fórmula general (64) en presencia de una base y un solvente inerte.

[0239] Los ejemplos de la base que se pueden usar en esta reacción incluyen bases inorgánicas incluyendo hidróxidos de metal alcalino tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio; hidruros de metal alcalino tales como hidruro de sodio e hidruro de potasio; alcóxidos de metal alcalino tales como etóxido de sodio y ter-butóxido de potasio; y carbonatos tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio e hidrógeno-carbonato de sodio; y bases orgánicas tales como trietilamina, piridina, N,N-dimetil-4-aminopiridina y DBU. La cantidad de la base usada se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (63). En algunos casos, la base se puede usar como el solvente.

[0240] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos saturados de cadena o cíclicos tales como pentano, hexano y ciclohexano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno;

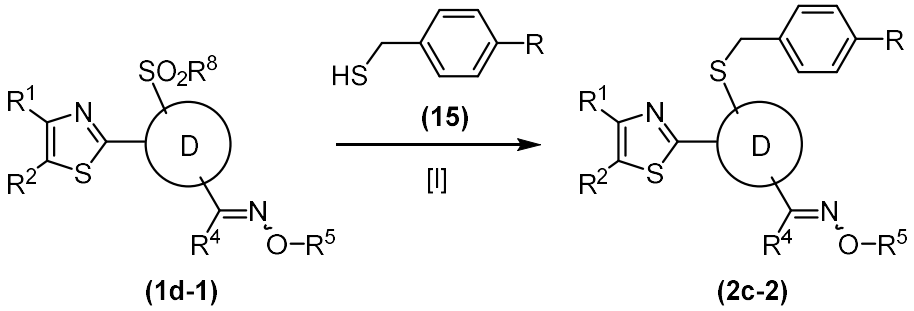
hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, éter metil ter-butílico, dioxano y tetrahidrofurano; nitrilos tales como acetonitrilo y propionitrilo; ésteres tales como acetato de metilo; cetonas tales como acetona y metiletilcetona; solventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona; y alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol y 2-propanol. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,1 a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (63). En el caso en que la base se use también como el solvente, no es necesario usar otro solvente.

[0241] Como esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de 0 °C al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares y no es igual en cada caso, pero se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente etapa sin aislamiento del compuesto de interés.

[0242] Método de producción 9 para el compuesto de partida

Entre los ejemplos del compuesto representado por la fórmula general (2c) como el compuesto de partida para el Método de producción 4, el compuesto representado por la fórmula general (2c–2), en donde Q es el Q8 antes definido se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (1d–1), en donde A es el antes definido SO_2R^8 como un ejemplo del compuesto representado por la fórmula general (1d) a la etapa [l] descrita más abajo. Las condiciones de reacción para la etapa [l] son las mismas que las descritas con anterioridad.

[Quím. 22]

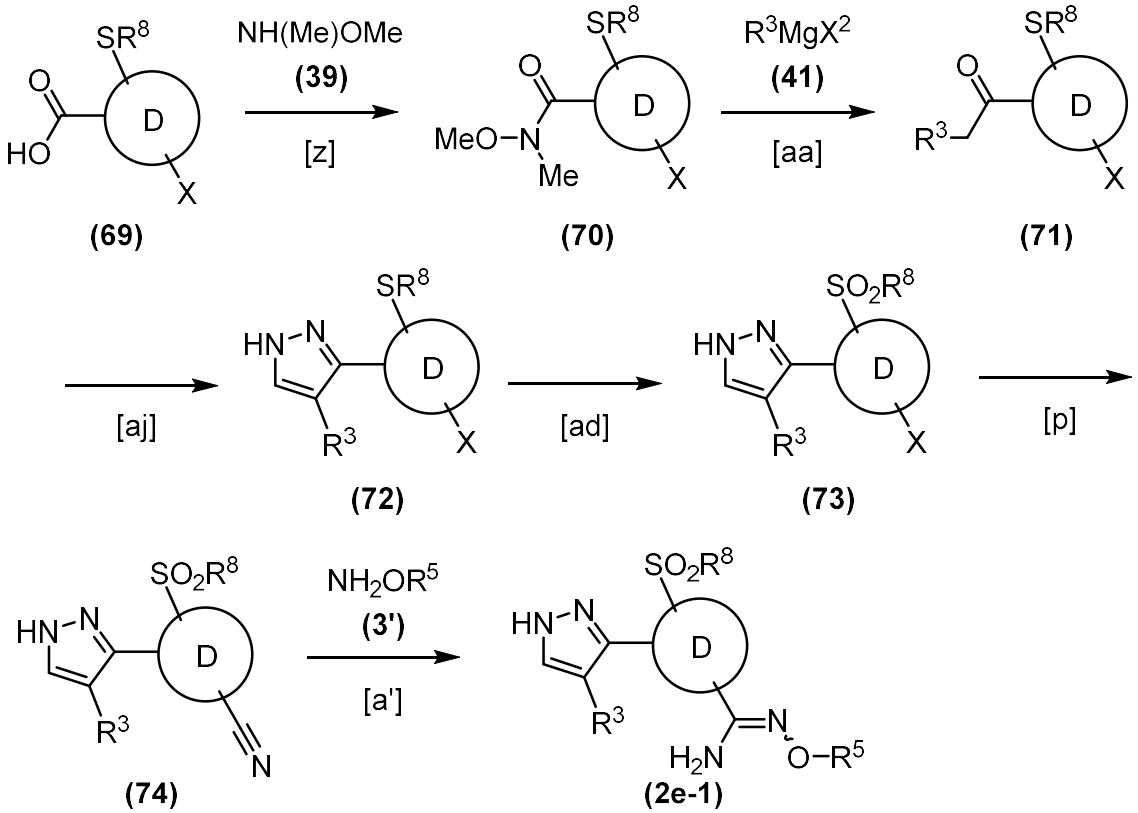


[0243] En la fórmula, D, R^1, R^2, R^5 y R^8 son iguales que antes; y R representa un grupo alquilo (C_1–C_4) tales como un grupo terbutilo o un átomo de hidrógeno.

[0244] Método de producción 10 para el compuesto de partida

Entre los ejemplos del compuesto representado por la fórmula general (2e) como el compuesto de partida para el Método de producción 8, el compuesto representado por la fórmula general (2e–1), en donde A es el SO_2R^8 antes definido se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (69) a través de las etapas [z], [aa], [aj], [ad], [p] y [a'] descrita más abajo. Las condiciones de reacción para las etapas [z], [aa], [ad], [p] y [a'] son las mismas que las descritas con anterioridad.

[Quím. 23]



[0245] En la fórmula, D, R^3, R^5 y R^8 son iguales que antes; X representa un grupo saliente tales como cloro, bromo o yodo; y X^2 representa un átomo de halógeno tales como cloro, bromo o yodo.

[0246] Método de producción en la etapa [aj]

El compuesto representado por la fórmula general (72) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (71) con un agente de homologación y hidrazina en presencia de un solvente inerte con o sin una base.

[0247] Los ejemplos del agente de homologación usado en esta reacción incluyen N,N-dimetilformamida dimetil acetal, N,N-dimetilformamida di-ter-butil acetal, ter-butoxibis(dimetilamino)metano, ortoformiato de trimetilo, formiato de metilo y formiato de etilo. La cantidad del agente de homologación usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 20 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (71).

[0248] La hidrazina usada en esta reacción puede estar en forma de una sal tales como clorhidrato o un hidrato. La cantidad de la hidrazina usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (71).

[0249] Los ejemplos de la base que se pueden usar en esta reacción incluyen bases inorgánicas incluyendo hidróxidos de metal alcalino tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio; hidruros de metal alcalino tales como hidruro de sodio e hidruro de potasio; alcóxidos de metal alcalino tales como etóxido de sodio y ter-butóxido de potasio; y carbonatos tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio e hidrógeno-carbonato de sodio; y bases orgánicas tales como trietilamina, piridina, N,N-dimetil-4-aminopiridina y DBU. La cantidad de la base usada está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (71).

[0250] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos alifáticos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, dioxano y tetrahidrofurano; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida; y otros solventes inertes tales como dimetilsulfóxido, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, acetona, metiletilcetona y agua. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L

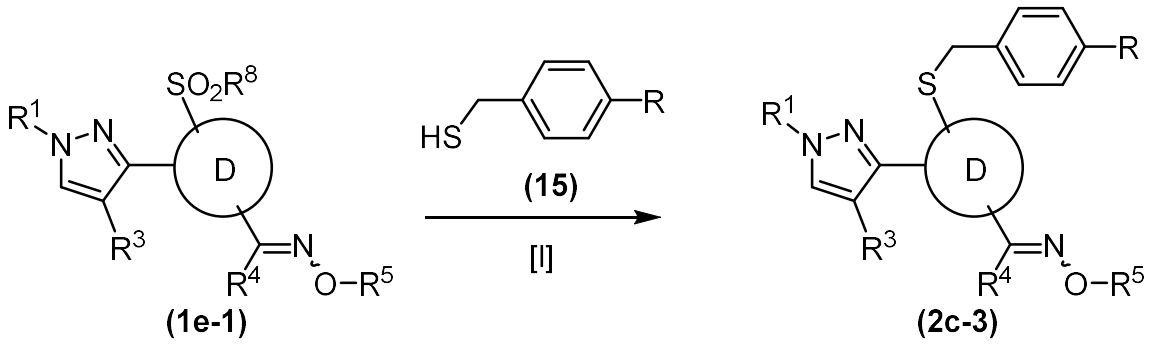
respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (71).

[0251] La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de 0 °C al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares y no es igual en cada caso, pero se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. Alternativamente, la mezcla de posreacción se usa directamente en la siguiente reacción sin purificación.

[0252] Método de producción 11 para el compuesto de partida

Entre los ejemplos del compuesto representado por la fórmula general (2c) como el compuesto de partida para el Método de producción 4, el compuesto representado por la fórmula general (2c-3), en donde Q es el Q10 antes definido se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (1e-1), en donde A es el SO_2R^8 antes definido como un ejemplo del compuesto representado por la fórmula general (1e) a la etapa [l] descrita más abajo. Las condiciones de reacción para la etapa [l] son las mismas que las descritas con anterioridad.

[Quím. 24]

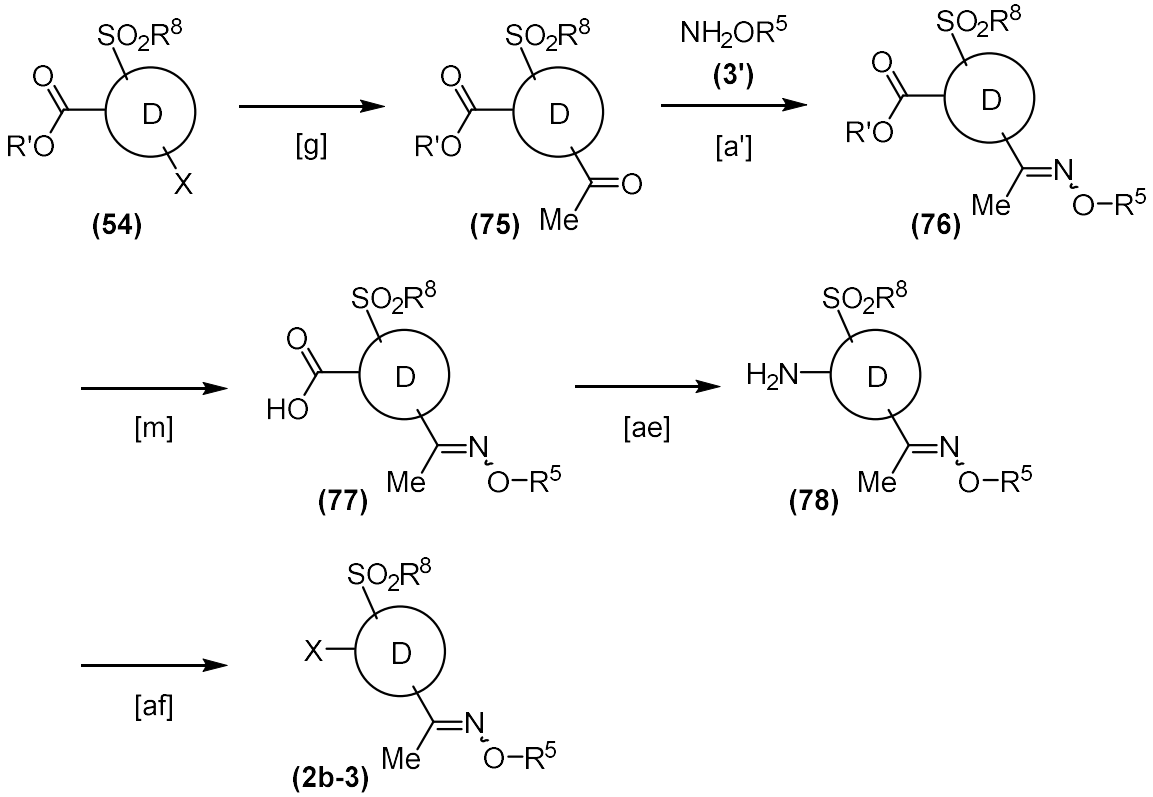


[0253] En la fórmula, D, R^1, R^3, R^4, R^5 y R^8 son iguales que antes; y R representa un grupo alquilo (C_1–C_4) tales como un grupo ter-butilo o un átomo de hidrógeno.

[0254] Método de producción 12 para el compuesto de partida

Entre los ejemplos del compuesto representado por la fórmula general (2b) como el compuesto de partida para el Método de producción 4, el compuesto representado por la fórmula general (2b–3), en donde A es el SO_2R^8 antes definido se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (54) a través de las etapas [g], [a'], [m], [ae] y [af] descrita más abajo. Las condiciones de reacción para las etapas [g], [a'], [m], [ae] y [af] son las mismas que las descritas con anterioridad.

[Quím. 25]



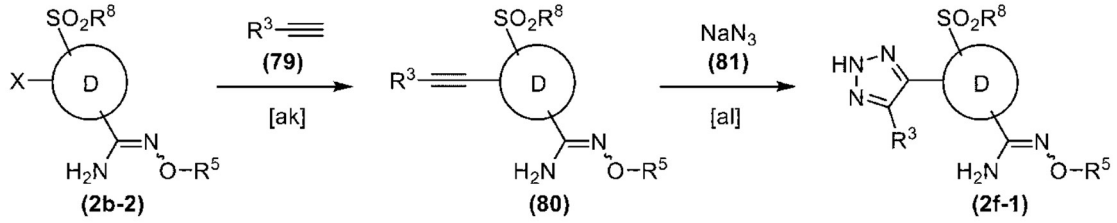
[0255] En la fórmula, D, R^5 y R^8 son iguales que antes; R' representa un grupo alquilo (C_1–C_6) tales como un grupo metilo

o un grupo etilo; y X representa un grupo saliente tales como cloro, bromo o yodo.

[0256] Método de producción 13 para el compuesto de partida

Entre los ejemplos del compuesto representado por la fórmula general (f) como el compuesto de partida para el Método de producción 10, el compuesto representado por la fórmula general (2f–1), en donde A es el SO_2R^8 antes definido se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (2b–2) a través de las etapas [ak] y [al] descrita más abajo.

[Quím. 26]



[0257] En la fórmula, D, R^3, R^5 y R^8 son iguales que antes; y X representa un grupo saliente tales como cloro, bromo o yodo.

[0258] Método de producción en la etapa [ak]

El compuesto representado por la fórmula general (80) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (2b–2) con el compuesto representado por la fórmula general (79) en presencia de un catalizador de paladio, yoduro de cobre, una base y un solvente inerte.

[0259] Los ejemplos del catalizador de paladio usado en esta reacción incluyen sales metálicas de paladio tales como cloruro de paladio, bromuro de paladio, yoduro de paladio y acetato de paladio; y compuestos de complejo de paladio tales como dímero de cloruro de π–alilpaladio, acetilacetonato de paladio, diclorobis(acetonitrilo)paladio,
diclorobis(benzonitrilo)paladio,
bis(dibencilidenacetona)paladio,
tris(dibencilidenacetona)dipaladio,
tris(dibencilidenacetona)dipaladio (aducto de cloroformo),
diclorodiamina paladio, diclorobis(trifenilfosfina)paladio,

diclorobis(triciclohexilfosfina)paladio, tetrakis(trifenilfosfina)paladio, dicloro[1,2-bis(difenilfosfino)etano]paladio, dicloro[1,3-bis(difenilfosfino)propano]paladio, dicloro[1,4-bis(difenilfosfino)butano]paladio, dicloro[1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio y un complejo de [(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaladio-diclorometano. La cantidad del catalizador de metal usada se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de una cantidad molar de 0,001 a 0,5 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (2b-2).

[0260] Estos catalizadores de paladio se pueden usar solos o en combinación con una fosfina terciaria. Los ejemplos de la fosfina terciaria que se pueden usar en combinación con el catalizador de paladio incluyen trifenilfosfina, trimetilfosfina, trietilfosfina, tributilfosfina, tri(ter-butil)fosfina, triciclohexilfosfina, tri-o-tolilfosfina, trioctilfosfina, 9,9-dimetil-4,5-bis(difenilfosfino)xanteno, 2-(di-ter-butilfosfino)bifenilo, 2-(diciclohexilfosfino)bifenilo, 1,2-bis(difenilfosfino)etano, 1,3-bis(difenilfosfino)propano, 1,4-bis(difenilfosfino)butano, 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno, (R)-(+)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo, (S)-(-)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo y (±)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo. La cantidad de la fosfina terciaria usada se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de una cantidad molar de 0,5 a 10 veces respecto del catalizador de paladio.

[0261] La cantidad de te yoduro de cobre usado en esta reacción está usualmente en el intervalo de una cantidad molar de 0,01 a 0,5 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (2b-2).

[0262] Los ejemplos de la base que se pueden usar en esta reacción incluyen bases inorgánicas incluyendo carbonatos tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio e hidrógeno-carbonato de sodio; y bases orgánicas tales como trietilamina, piridina, N,N-dimetil-4-aminopiridina y DBU. La cantidad de la base usada se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (2b-2). En algunos casos, la base se puede usar como el solvente.

[0263] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente la reacción y los ejemplos incluyen alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol y 2-propanol; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, dioxano y 1,2-dimetoxietano (DME); hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; nitrilos tales como acetonitrilo; ésteres tales como acetato de etilo; solventes polares tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona; y agua. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (2b-2). En el caso en que la base se use también como el solvente, no es necesario usar otro solvente.

[0264] Como esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso.

La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares, pero se selecciona básicamente de ser apropiado del intervalo de algunos minutos a 48 horas. Esta reacción se puede llevar a cabo bajo la atmósfera de un gas inerte tales como gas nitrógeno y gas argón. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. La mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente reacción sin aislamiento del compuesto de interés.

[0265] Método de producción en la etapa [al]

El compuesto representado por la fórmula general (2f–1) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (80) con azida de sodio (81) en presencia de diacetoxi yodobenceno y un solvente inerte.

[0266] La cantidad de diacetoxi yodobenceno usado en esta reacción está usualmente en el intervalo de una cantidad molar aproximadamente 1 a 10 veces respecto del compuesto representado por la fórmula general (80).

[0267] El solvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier solvente que no inhiba marcadamente la reacción y los ejemplos incluyen alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol y 2–propanol; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, dioxano y 1,2–dimetoxietano (DME); hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; nitrilos tales como acetonitrilo; ésteres tales como acetato de etilo; solventes polares tales como N,N–

dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona; y agua. Uno de estos solventes inertes puede usarse solo y también dos o más de ellos se pueden usar como una mezcla. La cantidad del solvente inerte usado no está limitada en particular siempre que sea suficiente para disolver los reactivos de reacción y se selecciona usualmente de ser apropiado en el intervalo de 0,5 L a 100 L respecto de 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (80). En el caso en que la base se use también como el solvente, no es necesario usar otro solvente.

[0268] Como esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción está usualmente en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción, y similares, pero se selecciona básicamente de ser apropiado del intervalo de algunos minutos a 48 horas. Una vez completa la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla de posreacción por el método usual. De ser necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. La mezcla de posreacción se puede usar directamente en la siguiente reacción sin aislamiento del compuesto de interés.

[0269] Método de producción 14 para el compuesto de partida

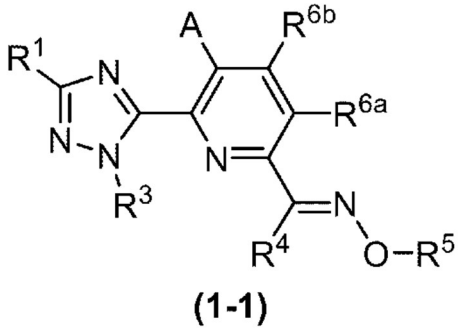
El compuesto Q-H representado por la fórmula general (6) en Método de producción 3 se puede producir por cualquiera de los métodos descritos más abajo o sus métodos modificados. El método de producción para Q1-H se describe, por ejemplo, en Organic Letters, 2015, 17, 2894-2897. El método de producción para Q2-H se describe, por ejemplo, en Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 2012, 22, 7036-7040. El método de producción para Q3-H se describe, por ejemplo, en Heterocycles, 1983, 20,

1243–1246. El método de producción para Q4–H se describe, por ejemplo, en Organic Process Research & Development, 2004, 8, 28–32. El método de producción para Q5–H se describe, por ejemplo, en Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 2021, 41, 127984. El método de producción para Q6–H se describe, por ejemplo, en la patente U.S. N.° 5449784. El método de producción para Q7–H se describe, por ejemplo, en Journal of the American Chemical Society, 2015, 137, 2738–2747. El método de producción para Q8–H se describe, por ejemplo, en la patente U.S. N.° 4282364. El método de producción para Q9–H se describe, por ejemplo, en Organic Letters, 2007, 9, 4009–4012. El método de producción para Q10–H se describe, por ejemplo, en Chem. Ber., 1960, 93, 1208–11. El método de producción para Q11–H se describe, por ejemplo, en Organic Letters, 2020, 22, 1396–1401. El método de producción para Q12–H se describe, por ejemplo, en Synlett, (1999), (10), 1642–1644. El método de producción para Q13–H se describe, por ejemplo, en Journal of the American Chemical Society, 1937, 59, 2262–2264. El método de producción para Q14–H se describe, por ejemplo, en Tetrahedron Letters, 1994, 35, 1585–1586. El método de producción para Q15–H se describe, por ejemplo, en Journal de Chemical and Pharmaceutical Research, 2012, 4, 1772–1781. El método de producción para Q16–H se describe, por ejemplo, en Journal of Medicinal Chemistry, 2016, 59, 8398–8411. El método de producción para Q17–H se describe, por ejemplo, en Chemistry–A European Journal, 2016, 22(3), 911–915. El método de producción para Q18–H se describe, por ejemplo, en Journal of Organic Chemistry, 1990, 55(3), 929–35.

[0270] Los ejemplos representativos del compuesto representado por la fórmula general (1) de la presente invención se muestran en las Tablas 1 a 21, pero la presente invención se limita a ellos. En las Tablas 1 a 21, algunas descripciones para R^1 pueden ser descripciones tanto para R^1 como un sustituyente del grupo Y en R^1.

Los ejemplos específicos del compuesto de la presente invención se muestran más abajo. En las siguientes tablas, Me representa un grupo metilo, grupo Et representa un grupo etilo, i-Pr representa un grupo isopropilo, n-Pr representa un grupo n-propilo, c-Pr representa un grupo ciclopropilo, i-Bu representa un grupo isobutilo, n-Br representa un grupo n-butilo, c-Bu representa un grupo ciclobutilo, t-Bu representa un grupo ter-butilo, c-Pen representa un grupo ciclopentilo, i-pen representa un grupo isopentilo, c-Hex representa un grupo ciclohexilo, Ac representa un grupo acetilo, Ph representa un grupo fenilo, Bn representa un grupo bencilo, Bz representa un grupo benzoilo e i-alilo representa un grupo isoalilo. Se muestra en la columna de "Valor de propiedad física" un punto de fusión (°C), un índice de refracción (n_D) o "^{1}H-RMN". El número entre paréntesis para el índice de refracción representa temperatura de medición (°C). Los datos de ^{1}H-RMN se muestran en la Tabla 22.

[0271] [Quím. 27]



(1-1)

[0272] Tabla 1 (En la Tabla 1, R^{6a} y R^{6b} representan átomos de hidrógeno.)

[Tabla 1-1]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
1-1	2-Cl-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-2	Ph	Me	NHAc	Et	CO_2Et	RMN

1-3	Ph	Me	$NHCOCF_3$	Et	CO_2Et	176-177
1-4	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-5	2-Cl-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2Me	197-198
1-6	Ph	Me	Me	Et	SO_2Me	202-203
1-7	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2Me	208-209
1-8	Ph	Me	NH_2	Et	CO_2Et	RMN
1-9	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	161-162
1-10	3-(piridin-3-il)-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	174-175
1-11	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NMe_2	113-114
1-12	2-Cl-Ph	Me	NAc_2	Et	$SO_2N(Ac)Me$	RMN
1-13	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NMe_2	160-161
1-14	3,5-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	199-200
1-15	3,5-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	155-156
1-16	3-CHF_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	193-194
1-17	3-CHF_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	158-159
1-18	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NMe_2	RMN
1-19	2-Cl-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NMe_2	122-123
1-20	2-Cl-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NMe_2	RMN
1-21	2-OMe-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
1-22	2-OMe-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-23	2,3-Cl_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	225-226
1-24	2,3-Cl_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	181-182
1-25	2,3-Cl_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	82-83
1-26	3-Cl-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	123-124
1-27	3-Cl-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	151-152
1-28	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	RMN

1-29	2-Cl-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	178-179
1-30	2-Cl-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	113-114

[0273]

[Tabla 1-2]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
1-31	2-Cl-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NMe_2	140-141
1-32	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NMe_2	RMN
1-33	2,4-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	196-197
1-34	2,4-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	156-157
1-35	2,5-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	190-191
1-36	2,5-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	155-156
1-37	2-Cl-6-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	154-155
1-38	2-Cl-6-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-39	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-40	4-Cl-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-41	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NMe_2	RMN
1-42	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NMe_2	RMN
1-43	3-Br-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	161-162
1-44	3-Br-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	171-172
1-45	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	138-139
1-46	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	153-154
1-47	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	143-144
1-48	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	223-224
1-49	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	199-200
1-50	3-Me-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	184-185
1-51	3-Me-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	126-127
1-52	3-Me-Ph	Me	NH_2	$C(Me)_2OMe$	SO_2NHMe	180-181
1-53	2-Me-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN

1-54	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-55	2,5-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-56	2,4-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-57	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-58	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-59	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-60	2,3-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	

[0274]

[Tabla 1-3]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
1-61	2,3-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-62	2,3-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-63	2,4,6-F_3-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-64	2,4,6-F_3-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-65	2,4,6-F_3-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-66	2-SMe-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-67	2-SMe-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-68	2-SMe-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-69	2-SOMe-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-70	2-SOMe-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-71	2-SOMe-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-72	2-SO_2Me-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-73	2-SO_2Me-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-74	2-SO_2Me-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-75	2-CN-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-76	2-CN-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-77	2-CN-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-78	2-$OCHF_2$-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-79	2-$OCHF_2$-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	

1-80	2-$OCHF_2$-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-81	2-c-Pr-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-82	2-c-Pr-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-83	2-c-Pr-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-84	2-CHF_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-85	2-CHF_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-86	2-CHF_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-87	2-NHAc-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-88	2-NHAc-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-89	2-NHAc-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-90	2-$P(OMe)_2$-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	

[0275]

[Tabla 1-4]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propie-dad física
1-91	2-$P(OMe)_2$-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-92	2-$P(OMe)_2$-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-93	Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(Ac)Me$	
1-94	Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(Ac)Me$	
1-95	Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(Ac)Me$	
1-96	Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-97	Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-98	Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-99	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(Ac)Me$	
1-100	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(Ac)Me$	
1-101	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(Ac)Me$	
1-102	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-103	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-104	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-105	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(Ac)Me$	

1-106	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(Ac)Me$	
1-107	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(Ac)Me$	
1-108	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-109	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-110	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-111	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(Ac)Me$	
1-112	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(Ac)Me$	
1-113	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(Ac)Me$	
1-114	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-115	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-116	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-117	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(Ac)Me$	
1-118	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(Ac)Me$	
1-119	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(Ac)Me$	
1-120	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(CO_2Me)Me$	

[0276]

[Tabla 1-5]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
1-121	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-122	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-123	2,5-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(Ac)Me$	
1-124	2,5-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(Ac)Me$	
1-125	2,5-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(Ac)Me$	
1-126	2,5-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-127	2,5-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-128	2,5-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-129	2,4-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(Ac)Me$	
1-130	2,4-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(Ac)Me$	
1-131	2,4-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(Ac)Me$	

1-132	2,4-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-133	2,4-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-134	2,4-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-135	2,3-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(Ac)Me$	
1-136	2,3-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(Ac)Me$	
1-137	2,3-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(Ac)Me$	
1-138	2,3-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-139	2,3-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-140	2,3-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
1-141	3-Ph-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	96-97
1-142	piridin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	199-200
1-143	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	211-212
1-144	c-Hex	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	162-163
1-145	c-Hex	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	177-178
1-146	c-Hex	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-147	c-Pen	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-148	c-Pen	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-149	c-Pen	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-150	c-Bu	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	

[0277]

[Tabla 1-6]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
1-151	c-Bu	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-152	c-Bu	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-153	c-Pr	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	156-157
1-154	c-Pr	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	164-165

1-155	c-Pr	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-156	3,4-dihidro-2H-piran-6-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-157	3,4-dihidro-2H-piran-6-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-158	3,4-dihidro-2H-piran-6-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-159	tetrahidropiran-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-160	tetrahidropiran-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-161	tetrahidropiran-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-162	1,3-dioxan-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-163	1,3-dioxan-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-164	1,3-dioxan-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-165	tetrahidropiran-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-166	tetrahidropiran-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-167	tetrahidropiran-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-168	tetrahidropiran-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-169	tetrahidropiran-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-170	tetrahidropiran-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-171	tetrahidrotiopiran-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-172	tetrahidrotiopiran	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	

	-4-ilo					
1-173	tetrahidrotiopiran-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-174	1-Ac-piperidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-175	1-Ac-piperidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-176	1-Ac-piperidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-177	piperidin-1-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-178	piperidin-1-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-179	piperidin-1-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-180	1,3-dioxolan-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	

[0278]

[Tabla 1-7]

Compuesto N.º	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
1-181	1,3-dioxolan-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-182	1,3-dioxolan-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-183	1,3-dioxepan-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-184	1,3-dioxepan-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-185	1,3-dioxepan-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-186	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	241-242

1-187	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-188	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
1-189	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-190	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-191	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-192	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	86-89
1-193	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-194	1,2,3-tiadiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-195	1,2,3-tiadiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-196	1,2,3-tiadiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-197	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	181-182
1-198	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	129-130
1-199	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-200	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
1-201	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-202	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-203	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-204	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-205	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0279]

[Tabla 1-8]

Compuesto	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de pro

N.°						pie-dad física
1-206	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
1-207	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-208	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-209	piridin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	168-169
1-210	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(Boc)Me$	187-188
1-211	3-CF_3-piridin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
1-212	3-CF_3-piridin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-213	CH_2SMe	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
1-214	CH_2SMe	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-215	CH_2SO_2Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
1-216	CH_2SOMe	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-217	CH_2SO_2Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-218	i-pen	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
1-219	i-Pr	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
1-220	i-Pr	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN

1-221	CH_2CH_2OMe	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
1-222	CH_2CH_2OMe	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-223	CH_2OMe	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-224	CH_2OMe	Me	NH_2	iPr	SO_2NHMe	RMN
1-225	furan-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	216-217
1-226	furan-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	153-154
1-227	5-Me-piridin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-228	5-Me-piridin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
1-229	piridin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
1-230	quinolin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	83-88
1-231	2,6-F_2-Ph	Me	Me	Et	SO_2NHMe	164-165
1-232	2,6-F_2-Ph	Me	Me	Me	SO_2NHMe	189-190
1-233	5-Cl-tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	187-188
1-234	5-Cl-tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-235	5-Cl-piridin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	226-230

[0280]

[Tabla 1-9]

Compuesto	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor

N.°						de propiedad física
1-236	n-Pr	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
1-237	n-Pr	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-238	n-Pr	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-239	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-240	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-241	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-242	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-243	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-244	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-245	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-246	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-247	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-248	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
1-249	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-250	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-251	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-252	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-253	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-254	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-255	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-256	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-257	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-258	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-259	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-260	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-261	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-262	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-263	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-264	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	

1-265	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0281]

[Tabla 1-10]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
1-266	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-267	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-268	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-269	Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
1-270	Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-271	Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-272	2-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-273	2-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-274	2-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-275	3-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-276	3-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-277	3-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-278	4-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-279	4-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-280	4-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-281	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-282	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-283	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-284	n-Bu	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
1-285	n-Bu	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-286	n-Bu	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-287	5-Cl-tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
1-288	4-Me-tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
1-289	4-Me-tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
1-290	4-Me-tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	RMN

1-291	i-Pr	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	103-104
1-292	i-Pr	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	95-96
1-293	i-Bu	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	148-149
1-294	i-Bu	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	101-102
1-295	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	211-212

[0282]

[Tabla 1-11]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
1-296	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	185-186
1-297	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	CO_2t-Bu	
1-298	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	CO_2t-Bu	
1-299	i-Pr	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	RMN
1-300	BnO	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-301	CF_3CH_2O	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-302	CF_3CH_2O	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-303	CF_3CH_2O	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-304	CHF_2CH_2O	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-305	CHF_2CH_2O	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-306	CHF_2CH_2O	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-307	MeO	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-308	BuO	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
1-309	BuO	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-310	BuO	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
1-311	PhO	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-312	2-Cl-PhO	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-313	2-OMe-PhO	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-314	piridin-2-ilo	CF_3CH_2	NH_2	Et	SO_2NHMe	
1-315	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
1-316	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	

1-317	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
1-318	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
1-319	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
1-320	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
1-321	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
1-322	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
1-323	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
1-324	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
1-325	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
1-326	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

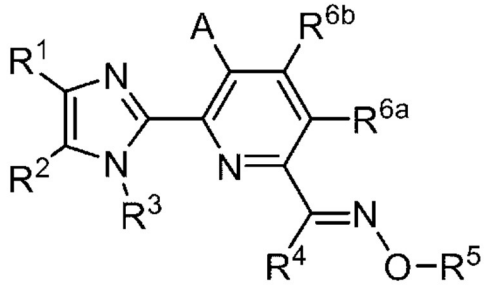
[0283]

[Tabla 1-12]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
1-327	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
1-328	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
1-329	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
1-330	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
1-331	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
1-332	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
1-333	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
1-334	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
1-335	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
1-336	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
1-337	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
1-338	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
1-339	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
1-340	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
1-341	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
1-342	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

1-343	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
1-344	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
1-345	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
1-346	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
1-347	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
1-348	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
1-349	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
1-350	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
1-351	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
1-352	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
1-353	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
1-354	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
1-355	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
1-356	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
1-357	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
1-358	t-Bu	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
1-359	t-Bu	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN

[0284] [Quím. 28]



(1-2)

[0285] Tabla 2 (En la Tabla 2, R^{6a} y R^{6b} representan átomos de hidrógeno.)

[Tabla 2-1]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física

2-1	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	120-121
2-2	2-Cl-Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	117-118
2-3	2-Me-Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	115-116
2-4	3-Me-Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	RMN
2-5	4-Me-Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	77-78
2-6	2-CF_3-Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	RMN
2-7	3-CF_3-Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	124-125
2-8	4-CF_3-Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	RMN
2-9	2-OMe-Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	107-108
2-10	3-OMe-Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	51-52
2-11	4-OMe-Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	132-133
2-12	2-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	117-118
2-13	3-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	59-60
2-14	4-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	70-71
2-15	2-Cl-Ph	H	Me	Me	Et	SO_2CH_2Ac	RMN
2-16	2-Cl-Ph	H	Me	Me	Et	OMe	154-155
2-17	2-Cl-Ph	H	Me	Me	Et	OEt	RMN
2-18	2-Cl-Ph	Cl	Me	Me	Et	SO_2Me	143-144
2-19	Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	62-63
2-20	Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2H	220-221
2-21	Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Me	146-147
2-22	Ph	H	Me	NH_2	CH_2CF_3	CO_2Me	RMN
2-23	Ph	Br	Me	NH_2	Et	CO_2Me	113-114
2-24	Ph	Cl	Me	NH_2	Et	CO_2Me	101-102
2-25	3-CF_3-Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Me	56-58
2-26	2,3-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	134-135
2-27	2,4-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	100-101
2-28	2,5-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	122-123
2-29	2-CN-Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	103-104
2-30	2,4,6-F_3-Ph	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	

[0286]

[Tabla 2-2]

Compues	R^1	R	R^3	R^4	R^5	A	Valor

to N.°		^{2}					de pro pie- dad física
2-31	2-Cl-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2Me	116-117
2-32	2-Cl-Ph	H	Me	Me	Et	SO_2Me	RMN
2-33	Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	237-238
2-34	piridin-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	57-58
2-35	1-Me-pirazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	122-123
2-36	c-Pr	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	107-108
2-37	3,4-dihidro-2H-piran-6-ilo	H	Me	NH_2	Et	CO_2Et	RMN
2-38	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	CO_2Me	52-53

[0287]

[Tabla 2-3]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de pro pie- dad física
2-39	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-40	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-41	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-42	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-43	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-44	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

2-45	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-46	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-47	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-48	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-49	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-50	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-51	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-52	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-53	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-54	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-55	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-56	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-57	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-58	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-59	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-60	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-61	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-62	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-63	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-64	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-65	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-66	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-67	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-68	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0288]

[Tabla 2-4]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
2-69	tiazol-5-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-70	tiazol-5-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	

2-71	tiazol-5-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-72	tiazol-4-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-73	tiazol-4-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-74	tiazol-4-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-75	tiazol-2-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-76	tiazol-2-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-77	tiazol-2-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-78	tiofen-2-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-79	tiofen-2-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-80	tiofen-2-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-81	tiofen-3-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-82	tiofen-3-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-83	tiofen-3-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-84	piridazin-3-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-85	piridazin-3-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-86	piridazin-3-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-87	pirazin-2-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-88	pirazin-2-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-89	pirazin-2-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-90	pirimidin-2-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-91	pirimidin-2-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-92	pirimidin-2-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-93	pirimidin-4-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-94	pirimidin-4-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-95	pirimidin-4-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-96	pirimidin-5-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-97	pirimidin-5-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-98	pirimidin-5-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0289]

[Tabla 2-5]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de pro pie-

							dad física
2-99	Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-100	Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-101	Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-102	2-F-Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-103	2-F-Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-104	2-F-Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-105	3-F-Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-106	3-F-Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-107	3-F-Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-108	4-F-Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-109	4-F-Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-110	4-F-Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-111	2,6-F_2-Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-112	2,6-F_2-Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-113	2,6-F_2-Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-114	c-Pr	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-115	c-Pr	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-116	c-Pr	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-117	c-Pr	Cl	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
2-118	c-Pr	Cl	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
2-119	c-Pr	Cl	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
2-120	Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
2-121	Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
2-122	Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
2-123	2-F-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
2-124	2-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
2-125	2-F-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
2-126	3-F-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
2-127	3-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
2-128	3-F-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

[0290]

[Tabla 2-6]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
2-129	4-F-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
2-130	4-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
2-131	4-F-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
2-132	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
2-133	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
2-134	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
2-135	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
2-136	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
2-137	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
2-138	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
2-139	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
2-140	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
2-141	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
2-142	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
2-143	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
2-144	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
2-145	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
2-146	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
2-147	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
2-148	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
2-149	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
2-150	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
2-151	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
2-152	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
2-153	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
2-154	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
2-155	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

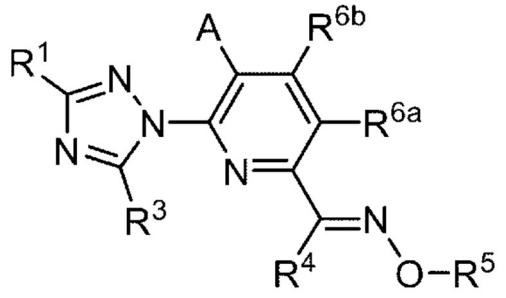
2-156	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
2-157	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
2-158	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

[0291]

[Tabla 2-7]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
2-159	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
2-160	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
2-161	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
2-162	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
2-163	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
2-164	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

[0292] [Quím. 29]



(1-3)

[0293] Tabla 3 (En la Tabla 3, R^{6a} y R^{6b} representan átomos de hidrógeno.)

[Tabla 3-1]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
3-1	2,3-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN

3-2	2-Cl-3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	194-195
3-3	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-4	2-Cl-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-5	2-Br-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	175-176
3-6	2-Cl-4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-7	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	202-203
3-8	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
3-9	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2Me	RMN
3-10	2-NHAc-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	196-197
3-11	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	144-145
3-12	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-13	2-Cl-6-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-14	2,4,6-F_3-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-15	2,4-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	136-137
3-16	2-NO_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	187-188
3-17	2-Cl-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
3-18	2-OMe-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-19	2-CN-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	237
3-20	3-Cl-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	164-165
3-21	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	202-203
3-22	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-23	2-Cl-6-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-24	2-Cl-6-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-25	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-26	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-27	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-28	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-29	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-30	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	

[0294]

[Tabla 3-2]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de pro

						pie-dad física
3-31	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-32	2,5-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-33	2,5-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-34	2,5-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-35	2,4-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-36	2,4-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-37	2,3-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-38	2,3-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-39	2,4,6-F_3-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-40	2,4,6-F_3-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-41	2-SMe-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-42	2-SMe-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-43	2-SMe-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-44	2-SOMe-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-45	2-SOMe-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-46	2-SOMe-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-47	2-SO_2Me-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-48	2-SO_2Me-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-49	2-SO_2Me-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-50	2-CN-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-51	2-CN-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-52	2-$OCHF_2$-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-53	2-$OCHF_2$-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-54	2-$OCHF_2$-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-55	2-c-Pr-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-56	2-c-Pr-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-57	2-c-Pr-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-58	2-CHF_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-59	2-CHF_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-60	2-CHF_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0295]

[Tabla 3-3]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
3-61	2-NHAc-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-62	2-NHAc-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-63	2-$P(OMe)_2$-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-64	2-$P(OMe)_2$-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-65	2-$P(OMe)_2$-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-66	Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(Ac)Me$	
3-67	Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(Ac)Me$	
3-68	Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(Ac)Me$	
3-69	Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-70	Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-71	Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-72	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(Ac)Me$	
3-73	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(Ac)Me$	
3-74	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(Ac)Me$	
3-75	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-76	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-77	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-78	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(Ac)Me$	
3-79	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(Ac)Me$	
3-80	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(Ac)Me$	
3-81	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-82	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-83	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-84	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(Ac)Me$	
3-85	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(Ac)Me$	
3-86	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(Ac)Me$	

3-87	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-88	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-89	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-90	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(Ac)Me$	

[0296]

[Tabla 3-4]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
3-91	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(Ac)Me$	
3-92	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(Ac)Me$	
3-93	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-94	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-95	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-96	2,5-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(Ac)Me$	
3-97	2,5-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(Ac)Me$	
3-98	2,5-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(Ac)Me$	
3-99	2,5-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-100	2,5-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-101	2,5-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-102	2,4-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(Ac)Me$	
3-103	2,4-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(Ac)Me$	
3-104	2,4-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(Ac)Me$	
3-105	2,4-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-106	2,4-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-107	2,4-F_2-Ph	Me	NH_2	i-	$SO_2N(CO_2Me)Me$	

				Pr		
3-108	2,3-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(Ac)Me$	
3-109	2,3-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(Ac)Me$	
3-110	2,3-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(Ac)Me$	
3-111	2,3-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-112	2,3-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-113	2,3-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	$SO_2N(CO_2Me)Me$	
3-114	c-Hex	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-115	piridin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
3-116	3-Cl-piridin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	193-194
3-117	3-Cl-piridin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	188-189
3-118	3-Cl-piridin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	RMN
3-119	2-Cl-piridin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	212-213
3-120	2-Cl-piridin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	221-222

[0297]

[Tabla 3-5]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
3-121	piridin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	127-128
3-122	piridin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-123	piridin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-124	3-Cl-piridin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN

3-125	3-Cl-piridin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
3-126	c-Hex	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	185-186
3-127	c-Hex	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	RMN
3-128	c-Pen	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-129	c-Pen	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-130	c-Pen	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	RMN
3-131	c-Bu	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-132	c-Bu	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-133	c-Bu	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-134	c-Pr	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-135	c-Pr	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-136	c-Pr	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-137	3,4-dihidro-2H-piran-6-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-138	3,4-dihidro-2H-piran-6-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-139	3,4-dihidro-2H-piran-6-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-140	tetrahidropiran-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-141	tetrahidropiran-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-142	tetrahidropiran-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-143	1,3-dioxan-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-144	1,3-dioxan-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-145	1,3-dioxan-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

3-146	tetrahidropiran-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-147	tetrahidropiran-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-148	tetrahidropiran-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-149	tetrahidropiran-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-150	tetrahidropiran-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-151	tetrahidropiran-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	RMN
3-152	tetrahidrotiopiran-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-153	tetrahidrotiopiran-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	

[0298]

[Tabla 3-6]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
3-154	tetrahidrotiopiran-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-155	1-Ac-piperidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-156	1-Ac-piperidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-157	1-Ac-piperidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-158	piperidin-1-ilo	M	NH	Me	SO_2NHM	

		e	$_2$		e	
3-159	piperidin-1-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-160	piperidin-1-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-161	1,3-dioxolan-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-162	1,3-dioxolan-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-163	1,3-dioxolan-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-164	1,3-dioxepan-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-165	1,3-dioxepan-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-166	1,3-dioxepan-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-167	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-168	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-169	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-170	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-171	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-172	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-173	1,2,3-tiadiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-174	1,2,3-tiadiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN

3-175	1,2,3-tiadiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-176	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
3-177	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-178	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-179	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
3-180	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-181	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-182	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-183	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-184	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-185	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-186	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0299]

[Tabla 3-7]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
3-187	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	

3-188	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-189	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-190	n-Pr	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-191	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2Me	RMN
3-192	3-Me-tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-193	3-Cl-tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-194	4-OMe-tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-195	3,5-Cl_2-tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
3-196	3-Cl-5-Br-tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
3-197	3-F-tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-198	n-Bu	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	108-109
3-199	Me	n-Bu	NH_2	Et	SO_2NHMe	110-111
3-200	i-alilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	129-130
3-201	3-Cl-tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
3-202	n-Pr	Me	NH_2	Et	SO_2NMe_2	148-149
3-203	i-Bu	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	125-126
3-204	i-Pen	Me	NH	Et	SO_2NHM	RMN

			NH_2		e	
3-205	c-Pr	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	136-137
3-206	Me	i-alil	NH_2	Et	SO_2NHMe	191-192
3-207	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-208	n-propilsulfanilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	111-112
3-209	etilsulfanilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	99-100
3-210	n-propilsulfonilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	129-130
3-211	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-212	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-213	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-214	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-215	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-216	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0300]

[Tabla 3-8]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
3-217	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	

3-218	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-219	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-220	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-221	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-222	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-223	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-224	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-225	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-226	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-227	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-228	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-229	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
3-230	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-231	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-232	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-233	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-234	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-235	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-236	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-237	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-238	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-239	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-240	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-241	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-242	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-243	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-244	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-245	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-246	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0301]

[Tabla 3-9]

Compuesto	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de pro

N.°						pie-dad física
3-247	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-248	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-249	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-250	Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
3-251	Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-252	Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-253	2-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-254	2-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-255	2-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-256	3-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-257	3-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-258	3-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-259	4-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-260	4-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-261	4-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

3-262	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-263	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-264	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
3-265	3-Me-isotiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-266	etilsulfonilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	146-147
3-267	3-Br-tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-268	3-F-5-Cl-tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-269	3-F-5-Br-tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-270	4-Me-tiadiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-271	5-Me-1,2,3-tiadiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-272	furan-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-273	isotiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-274	furan-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-275	I	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-276	vinilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	

[0302]

[Tabla 3-10]

Compuesto	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor

N.°						de propiedad física
3-277	Et	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-278	Et	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	125-126
3-279	1-Me-pirazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-280	OEt	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-281	NHEt	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-282	Ph	OMe	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-283	Ph	OMe	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-284	Ph	OMe	NH_2	Et	SO_2Me	
3-285	Ph	OH	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-286	Ph	OH	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
3-287	Ph	OH	NH_2	Et	SO_2Me	259-260
3-288	Ph	SMe	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-289	Ph	SMe	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-290	Ph	SMe	NH_2	Et	SO_2Me	
3-291	Ph	SOMe	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-292	Ph	SOMe	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-293	Ph	SOMe	NH_2	Et	SO_2Me	
3-294	Ph	SO_2Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-295	Ph	SO_2Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-296	Ph	SO_2Me	NH_2	Et	SO_2Me	
3-297	Ph	vinil	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-298	Ph	vinil	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-299	Ph	vinil	NH_2	Et	SO_2Me	
3-300	Ph	NHMe	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-301	Ph	NHMe	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-302	Ph	NHMe	NH_2	Et	SO_2Me	
3-303	Ph	CF_3	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-304	Ph	CF_3	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-305	Ph	CHF_2	NH_2	Me	SO_2NHMe	

3-306	Ph	CHF_2	NH_2	Et	SO_2NHMe	

[0303]

[Tabla 3-11]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
3-307	tiofen-2-ilo	OMe	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-308	tiofen-2-ilo	OMe	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-309	tiofen-2-ilo	OMe	NH_2	Et	SO_2Me	
3-310	tiofen-2-ilo	OH	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-311	tiofen-2-ilo	OH	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-312	tiofen-2-ilo	OH	NH_2	Et	SO_2Me	
3-313	tiofen-2-ilo	SMe	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-314	tiofen-2-ilo	SMe	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-315	tiofen-2-ilo	SMe	NH_2	Et	SO_2Me	106-107
3-316	tiofen-2-ilo	SOMe	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-317	tiofen-2-ilo	SOMe	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-318	tiofen-2-ilo	SOMe	NH_2	Et	SO_2Me	RMN
3-319	tiofen-2-ilo	SO_2Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-320	tiofen-2-ilo	SO_2Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-321	tiofen-2-ilo	SO_2Me	NH_2	Et	SO_2Me	RMN
3-322	tiofen-2-ilo	vinil	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-323	tiofen-2-ilo	vinil	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-324	tiofen-2-ilo	vinil	NH_2	Et	SO_2Me	RMN
3-325	tiofen-2-ilo	NHMe	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-326	tiofen-2-ilo	NHMe	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-327	tiofen-2-ilo	NHMe	NH_2	Et	SO_2Me	
3-328	tiofen-2-ilo	CF_3	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-329	tiofen-2-ilo	CF_3	NH_2	Et	SO_2NHMe	
3-330	tiofen-2-ilo	CHF_2	NH_2	Me	SO_2NHMe	
3-331	tiofen-2-ilo	CHF_2	NH_2	Et	SO_2NHMe	

3-332	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
3-333	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
3-334	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
3-335	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
3-336	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	

[0304]

[Tabla 3-12]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
3-337	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
3-338	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
3-339	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
3-340	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
3-341	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
3-342	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
3-343	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
3-344	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
3-345	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
3-346	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
3-347	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
3-348	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
3-349	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
3-350	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
3-351	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
3-352	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
3-353	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
3-354	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
3-355	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
3-356	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
3-357	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	

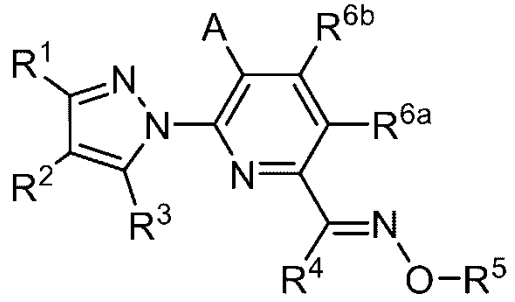
3-358	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
3-359	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
3-360	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
3-361	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
3-362	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
3-363	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
3-364	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
3-365	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
3-366	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	

[0305]

[Tabla 3-13]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
3-367	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
3-368	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
3-369	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
3-370	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
3-371	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
3-372	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
3-373	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
3-374	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
3-375	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
3-376	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
3-377	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2Me	RMN
3-378	tiofen-2-ilo	CHF_2	NH_2	Et	SO_2Me	RMN
3-379	tiofen-2-ilo	CF_3	NH_2	Et	SO_2Me	RMN

[0306] [Quím. 30]



(1-4)

[0307] Tabla 4 (En la Tabla 4, R^{6a} y R^{6b} representan átomos de hidrógeno.)

[Tabla 4-1]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
4-1	Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2Me	RMN
4-2	2-Cl-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2Me	RMN
4-3	4-CN-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	170-171
4-4	4-(imidazol-1-il)-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	217-218
4-5	2-Cl-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-6	Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-7	2,4-Cl_2-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-8	4-OMe-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-9	2-Br-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	153-155

4-10	2-CN-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
4-11	4-Cl-Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-12	Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	206-207
4-13	2-Cl-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	181-182
4-14	4-Cl-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-15	2-Me-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-16	3-Cl-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-17	2-Cl-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NMe_2	100-101
4-18	Ph	H	OEt	NH_2	Et	SO_2Me	RMN
4-19	Ph	H	OMe	NH_2	Et	SO_2Me	RMN
4-20	Ph	H	OH	NH_2	Et	SO_2Me	RMN
4-21	2-Cl-Ph	H	OH	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-22	Ph	H	OH	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-23	4-Cl-Ph	H	SMe	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-24	4-Cl-Ph	H	SOMe	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-25	4-Cl-Ph	H	SO_2Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-26	2-F-Ph	H	OH	NH	Et	SO_2NHM	RMN

				NH_2		e	
4-27	2-F-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-28	2-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-29	2-F-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-30	3-F-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	

[0308]

[Tabla 4-2]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
4-31	3-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-32	3-F-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-33	4-F-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-34	4-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-35	4-F-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-36	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-37	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-38	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-39	2,5-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-40	2,5-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-41	2,5-F_2-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-42	2,4-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-43	2,4-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-44	2,4-F_2-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-45	2,3-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-46	2,3-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-47	2,3-F_2-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

4-48	2,3-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-49	2,3-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-50	2,3-F_2-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-51	2-SMe-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-52	2-SMe-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-53	2-SMe-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-54	2-SOMe-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-55	2-SOMe-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-56	2-SOMe-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-57	2-SO_2Me-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-58	2-SO_2Me-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-59	2-SO_2Me-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-60	2-CN-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	

[0309]

[Tabla 4-3]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
4-61	2-CN-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-62	2-$OCHF_2$-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-63	2-$OCHF_2$-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-64	2-$OCHF_2$-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-65	2-c-Pr-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-66	2-c-Pr-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-67	2-c-Pr-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-68	2-CHF_2-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-69	2-CHF_2-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-70	2-CHF_2-Ph	H	Me	NH_2	i-	SO_2NHMe	

					Pr		
4-71	2-NHAc-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-72	2-NHAc-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-73	2-NHAc-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-74	2-P(OMe)$_2$-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-75	2-P(OMe)$_2$-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-76	2-P(OMe)$_2$-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-77	piridin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-78	3-Cl-piridin-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	153-154
4-79	3-Cl-piridin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	136-137
4-80	c-Hex	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-81	c-Hex	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-82	c-Hex	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-83	c-Pen	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-84	c-Pen	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-85	c-Pen	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-86	c-Bu	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-87	c-Bu	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-88	c-Bu	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-89	c-Pr	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-90	c-Pr	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	

[0310]

[Tabla 4-4]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propie-

							dad física
4-91	c-Pr	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-92	3,4-dihidro-2H-piran-6-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-93	3,4-dihidro-2H-piran-6-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-94	3,4-dihidro-2H-piran-6-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-95	tetrahidropiran-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-96	tetrahidropiran-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-97	tetrahidropiran-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-98	1,3-dioxan-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-99	1,3-dioxan-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-100	1,3-dioxan-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-101	tetrahidropiran-3-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-102	tetrahidropiran-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-103	tetrahidropiran-3-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-104	tetrahidropiran-4-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-105	tetrahidropiran-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-106	tetrahidropiran-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-107	tetrahidrotiopiran-	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	

	4-ilo						
4-108	tetrahidrotiopiran-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-109	tetrahidrotiopiran-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-110	1-Ac-piperidin-4-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-111	1-Ac-piperidin-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-112	1-Ac-piperidin-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-113	piperidin-1-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-114	piperidin-1-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-115	piperidin-1-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	RMN
4-116	1,3-dioxolan-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-117	1,3-dioxolan-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-118	1,3-dioxolan-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-119	1,3-dioxepan-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-120	1,3-dioxepan-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	

[0311]

[Tabla 4-5]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
4-121	1,3-dioxepan-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-122	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-123	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-124	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	i-	SO_2NHMe	

					Pr		
4-125	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-126	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-127	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-128	1,2,3-tiadiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-129	1,2,3-tiadiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-130	1,2,3-tiadiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-131	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	194-195
4-132	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	179-180
4-133	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-134	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	194-195
4-135	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-136	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-137	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-138	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-139	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-140	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-141	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-142	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-143	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-144	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-145	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	i-	SO_2NHMe	

					Pr		

[0312]

[Tabla 4-6]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
4-146	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-147	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-148	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-149	Ac	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-150	CO_2Et	H	Me	NH_2	Et	SO_2Me	RMN
4-151	I	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	RMN
4-152	I	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
4-153	CO_2Et	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	RMN
4-154	CO_2H	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	73-74
4-155	4-NMe_2-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-156	1,3-benzodioxol-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-157	2-F-4-Cl-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN

4-158	2-fluoro-piridin-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-159	3-CN-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-160	6-Cl-piridin-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-161	quinolin-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-162	benzotiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-163	4-CO_2Me-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-164	2,2-difluoro-1,3-benzodioxol-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-165	Me	Me	CO_2Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-166	OMe	H	CO_2Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-167	4-CN-Ph	Et	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-168	2-oxopirrolidin-1-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-169	2-oxopirrolidin-1-ilo	Cl	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-170	4-Cl-Ph	Et	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-171	Me	I	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-172	4-Cl-Ph	Cl	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-173	4-Cl-Ph	$(-CH_2)_4$		NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-174	4-Cl-Ph	i-	Me	NH	Et	SO_2NHMe	RMN

		Pr		2			
4-175	4-c-Hex-Ph	H	Me	NH 2	Et	SO_2NHMe	RMN

[0313]

[Tabla 4-7]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
4-176	4-Cl-Ph	H	CF_3	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-177	4-CN-Ph	Br	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-178	4-Cl-Ph	Br	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-179	4-SMe-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-180	2-Me-1,3-dioxolan-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-181	2-Me-1,3-dioxan-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-182	3-Me-tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-183	2-Me-pirazol-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-184	4-CF_3-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-185	2-OMe-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-186	3,5-OMe_2-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-187	3-OMe-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-188	2,4-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-189	Me	Br	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	86-87
4-190	piridin-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	36-41
4-191	CO_2H	H	Me	NH_2	Et	SO_2Me	202-203
4-192	tiazol-5-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-193	tiazol-5-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-194	tiazol-5-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-195	tiazol-4-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-196	tiazol-4-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-197	tiazol-4-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-198	tiazol-2-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	

4-199	tiazol-2-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-200	tiazol-2-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-201	tiofen-2-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-202	tiofen-2-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-203	tiofen-2-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-204	tiofen-3-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-205	tiofen-3-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	

[0314]

[Tabla 4-8]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
4-206	tiofen-3-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-207	piridazin-3-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-208	piridazin-3-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-209	piridazin-3-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-210	pirazin-2-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-211	pirazin-2-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-212	pirazin-2-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-213	pirimidin-2-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-214	pirimidin-2-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-215	pirimidin-	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

	2-ilo						
4-216	pirimidin-4-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-217	pirimoidin-4-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-218	pirimidin-4-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-219	pirimidin-5-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-220	pirimidin-5-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-221	pirimidin-5-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-222	Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-223	Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-224	Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-225	2-F-Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-226	2-F-Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-227	2-F-Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-228	3-F-Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-229	3-F-Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-230	3-F-Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-231	4-F-Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-232	4-F-Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-233	4-F-Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-234	2,6-F_2-Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-235	2,6-F_2-Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	

[0315]

[Tabla 4-9]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad

							física
4-236	2,6-F_2-Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
4-237	vinilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-238	Et	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-239	2-oxopiridin-1-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-240	furan-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	118-119
4-241	ciclopenten-1-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	170-171
4-242	(E)-prop-1-enilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	113-114
4-243	pirazol-1-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-244	2-Cl-etil carbamato	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-245	2-oxo-1,3-oxazolidin-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-246	NH_2	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	59-61
4-247	benzhidrilidenamino	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-248	Me	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	110-111
4-249	Et	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-250	n-Pr	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	97-98
4-251	4-OCF_3-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-252	i-Pr	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-253	isopropenilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
4-254	Et	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	109-110
4-255	vinil	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-256	i-Pr	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-257	n-Pr	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
4-258	Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	

4-259	Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
4-260	Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
4-261	2-F-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
4-262	2-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
4-263	2-F-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
4-264	3-F-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
4-265	3-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	

[0316]

[Tabla 4-10]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
4-266	3-F-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
4-267	4-F-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
4-268	4-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
4-269	4-F-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
4-270	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
4-271	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
4-272	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
4-273	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
4-274	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
4-275	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
4-276	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
4-277	tiazol-4-	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	

	ilo						
4-278	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
4-279	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
4-280	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
4-281	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
4-282	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	211-212
4-283	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	185-186
4-284	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
4-285	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
4-286	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
4-287	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
4-288	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
4-289	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
4-290	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
4-291	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
4-292	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
4-293	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

4-294	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
4-295	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	

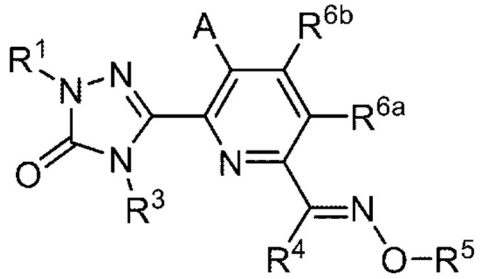
[0317]

[Tabla 4-11]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
4-296	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
4-297	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
4-298	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
4-299	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
4-300	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
4-301	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
4-302	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
4-303	Et	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	RMN
4-304	OEt	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-305	OCH_2CH_2OMe	H	M	NH	Et	SO_2NH	RMN

			e	$_2$		Me	
4-306	(tetrahidro-3-furanil)metoxi	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-307	(tetrahidro-2-furanil)metoxi	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-308	OCH_2c-Pr	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-309	OCH_2CHF_2	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
4-310	4-NO_2-PhO	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN

[0318] [Quím. 31]



(1-5)

[0319] Tabla 5 (En la Tabla 5, R^{6a} y R^{6b} representan átomos de hidrógeno.)

[Tabla 5-1]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
5-1	Ph	Me	NH_2	Et	$CONMe_2$	RMN
5-2	Ph	Me	NH_2	Et	CO_2H	227-228
5-3	Ph	Me	NH_2	Et	CO_2Et	1,4692(20,1)
5-4	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-5	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-6	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-7	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	

5-8	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-9	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-10	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-11	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-12	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-13	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-14	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-15	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-16	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-17	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-18	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-19	2-NO_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
5-20	2-NH_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	135-136
5-21	2-Cl-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	160-161

[0320]

[Tabla 5-2]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
5-22	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-23	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-24	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-25	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-26	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-27	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-28	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-29	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-30	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-31	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-32	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-33	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

5-34	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-35	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-36	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-37	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-38	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-39	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-40	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-41	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-42	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-43	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-44	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-45	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-46	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-47	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-48	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-49	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-50	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-51	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0321]

[Tabla 5-3]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
5-52	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-53	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-54	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-55	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-56	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-57	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-58	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-59	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	

5-60	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-61	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-62	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-63	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-64	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-65	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-66	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-67	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-68	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-69	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-70	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-71	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-72	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-73	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-74	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-75	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-76	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-77	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-78	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-79	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-80	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-81	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0322]

[Tabla 5-4]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
5-82	Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-83	Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-84	Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-85	2-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	

5-86	2-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-87	2-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-88	3-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-89	3-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-90	3-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-91	4-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-92	4-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-93	4-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-94	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-95	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-96	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-97	2,4-Cl_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-98	2,4-Cl_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-99	2,4-Cl_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-100	2,5-Cl_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-101	2,5-Cl_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-102	2,5-Cl_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-103	2,6-Cl_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
5-104	2,6-Cl_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-105	2,6-Cl_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
5-106	c-Hex	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-107	n-Bu	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-108	t-Bu	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
5-109	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
5-110	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
5-111	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

[0323]

[Tabla 5-5]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física

5-112	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
5-113	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
5-114	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
5-115	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
5-116	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
5-117	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
5-118	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
5-119	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
5-120	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
5-121	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
5-122	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
5-123	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
5-124	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
5-125	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
5-126	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
5-127	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
5-128	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
5-129	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
5-130	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
5-131	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
5-132	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
5-133	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
5-134	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
5-135	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
5-136	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
5-137	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
5-138	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
5-139	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
5-140	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
5-141	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

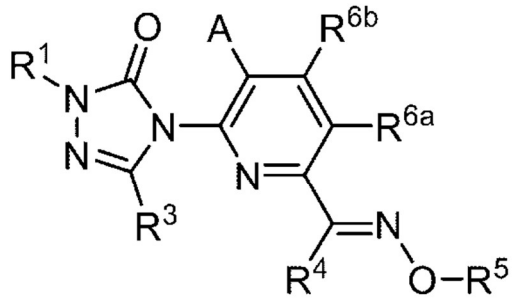
[0324]

[Tabla 5-6]

Compuesto	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor

N.°						de propiedad física
5-142	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
5-143	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
5-144	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
5-145	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
5-146	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
5-147	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
5-148	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
5-149	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
5-150	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
5-151	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
5-152	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
5-153	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

[0325] [Quím. 32]



(1-6)

[0326] Tabla 6 (En la Tabla 6, R^{6a} y R^{6b} representan átomos de hidrógeno.)

[Tabla 6-1]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
6-1	Ph	Me	Me	Et	SO_2Me	RMN

6-2	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-3	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-4	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-5	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-6	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-7	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-8	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-9	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-10	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-11	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-12	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-13	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-14	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-15	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-16	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0327]

[Tabla 6-2]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
6-17	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-18	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-19	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-20	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-21	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-22	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-23	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-24	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-25	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-26	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-27	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	

6-28	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-29	tiofen-3-il	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-30	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-31	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-32	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-33	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-34	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-35	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-36	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-37	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-38	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-39	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-40	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-41	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-42	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-43	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-44	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-45	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-46	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0328]

[Tabla 6-3]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
6-47	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-48	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-49	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-50	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-51	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-52	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-53	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	

6-54	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-55	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-56	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-57	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-58	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-59	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-60	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-61	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-62	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-63	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-64	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-65	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-66	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-67	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-68	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-69	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-70	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-71	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-72	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-73	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-74	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-75	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-76	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0329]

[Tabla 6-4]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
6-77	Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-78	Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-79	Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

6-80	2-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-81	2-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-82	2-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-83	3-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-84	3-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-85	3-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-86	4-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-87	4-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-88	4-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-89	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
6-90	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
6-91	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
6-92	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
6-93	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
6-94	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
6-95	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
6-96	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
6-97	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
6-98	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
6-99	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
6-100	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
6-101	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
6-102	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
6-103	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
6-104	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
6-105	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
6-106	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

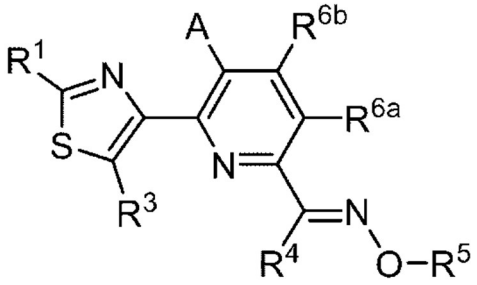
[0330]

[Tabla 6-5]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad

						física
6-107	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
6-108	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
6-109	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
6-110	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
6-111	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
6-112	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
6-113	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
6-114	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
6-115	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
6-116	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
6-117	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
6-118	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
6-119	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
6-120	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
6-121	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
6-122	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
6-123	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
6-124	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
6-125	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
6-126	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
6-127	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
6-128	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
6-129	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
6-130	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
6-131	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
6-132	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
6-133	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
6-134	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
6-135	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
6-136	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

[0331] [Quím. 33]



(1-7)

[0332] Tabla 7 (En la Tabla 7, R^{6a} y R^{6b} representan átomos de hidrógeno.)

[Tabla 7-1]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
7-1	Ph	Me	NH_2	Et	CO_2Et	RMN
7-2	Ph	Me	NH_2	Et	CO_2Me	
7-3	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-4	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-5	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-6	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-7	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-8	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-9	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-10	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-11	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-12	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-13	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-14	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-15	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-16	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-17	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-18	Ph	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	189-190

7-19	Ph	Br	NH_2	Et	SO_2NHMe	159-160

[0333]

[Tabla 7-2]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
7-20	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2Me	144-146
7-21	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	187-188
7-22	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NMe_2	58-59
7-23	CONHPh	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	161-163
7-24	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-25	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-26	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-27	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-28	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-29	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-30	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-31	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-32	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-33	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-34	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-35	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-36	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-37	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-38	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-39	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-40	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-41	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-42	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-43	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-44	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

7-45	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-46	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-47	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-48	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-49	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	

[0334]

[Tabla 7-3]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
7-50	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-51	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-52	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-53	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-54	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-55	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-56	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-57	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-58	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-59	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-60	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-61	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-62	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-63	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-64	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-65	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-66	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-67	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-68	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-69	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-70	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	

7-71	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-72	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-73	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-74	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-75	pirimidin-2-il	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-76	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-77	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-78	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-79	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	

[0335]

[Tabla 7-4]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
7-80	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-81	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-82	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-83	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-84	Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-85	Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-86	Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-87	2-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-88	2-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-89	2-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-90	3-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-91	3-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-92	3-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-93	4-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
7-94	4-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-95	4-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-96	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	

7-97	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
7-98	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
7-99	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
7-100	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
7-101	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
7-102	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
7-103	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
7-104	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
7-105	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
7-106	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
7-107	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
7-108	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
7-109	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	

[0336]

[Tabla 7-5]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
7-110	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
7-111	2,6-F2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
7-112	2,6-F2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
7-113	2,6-F2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
7-114	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
7-115	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
7-116	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
7-117	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
7-118	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
7-119	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
7-120	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
7-121	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
7-122	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

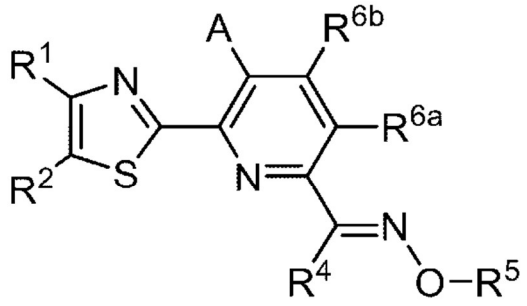
7-123	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
7-124	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
7-125	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
7-126	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
7-127	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
7-128	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
7-129	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
7-130	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
7-131	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
7-132	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
7-133	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
7-134	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
7-135	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
7-136	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
7-137	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
7-138	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
7-139	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	

[0337]

[Tabla 7-6]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de pro pie- dad física
7-140	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
7-141	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
7-142	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
7-143	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

[0338] [Quím. 34]



(1-8)

[0339] Tabla 8 (En la Tabla 8, R^{6a} y R^{6b} representan átomos de hidrógeno. En la Tabla 8-1, R^2 representa un átomo de hidrógeno.)

[Tabla 8-1]

Compuesto N.°	R^1	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
8-1	Ph	NH_2	Me	SO_2NHMe	190-191
8-2	Ph	NH_2	Et	SO_2NHMe	157-158
8-3	Ph	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
8-4	2-F-Ph	NH_2	Me	SO_2NHMe	208-210
8-5	2-F-Ph	NH_2	Et	SO_2NHMe	150-151
8-6	2-F-Ph	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
8-7	3-F-Ph	NH_2	Me	SO_2NHMe	
8-8	3-F-Ph	NH_2	Et	SO_2NHMe	
8-9	3-F-Ph	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
8-10	4-F-Ph	NH_2	Me	SO_2NHMe	
8-11	4-F-Ph	NH_2	Et	SO_2NHMe	
8-12	4-F-Ph	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
8-13	2,6-F_2-Ph	NH_2	Me	SO_2NHMe	
8-14	2,6-F_2-Ph	NH_2	Et	SO_2NHMe	
8-15	2,6-F_2-Ph	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
8-16	Ph	NH_2	Me	SO_2Me	236-237
8-17	Ph	NH_2	Et	SO_2Me	177-179
8-18	Ph	NH_2	i-Pr	SO_2Me	

8-19	2-F-Ph	NH_2	Me	SO_2Me	
8-20	2-F-Ph	NH_2	Et	SO_2Me	
8-21	2-F-Ph	NH_2	i-Pr	SO_2Me	

[0340]

[Tabla 8-2]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
8-22	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2Me	226-228
8-23	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2Me	179-180
8-24	piridin-2-ilo	H	NH_2	Me	SO_2Me	230-232
8-25	piridin-2-ilo	H	NH_2	Et	SO_2Me	204-205
8-26	piridin-2-ilo	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	234-236
8-27	piridin-2-ilo	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	222-223
8-28	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	184-185
8-29	Ph	Cl	NH_2	Me	SO_2NHMe	232-233
8-30	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
8-31	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
8-32	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
8-33	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
8-34	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
8-35	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
8-36	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
8-37	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
8-38	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
8-39	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
8-40	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
8-41	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
8-42	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
8-43	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
8-44	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

8-45	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
8-46	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
8-47	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
8-48	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
8-49	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
8-50	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
8-51	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	

[0341]

[Tabla 8-3]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
8-52	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
8-53	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
8-54	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
8-55	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
8-56	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
8-57	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
8-58	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
8-59	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
8-60	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
8-61	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
8-62	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
8-63	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
8-64	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
8-65	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
8-66	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
8-67	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
8-68	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
8-69	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
8-70	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	

8-71	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
8-72	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
8-73	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
8-74	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
8-75	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
8-76	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
8-77	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
8-78	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
8-79	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
8-80	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
8-81	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	

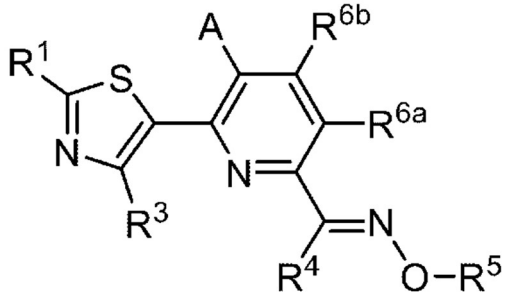
[0342]

[Tabla 8-4]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
8-82	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
8-83	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
8-84	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
8-85	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
8-86	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
8-87	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
8-88	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
8-89	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
8-90	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
8-91	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
8-92	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
8-93	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
8-94	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
8-95	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
8-96	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	

8-97	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
8-98	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
8-99	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
8-100	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
8-101	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
8-102	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
8-103	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
8-104	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

[0343] [Quím. 35]



(1-9)

[0344] Tabla 9 (En la Tabla 9, R^{6a} y R^{6b} representan átomos de hidrógeno.)

[Tabla 9-1]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
9-1	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-2	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-3	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-4	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-5	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-6	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-7	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-8	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-9	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

9-10	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-11	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-12	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-13	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-14	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-15	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0345]

[Tabla 9-2]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
9-16	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-17	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-18	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-19	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-20	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-21	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-22	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-23	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-24	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-25	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-26	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-27	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-28	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-29	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-30	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-31	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-32	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-33	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-34	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-35	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	

9-36	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-37	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-38	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-39	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-40	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-41	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-42	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-43	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-44	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-45	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0346]

[Tabla 9-3]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
9-46	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-47	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-48	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-49	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-50	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-51	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-52	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-53	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-54	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-55	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-56	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-57	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-58	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-59	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-60	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-61	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	

9-62	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-63	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-64	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-65	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-66	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-67	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-68	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-69	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-70	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-71	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-72	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-73	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-74	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-75	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0347]

[Tabla 9-4]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
9-76	Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-77	Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-78	Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-79	2-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-80	2-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-81	2-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-82	3-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-83	3-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-84	3-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-85	4-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-86	4-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-87	4-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

9-88	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
9-89	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
9-90	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
9-91	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
9-92	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
9-93	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
9-94	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
9-95	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
9-96	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
9-97	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
9-98	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
9-99	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
9-100	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
9-101	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
9-102	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
9-103	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
9-104	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
9-105	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

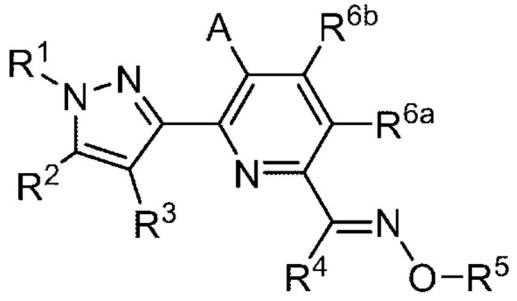
[0348]

[Tabla 9-5]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
9-106	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
9-107	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
9-108	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
9-109	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
9-110	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
9-111	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
9-112	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
9-113	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	

9-114	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
9-115	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
9-116	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
9-117	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
9-118	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
9-119	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
9-120	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
9-121	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
9-122	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
9-123	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
9-124	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
9-125	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
9-126	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
9-127	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
9-128	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
9-129	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
9-130	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
9-131	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
9-132	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
9-133	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
9-134	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
9-135	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

[0349] [Quím. 36]



(1-10)

[0350] Tabla 10 (En la Tabla 10, R^{6a} y R^{6b} representan átomos de hidrógeno.)

[Tabla 10-1]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
10-1	Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-2	Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	130-131
10-3	Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-4	2-F-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-5	2-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-6	2-F-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-7	3-F-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-8	3-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-9	3-F-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-10	4-F-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-11	4-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-12	4-F-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-13	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-14	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-15	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-16	Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2Me	150-151

[0351]

[Tabla 10-2]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
10-17	Bn	H	Me	NH_2	Et	SO_2Me	RMN
10-18	2-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2Me	RMN
10-19	Bz	H	Me	NH_2	Et	SO_2Me	RMN
10-20	Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NMe_2	RMN
10-21	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	

10-22	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-23	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-24	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-25	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-26	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-27	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-28	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-29	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-30	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-31	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-32	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-33	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-34	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-35	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-36	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-37	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-38	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-39	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-40	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-41	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-42	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-43	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-44	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-45	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-46	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	

[0352]

[Tabla 10-3]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
10-47	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

10-48	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-49	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-50	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-51	tiazol-5-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-52	tiazol-5-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-53	tiazol-5-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-54	tiazol-4-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-55	tiazol-4-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-56	tiazol-4-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-57	tiazol-2-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-58	tiazol-2-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-59	tiazol-2-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-60	tiofen-2-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-61	tiofen-2-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-62	tiofen-2-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-63	tiofen-3-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-64	tiofen-3-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-65	tiofen-3-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-66	piridazin-3-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-67	piridazin-3-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-68	piridazin-3-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-69	pirazin-2-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-70	pirazin-2-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-71	pirazin-2-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-72	pirimidin-2-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-73	pirimidin-2-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-74	pirimidin-2-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-75	pirimidin-4-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-76	pirimidin-4-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	

[0353]

[Tabla 10-4]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de pro

							pie-dad física
10-77	pirimidin-4-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-78	pirimidin-5-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-79	pirimidin-5-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-80	pirimidin-5-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-81	Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-82	Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-83	Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-84	2-F-Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-85	2-F-Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-86	2-F-Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-87	3-F-Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-88	3-F-Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-89	3-F-Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-90	4-F-Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-91	4-F-Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-92	4-F-Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-93	2,6-F_2-Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
10-94	2,6-F_2-Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
10-95	2,6-F_2-Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
10-96	Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
10-97	Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
10-98	Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
10-99	2-F-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
10-100	2-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
10-101	2-F-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
10-102	3-F-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
10-103	3-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
10-104	3-F-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
10-105	4-F-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
10-106	4-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	

[0354]

[Tabla 10-5]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
10-107	4-F-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
10-108	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
10-109	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
10-110	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
10-111	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
10-112	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
10-113	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
10-114	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
10-115	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
10-116	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
10-117	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
10-118	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
10-119	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
10-120	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
10-121	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
10-122	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
10-123	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
10-124	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
10-125	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
10-126	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
10-127	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
10-128	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
10-129	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
10-130	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
10-131	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
10-132	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	

10-133	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
10-134	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
10-135	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
10-136	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	

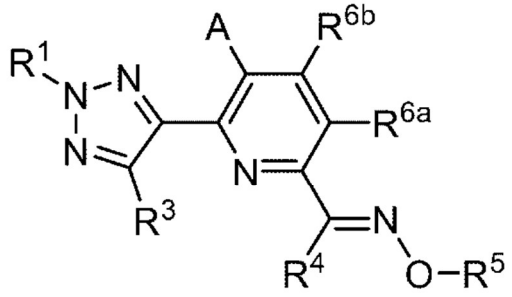
[0355]

[Tabla 10-6]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
10-137	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
10-138	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
10-139	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
10-140	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

[0356]

[Quím. 37]



(1-11)

[0357] Tabla 11 (En la Tabla 11, R^{6a} y R^{6b} representan átomos de hidrógeno.)

[Tabla 11-1]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
11-1	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	

11-2	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
11-3	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-4	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-5	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-6	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-7	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-8	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-9	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-10	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-11	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-12	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-13	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-14	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-15	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0358]

[Tabla 11-2]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
11-16	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-17	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-18	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-19	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-20	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-21	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-22	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-23	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-24	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-25	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-26	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-27	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

11-28	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-29	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-30	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-31	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-32	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-33	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-34	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-35	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-36	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-37	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-38	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-39	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-40	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-41	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-42	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-43	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-44	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-45	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0359]

[Tabla 11-3]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
11-46	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-47	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-48	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-49	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-50	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-51	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-52	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-53	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	

11-54	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-55	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-56	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-57	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-58	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-59	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-60	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-61	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-62	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-63	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-64	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-65	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-66	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-67	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-68	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-69	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-70	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-71	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-72	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-73	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-74	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-75	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0360]

[Tabla 11-4]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
11-76	Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-77	Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-78	Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-79	2-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	

11-80	2-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-81	2-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-82	3-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-83	3-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-84	3-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-85	4-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-86	4-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-87	4-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-88	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-89	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-90	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
11-91	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2Me	
11-92	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2Me	
11-93	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2Me	241-246
11-94	2-NO_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2Me	
11-95	2-NO_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2Me	179-184
11-96	2-NO_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-97	2-NO_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-98	2-NO_2-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2Me	
11-99	2-NO_2-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2Me	
11-100	2-NO_2-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-101	2-NO_2-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-102	2-NH_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2Me	
11-103	2-NH_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2Me	38-43
11-104	2-NH_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-105	2-NH_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	

[0361]

[Tabla 11-5]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física

11-106	2-NH_2-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2Me	
11-107	2-NH_2-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2Me	
11-108	2-NH_2-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-109	2-NH_2-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-110	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2Me	
11-111	2-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2Me	
11-112	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2Me	
11-113	3-F-piridin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2Me	
11-114	3-F-piridin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2Me	
11-115	3-F-piridin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-116	3-F-piridin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-117	3-F-piridin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2Me	
11-118	3-F-piridin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2Me	
11-119	3-F-piridin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-120	3-F-piridin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-121	3-NO_2-piridin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2Me	
11-122	3-NO_2-piridin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2Me	RMN
11-123	3-NO_2-piridin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-124	3-NO_2-piridin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-125	3-NO_2-piridin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2Me	
11-126	3-NO_2-piridin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2Me	
11-127	3-NO_2-piridin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-128	3-NO_2-piridin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-129	3-NH_2-piridin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2Me	
11-130	3-NH_2-piridin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2Me	193-198
11-131	3-NH_2-piridin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-132	3-NH_2-piridin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-133	3-NH_2-piridin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2Me	
11-134	3-NH_2-piridin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2Me	
11-135	3-NH_2-piridin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	

[0362]

[Tabla 11-6]

Compuesto	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor

N.°						de propiedad física
11-136	3-NH_2-piridin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-137	Me	Me	NH_2	Me	SO_2Me	
11-138	Me	Me	NH_2	Et	SO_2Me	
11-139	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-140	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-141	Me	Et	NH_2	Me	SO_2Me	
11-142	Me	Et	NH_2	Et	SO_2Me	
11-143	Me	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-144	Me	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-145	Et	Me	NH_2	Me	SO_2Me	
11-146	Et	Me	NH_2	Et	SO_2Me	
11-147	Et	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-148	Et	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-149	Et	Et	NH_2	Me	SO_2Me	
11-150	Et	Et	NH_2	Et	SO_2Me	
11-151	Et	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-152	Et	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-153	n-Pr	Me	NH_2	Me	SO_2Me	
11-154	n-Pr	Me	NH_2	Et	SO_2Me	
11-155	n-Pr	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-156	n-Pr	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-157	n-Pr	Et	NH_2	Me	SO_2Me	
11-158	n-Pr	Et	NH_2	Et	SO_2Me	
11-159	n-Pr	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-160	n-Pr	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-161	n-Bu	Me	NH_2	Me	SO_2Me	
11-162	n-Bu	Me	NH_2	Et	SO_2Me	
11-163	n-Bu	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-164	n-Bu	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	

11-165	n-Bu	Et	NH_2	Me	SO_2Me	

[0363]

[Tabla 11-7]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
11-166	n-Bu	Et	NH_2	Et	SO_2Me	
11-167	n-Bu	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
11-168	n-Bu	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
11-169	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
11-170	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
11-171	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
11-172	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
11-173	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
11-174	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
11-175	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
11-176	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
11-177	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
11-178	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
11-179	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
11-180	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
11-181	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
11-182	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
11-183	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
11-184	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
11-185	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
11-186	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
11-187	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
11-188	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
11-189	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
11-190	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	

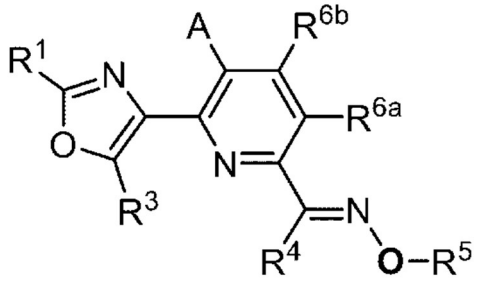
11-191	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
11-192	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
11-193	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
11-194	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
11-195	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
11-196	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	

[0364]

[Tabla 11-8]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
11-197	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
11-198	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
11-199	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
11-200	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
11-201	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
11-202	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
11-203	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
11-204	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
11-205	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
11-206	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
11-207	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
11-208	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
11-209	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
11-210	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
11-211	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
11-212	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
11-213	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
11-214	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2Me	36-41
11-215	i-Bu	Me	NH_2	Et	SO_2Me	54-59

[0365] [Quím. 38]



(1-12)

[0366] Tabla 12 (En la Tabla 12, R^{6a} y R^{6b} representan átomos de hidrógeno.)

[Tabla 12-1]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
12-1	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-2	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	163-164
12-3	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-4	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-5	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-6	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-7	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-8	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-9	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-10	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-11	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-12	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-13	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-14	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-15	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0367]

[Tabla 12-2]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de pro

						pie-dad física
12-16	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-17	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-18	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-19	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-20	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-21	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-22	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-23	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-24	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-25	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-26	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-27	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-28	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-29	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-30	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-31	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-32	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-33	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-34	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-35	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-36	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-37	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-38	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-39	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-40	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-41	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-42	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-43	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-44	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-45	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0368]

[Tabla 12-3]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
12-46	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-47	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-48	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-49	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-50	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-51	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-52	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-53	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-54	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-55	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-56	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-57	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-58	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-59	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-60	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-61	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-62	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-63	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-64	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-65	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-66	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-67	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-68	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-69	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-70	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-71	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	

12-72	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-73	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-74	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-75	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0369]

[Tabla 12-4]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
12-76	Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-77	Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-78	Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-79	2-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-80	2-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-81	2-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-82	3-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-83	3-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-84	3-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-85	4-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-86	4-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-87	4-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-88	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
12-89	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
12-90	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
12-91	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
12-92	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
12-93	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
12-94	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
12-95	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
12-96	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
12-97	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	

12-98	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
12-99	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
12-100	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
12-101	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
12-102	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
12-103	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
12-104	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
12-105	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

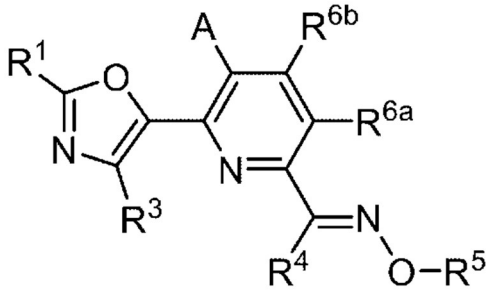
[0370]

[Tabla 12-5]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
12-106	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
12-107	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
12-108	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
12-109	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
12-110	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
12-111	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
12-112	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
12-113	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
12-114	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
12-115	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
12-116	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
12-117	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
12-118	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
12-119	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
12-120	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
12-121	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
12-122	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
12-123	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

12-124	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
12-125	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
12-126	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
12-127	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
12-128	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
12-129	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
12-130	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
12-131	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
12-132	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
12-133	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
12-134	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
12-135	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

[0371] [Quím. 39]



(1-13)

[0372] Tabla 13 (En la Tabla 13, R^{6a} y R^{6b} representan átomos de hidrógeno.)

[Tabla 13-1]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
13-1	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-2	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-3	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-4	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-5	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	

13-6	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-7	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-8	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-9	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-10	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-11	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-12	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-13	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-14	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-15	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0373]

[Tabla 13-2]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
13-16	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-17	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-18	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-19	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-20	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-21	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-22	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-23	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-24	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-25	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-26	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-27	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-28	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-29	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-30	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-31	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	

13-32	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-33	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-34	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-35	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-36	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-37	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-38	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-39	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-40	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-41	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-42	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-43	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-44	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-45	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0374]

[Tabla 13-3]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
13-46	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-47	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-48	tiazol-5-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-49	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-50	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-51	tiazol-4-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-52	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-53	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-54	tiazol-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-55	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-56	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-57	tiofen-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

13-58	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-59	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-60	tiofen-3-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-61	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-62	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-63	piridazin-3-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-64	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-65	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-66	pirazin-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-67	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-68	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-69	pirimidin-2-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-70	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-71	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-72	pirimidin-4-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-73	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-74	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-75	pirimidin-5-ilo	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0375]

[Tabla 13-4]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
13-76	Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-77	Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-78	Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-79	2-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-80	2-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-81	2-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-82	3-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-83	3-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	

13-84	3-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-85	4-F-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-86	4-F-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-87	4-F-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-88	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
13-89	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
13-90	2,6-F_2-Ph	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
13-91	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
13-92	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
13-93	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
13-94	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
13-95	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
13-96	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
13-97	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
13-98	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
13-99	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
13-100	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
13-101	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
13-102	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
13-103	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
13-104	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
13-105	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

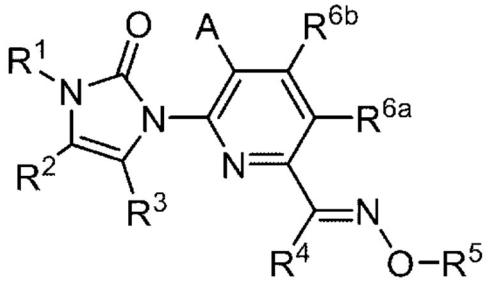
[0376]

[Tabla 13-5]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
13-106	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
13-107	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
13-108	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
13-109	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	

13-110	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
13-111	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
13-112	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
13-113	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
13-114	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
13-115	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
13-116	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
13-117	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
13-118	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
13-119	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
13-120	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
13-121	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
13-122	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
13-123	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
13-124	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
13-125	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
13-126	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
13-127	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
13-128	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
13-129	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
13-130	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
13-131	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
13-132	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
13-133	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
13-134	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
13-135	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

[0377] [Quím. 40]



(1-14)

[0378] Tabla 14 (En la Tabla 14, R^2, R^{6a} y R^{6b} representan átomos de hidrógeno.)

[Tabla 14-1]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
14-1	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-2	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-3	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-4	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-5	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-6	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-7	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-8	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-9	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-10	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-11	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-12	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-13	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-14	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-15	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0379]

[Tabla 14-2]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
14-16	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-17	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-18	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

14-19	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-20	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-21	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-22	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-23	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-24	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-25	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-26	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-27	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-28	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-29	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-30	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-31	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-32	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-33	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-34	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-35	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-36	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-37	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-38	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-39	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-40	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-41	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-42	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-43	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-44	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-45	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0380]

[Tabla 14-3]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de pro pie-dad

							física
14-46	tiazol-5-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-47	tiazol-5-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-48	tiazol-5-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-49	tiazol-4-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-50	tiazol-4-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-51	tiazol-4-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-52	tiazol-2-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-53	tiazol-2-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-54	tiazol-2-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-55	tiofen-2-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-56	tiofen-2-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-57	tiofen-2-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-58	tiofen-3-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-59	tiofen-3-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-60	tiofen-3-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-61	piridazin-3-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-62	piridazin-3-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-63	piridazin-3-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-64	pirazin-2-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-65	pirazin-2-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-66	pirazin-2-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-67	pirimidin-2-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-68	pirimidin-2-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-69	pirimidin-2-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-70	pirimidin-4-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-71	pirimidin-4-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-72	pirimidin-4-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-73	pirimidin-5-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-74	pirimidin-5-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-75	pirimidin-5-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0381]

[Tabla 14-4]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
14-76	Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-77	Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-78	Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-79	2-F-Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-80	2-F-Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-81	2-F-Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-82	3-F-Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-83	3-F-Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-84	3-F-Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-85	4-F-Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-86	4-F-Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-87	4-F-Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-88	2,6-F_2-Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
14-89	2,6-F_2-Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
14-90	2,6-F_2-Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
14-91	Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
14-92	Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
14-93	Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
14-94	2-F-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
14-95	2-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
14-96	2-F-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
14-97	3-F-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
14-98	3-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
14-99	3-F-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
14-100	4-F-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
14-101	4-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
14-102	4-F-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
14-103	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	

14-104	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
14-105	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

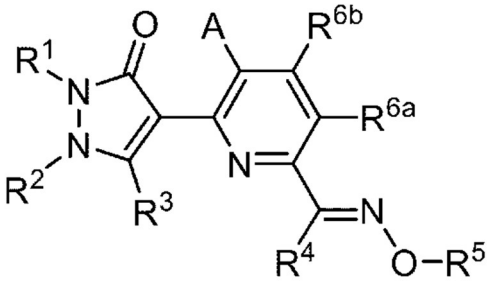
[0382]

[Tabla 14-5]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
14-106	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
14-107	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
14-108	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
14-109	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
14-110	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
14-111	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
14-112	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
14-113	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
14-114	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
14-115	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
14-116	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
14-117	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
14-118	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
14-119	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
14-120	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
14-121	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
14-122	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
14-123	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
14-124	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
14-125	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
14-126	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
14-127	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
14-128	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
14-129	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

14-130	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
14-131	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
14-132	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
14-133	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
14-134	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
14-135	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

[0383] [Quím. 41]



(1-15)

[0384] Tabla 15 (En la Tabla 15, R^2, R^{6a} y R^{6b} representan átomos de hidrógeno.)

[Tabla 15-1]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
15-1	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-2	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-3	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-4	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-5	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-6	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-7	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-8	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-9	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-10	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-11	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	

15-12	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-13	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-14	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-15	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0385]

[Tabla 15-2]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
15-16	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-17	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-18	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-19	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-20	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-21	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-22	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-23	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-24	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-25	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-26	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-27	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-28	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-29	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-30	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-31	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-32	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-33	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-34	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-35	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-36	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-37	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	

15-38	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-39	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-40	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-41	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-42	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-43	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-44	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-45	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0386]

[Tabla 15-3]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
15-46	tiazol-5-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-47	tiazol-5-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-48	tiazol-5-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-49	tiazol-4-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-50	tiazol-4-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-51	tiazol-4-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-52	tiazol-2-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-53	tiazol-2-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-54	tiazol-2-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-55	tiofen-2-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-56	tiofen-2-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-57	tiofen-2-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-58	tiofen-3-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-59	tiofen-3-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-60	tiofen-3-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-61	piridazin-3-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-62	piridazin-3-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-63	piridazin-3-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

15-64	pirazin-2-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-65	pirazin-2-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-66	pirazin-2-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-67	pirimidin-2-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-68	pirimidin-2-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-69	pirimidin-2-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-70	pirimidin-4-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-71	pirimidin-4-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-72	pirimidin-4-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-73	pirimidin-5-ilo	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-74	pirimidin-5-ilo	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-75	pirimidin-5-ilo	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0387]

[Tabla 15-4]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
15-76	Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-77	Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-78	Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-79	2-F-Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-80	2-F-Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-81	2-F-Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-82	3-F-Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-83	3-F-Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-84	3-F-Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-85	4-F-Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-86	4-F-Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	
15-87	4-F-Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-88	2,6-F_2-Ph	H	Et	NH_2	Me	SO_2NHMe	
15-89	2,6-F_2-Ph	H	Et	NH_2	Et	SO_2NHMe	

15-90	2,6-F_2-Ph	H	Et	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
15-91	Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
15-92	Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
15-93	Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
15-94	2-F-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
15-95	2-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
15-96	2-F-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
15-97	3-F-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
15-98	3-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
15-99	3-F-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
15-100	4-F-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
15-101	4-F-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
15-102	4-F-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
15-103	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
15-104	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
15-105	2,6-F_2-Ph	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

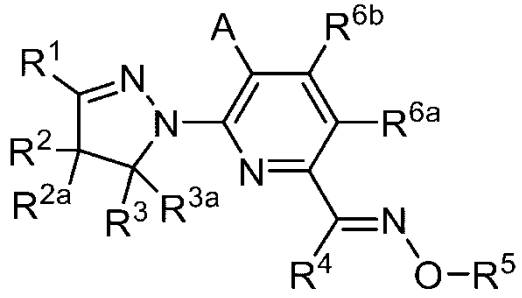
[0388]

[Tabla 15-5]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
15-106	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
15-107	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
15-108	tiazol-5-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
15-109	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
15-110	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
15-111	tiazol-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
15-112	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
15-113	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
15-114	tiazol-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
15-115	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	

15-116	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
15-117	tiofen-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
15-118	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
15-119	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
15-120	tiofen-3-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
15-121	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
15-122	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
15-123	piridazin-3-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
15-124	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
15-125	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
15-126	pirazin-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
15-127	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
15-128	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
15-129	pirimidin-2-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
15-130	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
15-131	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
15-132	pirimidin-4-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
15-133	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
15-134	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
15-135	pirimidin-5-ilo	H	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

[0389] [Quím. 42]



(1-16)

[0390] Tabla 16 (En la Tabla 16, R^2, R^{2a}, R^{6a} y R^{6b} representan átomos de hidrógeno.)

[Tabla 16-1]

Compuesto N.°	R^1	R^3	R^{3a}	R^4	R^5	A	Valor de pro

							pie-dad física
16-1	Ph	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-2	Ph	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-3	Ph	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-4	2-F-Ph	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-5	2-F-Ph	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-6	2-F-Ph	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-7	3-F-Ph	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-8	3-F-Ph	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-9	3-F-Ph	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-10	4-F-Ph	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-11	4-F-Ph	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-12	4-F-Ph	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-13	2,6-F_2-Ph	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-14	2,6-F_2-Ph	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-15	2,6-F_2-Ph	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-16	Ph	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-17	Ph	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-18	Ph	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-19	2-F-Ph	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-20	2-F-Ph	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-21	2-F-Ph	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-22	3-F-Ph	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-23	3-F-Ph	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-24	3-F-Ph	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-25	4-F-Ph	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-26	4-F-Ph	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-27	4-F-Ph	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-28	2,6-F_2-Ph	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-29	2,6-F_2-Ph	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-30	2,6-F_2-Ph	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0391]

[Tabla 16-2]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^{2a}	R^3	R^{3a}	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
16-31	tiazol-5-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-32	tiazol-5-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-33	tiazol-5-ilo	H	H	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-34	tiazol-4-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-35	tiazol-4-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-36	tiazol-4-ilo	H	H	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-37	tiazol-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-38	tiazol-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-39	tiazol-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-40	tiofen-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-41	tiofen-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-42	tiofen-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

16-43	tiofen-3-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-44	tiofen-3-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-45	tiofen-3-ilo	H	H	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-46	piridazin-3-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-47	piridazin-3-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-48	piridazin-3-ilo	H	H	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-49	pirazin-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-50	pirazin-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-51	pirazin-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-52	pirimidin-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-53	pirimidin-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-54	pirimidin-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-55	pirimidin-4-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-56	pirimidin-4-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-57	pirimidin-4-ilo	H	H	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-58	pirimidin-5-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-59	pirimidin-5-	H	H	M	H	NH	Et	SO_2NHM	

	ilo			e		$_2$		e	
16-60	pirimidin-5-ilo	H	H	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0392]

[Tabla 16-3]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^{2a}	R^3	R^{3a}	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
16-61	tiazol-5-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-62	tiazol-5-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-63	tiazol-5-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-64	tiazol-4-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-65	tiazol-4-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-66	tiazol-4-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-67	tiazol-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-68	tiazol-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-69	tiazol-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-70	tiofen-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-71	tiofen-2-ilo	H	H	M	Me	NH	Et	SO_2NHM	

				e		$_2$		e	
16-72	tiofen-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-73	tiofen-3-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-74	tiofen-3-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-75	tiofen-3-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-76	piridazin-3-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-77	piridazin-3-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-78	piridazin-3-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-79	pirazin-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-80	pirazin-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-81	pirazin-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-82	pirimidin-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-83	pirimidin-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-84	pirimidin-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-85	pirimidin-4-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-86	pirimidin-4-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-87	pirimidin-4-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

16-88	pirimidin-5-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-89	pirimidin-5-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-90	pirimidin-5-il	H	H	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0393]

[Tabla 16-4]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^{2a}	R^3	R^{3a}	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
16-91	Ph	H	H	H	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-92	Ph	H	H	H	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-93	Ph	H	H	H	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-94	2,6-F_2-Ph	H	H	H	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-95	2,6-F_2-Ph	H	H	H	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-96	2,6-F_2-Ph	H	H	H	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-97	tiofen-2-ilo	H	H	H	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-98	tiofen-2-ilo	H	H	H	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-99	tiofen-2-ilo	H	H	H	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

16-100	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
16-101	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
16-102	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
16-103	tiazol-5-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-104	tiazol-5-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHEt	
16-105	tiazol-5-ilo	H	H	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
16-106	tiazol-4-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-107	tiazol-4-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHEt	
16-108	tiazol-4-ilo	H	H	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
16-109	tiazol-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-110	tiazol-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHEt	
16-111	tiazol-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
16-112	tiofen-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-113	tiofen-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHEt	
16-114	tiofen-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
16-115	tiofen-3-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-116	tiofen-3-ilo	H	H	M	H	NH	Et	SO_2NHE	

				e		$_2$		t	
16-117	tiofen-3-ilo	H	H	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
16-118	piridazin-3-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-119	piridazin-3-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHEt	
16-120	piridazin-3-ilo	H	H	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

[0394]

[Tabla 16-5]

Compuesto N.º	R^1	R_2	R^{2a}	R^3	R^{3a}	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
16-121	pirazin-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-122	pirazin-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHEt	
16-123	pirazin-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
16-124	pirimidin-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-125	pirimidin-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHEt	
16-126	pirimidin-2-ilo	H	H	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
16-127	pirimidin-4-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-128	pirimidin-4-	H	H	M	H	NH	Et	SO_2NHE	

	ilo			e		$_2$		t	
16-129	pirimidin-4-ilo	H	H	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
16-130	pirimidin-5-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-131	pirimidin-5-ilo	H	H	Me	H	NH_2	Et	SO_2NHEt	
16-132	pirimidin-5-ilo	H	H	Me	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
16-133	tiazol-5-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-134	tiazol-5-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
16-135	tiazol-5-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
16-136	tiazol-4-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-137	tiazol-4-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
16-138	tiazol-4-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
16-139	tiazol-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-140	tiazol-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
16-141	tiazol-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
16-142	tiofen-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-143	tiofen-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
16-144	tiofen-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

16-145	tiofen-3-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-146	tiofen-3-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
16-147	tiofen-3-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
16-148	piridazin-3-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-149	piridazin-3-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
16-150	piridazin-3-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

[0395]

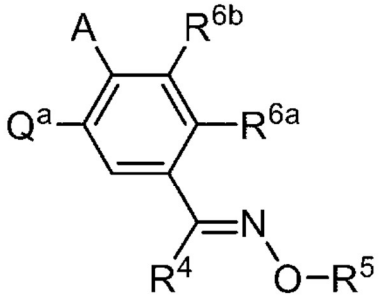
[Tabla 16-6]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^{2a}	R^3	R^{3a}	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
16-151	pirazin-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-152	pirazin-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
16-153	pirazin-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
16-154	pirimidin-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-155	pirimidin-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
16-156	pirimidin-2-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

16-157	pirimidin-4-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-158	pirimidin-4-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
16-159	pirimidin-4-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
16-160	pirimidin-5-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-161	pirimidin-5-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	Et	SO_2NHEt	
16-162	pirimidin-5-ilo	H	H	Me	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
16-163	Ph	H	H	H	H	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-164	Ph	H	H	H	H	NH_2	Et	SO_2NHEt	
16-165	Ph	H	H	H	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
16-166	2,6-F_2-Ph	H	H	H	H	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-167	2,6-F_2-Ph	H	H	H	H	NH_2	Et	SO_2NHEt	
16-168	2,6-F_2-Ph	H	H	H	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
16-169	tiofen-2-ilo	H	H	H	H	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-170	tiofen-2-ilo	H	H	H	H	NH_2	Et	SO_2NHEt	
16-171	tiofen-2-ilo	H	H	H	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
16-172	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	NH_2	Me	SO_2NHEt	
16-173	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	NH	Et	SO_2NHE	

						2		t	
16-174	tiofen-3-ilo	H	H	H	H	NH 2	i-Pr	SO_2NHE t	

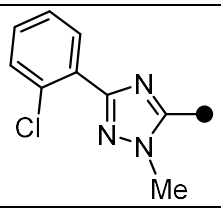
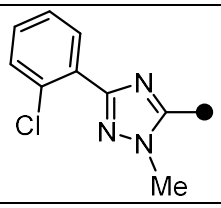
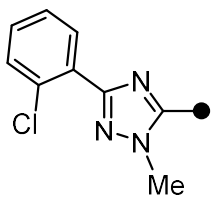
[0396] [Quím. 43]

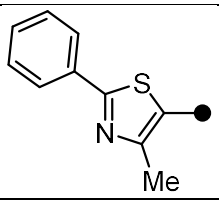
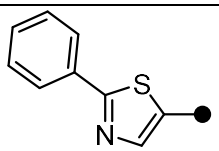
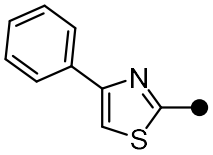
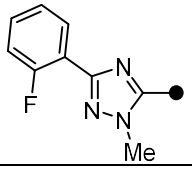


(1-17)

[0397] Tabla 17 (En la Tabla 17, R^{6a} y R^{6b} representan átomos de hidrógeno y cada círculo sólido representa a binding position.)

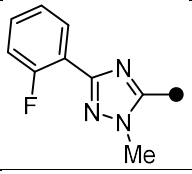
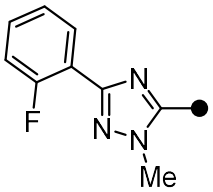
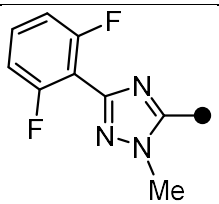
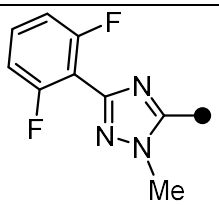
[Tabla 17-1]

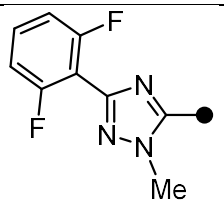
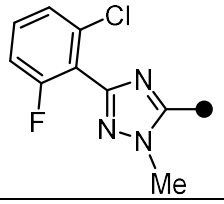
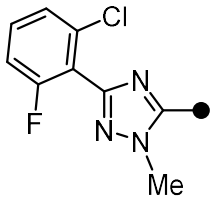
Compuesto N.°	Q^a	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
17-1		NH_2	Me	SO_2NHMe	182-183
17-2		NH_2	Et	SO_2NHMe	167-168
17-3		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	199-200

17-4		NH_2	Et	CO_2Me	RMN
17-5		NH_2	Et	CO_2Me	RMN
17-6		NH_2	Et	CO_2Et	RMN
17-7		NH_2	Me	SO_2NHMe	

[0398]

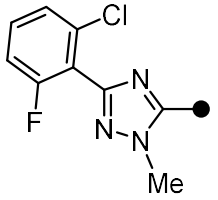
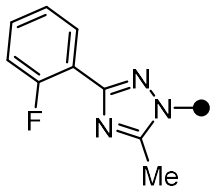
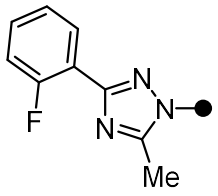
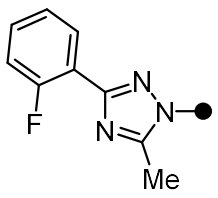
[Tabla 17-2]

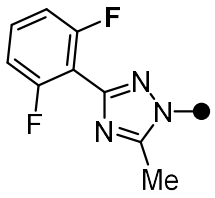
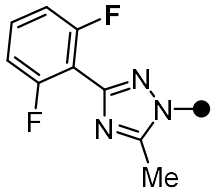
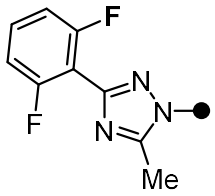
Compuesto N.°	Q^a	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
17-8		NH_2	Et	SO_2NHMe	
17-9		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
17-10		NH_2	Me	SO_2NHMe	
17-11		NH_2	Et	SO_2NHMe	

17-12		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
17-13		NH_2	Me	SO_2NHMe	
17-14		NH_2	Et	SO_2NHMe	

[0399]

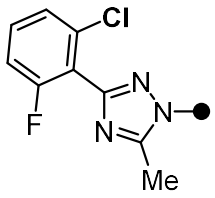
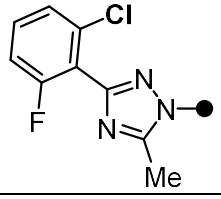
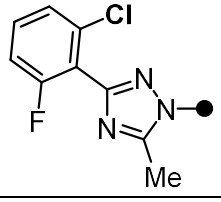
[Tabla 17-3]

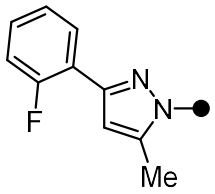
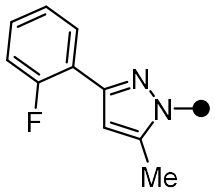
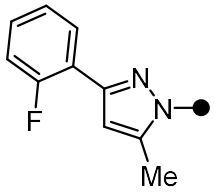
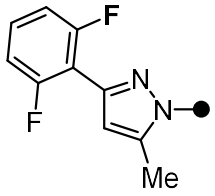
Compuesto N.°	Q^a	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
17-15		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
17-16		NH_2	Me	SO_2NHMe	
17-17		NH_2	Et	SO_2NHMe	
17-18		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

17-19		NH_2	Me	SO_2NHMe	
17-20		NH_2	Et	SO_2NHMe	
17-21		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0400]

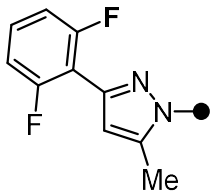
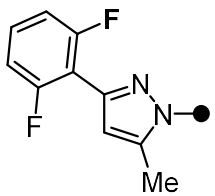
[Tabla 17-4]

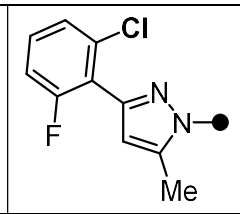
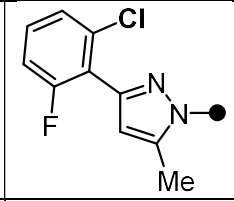
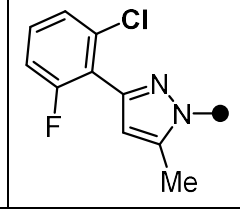
Compuesto N.º	Q^a	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
17-22		NH_2	Me	SO_2NHMe	
17-23		NH_2	Et	SO_2NHMe	
17-24		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

17-25		NH_2	Me	SO_2NHMe	
17-26		NH_2	Et	SO_2NHMe	
17-27		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
17-28		NH_2	Me	SO_2NHMe	

[0401]

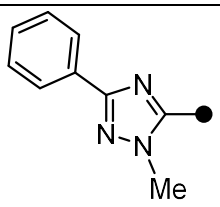
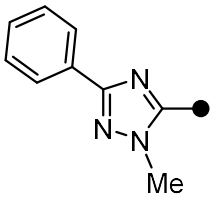
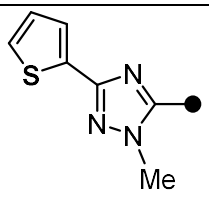
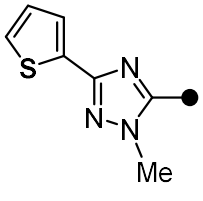
[Tabla 17-5]

Compuesto N.°	Q^a	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
17-29		NH_2	Et	SO_2NHMe	
17-30		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

17-31		NH_2	Me	SO_2NHMe	
17-32		NH_2	Et	SO_2NHMe	
17-33		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

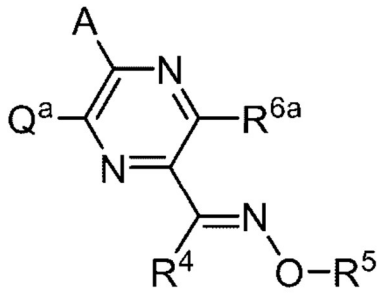
[0402]

[Tabla 17-6]

Compuesto N.°	Q^a	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
17-34		NH_2	Et	SO_2NHMe	
17-35		NH_2	Et	SO_2Me	
17-36		NH_2	Et	SO_2NHMe	
17-37		NH_2	Et	SO_2Me	

17-38		NH_2	Et	SO_2NHMe	
17-39		NH_2	Et	SO_2Me	
17-40		NH_2	Et	SO_2NHMe	
17-41		NH2	Et	SO2NHMe	

[0403] [Quím. 44]

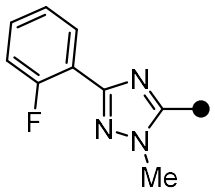
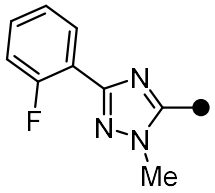
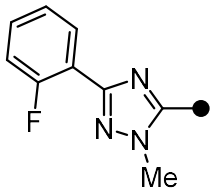
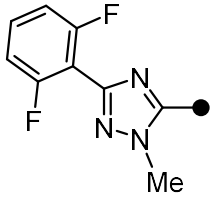
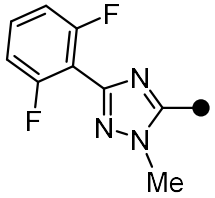
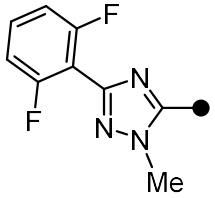
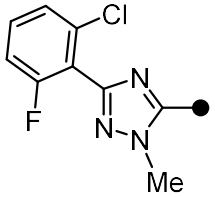


(1-18)

[0404] Tabla 18 (En la Tabla 18, R^{6a} representa un átomo de hidrógeno y cada círculo sólido representa a binding position.)

[Tabla 18-1]

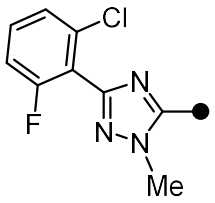
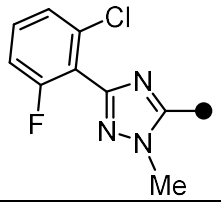
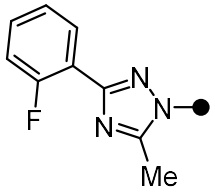
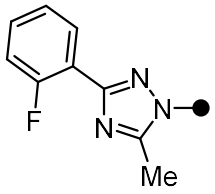
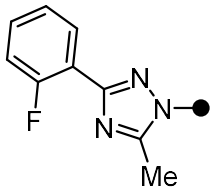
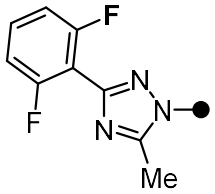
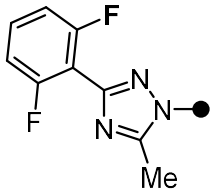
Compuesto N.°	Q^a	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física

18-1		NH_2	Me	SO_2NHMe	
18-2		NH_2	Et	SO_2NHMe	
18-3		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
18-4		NH_2	Me	SO_2NHMe	
18-5		NH_2	Et	SO_2NHMe	
18-6		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
18-7		NH_2	Me	SO_2NHMe	

[0405]

[Tabla 18-2]

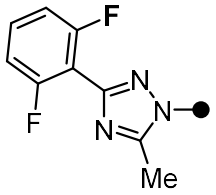
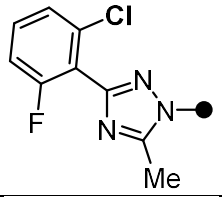
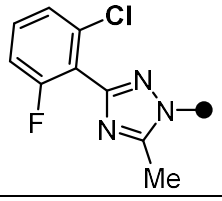
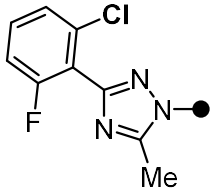
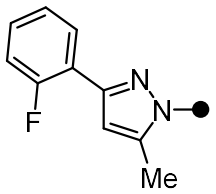
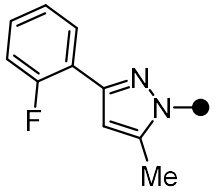
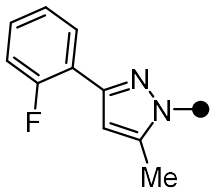
Compuesto N.°	Q^a	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física

18-8		NH_2	Et	SO_2NHMe	
18-9		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
18-10		NH_2	Me	SO_2NHMe	
18-11		NH_2	Et	SO_2NHMe	
18-12		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
18-13		NH_2	Me	SO_2NHMe	
18-14		NH_2	Et	SO_2NHMe	

[0406]

[Tabla 18-3]

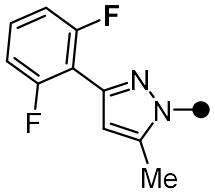
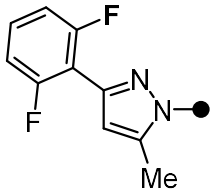
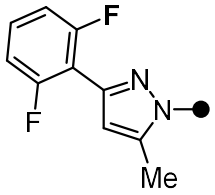
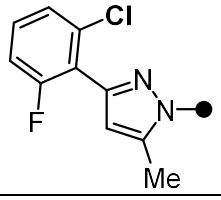
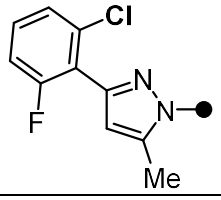
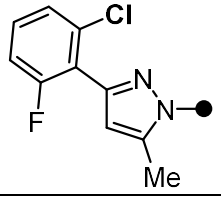
Compuesto N.°	Q^a	R^4	R^5	A	Valor de propiedad

					física
18-15		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
18-16		NH_2	Me	SO_2NHMe	
18-17		NH_2	Et	SO_2NHMe	
18-18		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
18-19		NH_2	Me	SO_2NHMe	
18-20		NH_2	Et	SO_2NHMe	
18-21		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0407]

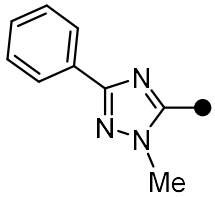
[Tabla 18-4]

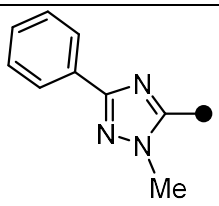
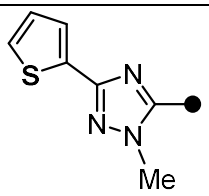
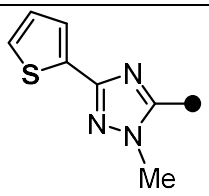
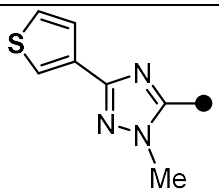
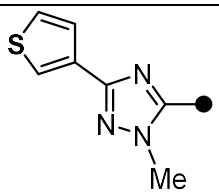
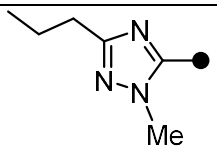
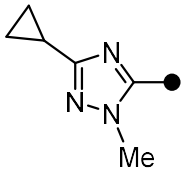
Compuesto N.°	Q^a	R^4	R^5	A	Valor de propiedad

					física
18-22		NH_2	Me	SO_2NHMe	
18-23		NH_2	Et	SO_2NHMe	
18-24		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
18-25		NH_2	Me	SO_2NHMe	
18-26		NH_2	Et	SO_2NHMe	
18-27		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0408]

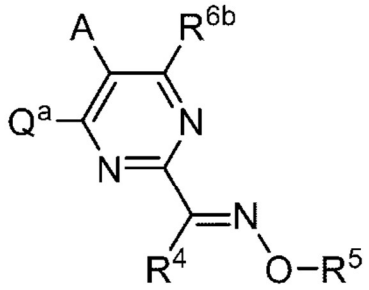
[Tabla 18-5]

Compuesto N.°	Q^a	R^4	R^5	A	Valor de pro pie- dad física
18-28		NH_2	Et	SO_2NHMe	

18-29		NH_2	Et	SO_2Me	
18-30		NH_2	Et	SO_2NHMe	
18-31		NH_2	Et	SO_2Me	
18-32		NH_2	Et	SO_2NHMe	
18-33		NH_2	Et	SO_2Me	
18-34		NH_2	Et	SO_2NHMe	
18-35		NH2	Et	SO2NHMe	

[0409]

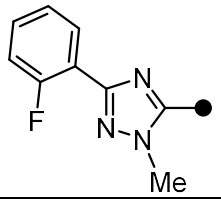
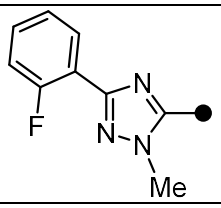
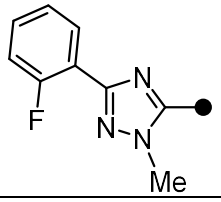
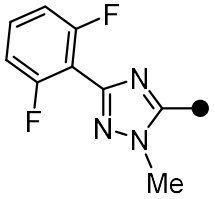
[Quím. 45]

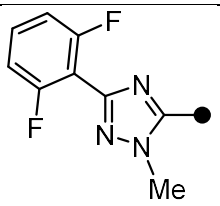
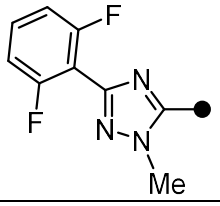


(1-19)

[0410] Tabla 19 (En la Tabla 19, R^{6b} representa un átomo de hidrógeno y cada círculo sólido representa una posición de unión.)

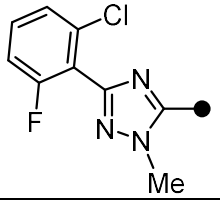
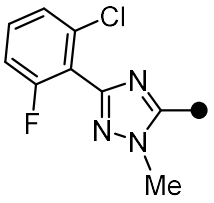
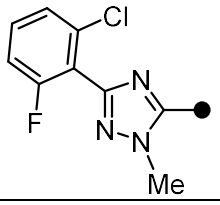
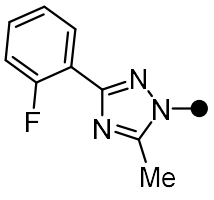
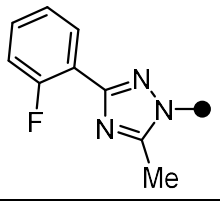
[Tabla 19-1]

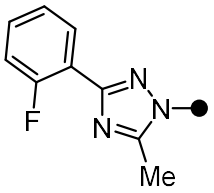
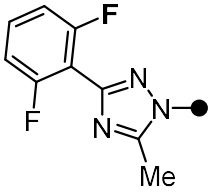
Compuesto N.°	Q^a	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
19-1		NH_2	Me	SO_2NHMe	
19-2		NH_2	Et	SO_2NHMe	
19-3		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
19-4		NH_2	Me	SO_2NHMe	

19-5		NH_2	Et	SO_2NHMe	
19-6		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0411]

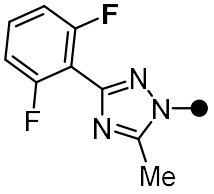
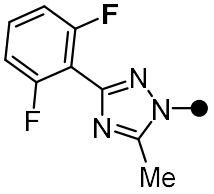
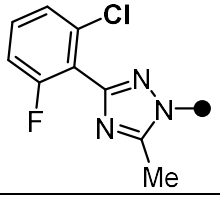
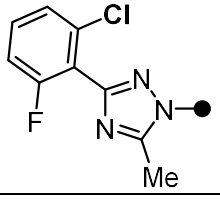
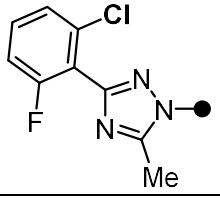
[Tabla 19-2]

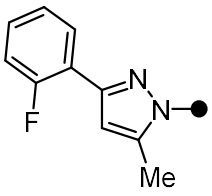
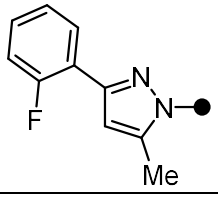
Compuesto N.°	Q^a	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
19-7		NH_2	Me	SO_2NHMe	
19-8		NH_2	Et	SO_2NHMe	
19-9		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
19-10		NH_2	Me	SO_2NHMe	
19-11		NH_2	Et	SO_2NHMe	

19-12		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
19-13		NH_2	Me	SO_2NHMe	

[0412]

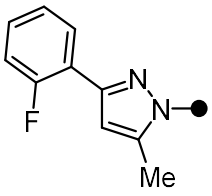
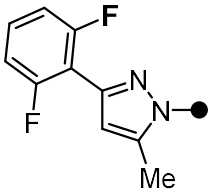
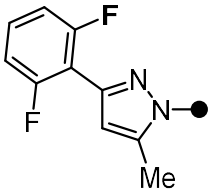
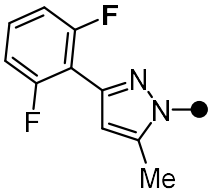
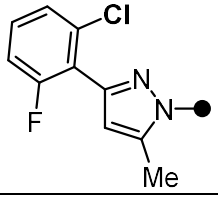
[Tabla 19-3]

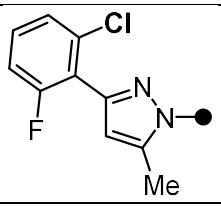
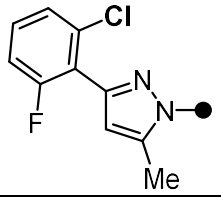
Compuesto N.°	Q^a	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
19-14		NH_2	Et	SO_2NHMe	
19-15		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
19-16		NH_2	Me	SO_2NHMe	
19-17		NH_2	Et	SO_2NHMe	
19-18		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

19-19		NH_2	Me	SO_2NHMe	
19-20		NH_2	Et	SO_2NHMe	

[0413]

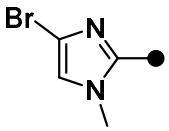
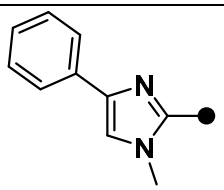
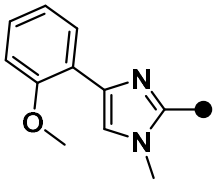
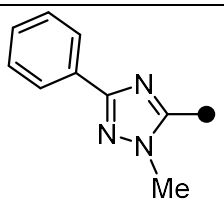
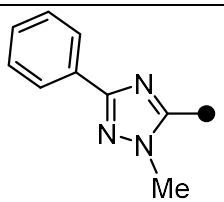
[Tabla 19-4]

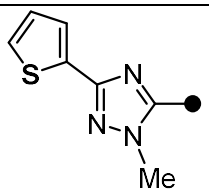
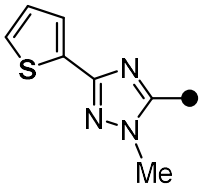
Compuesto N.°	Q^a	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
19-21		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
19-22		NH_2	Me	SO_2NHMe	
19-23		NH_2	Et	SO_2NHMe	
19-24		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
19-25		NH_2	Me	SO_2NHMe	

19-26		NH_2	Et	SO_2NHMe	
19-27		NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0414]

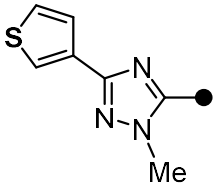
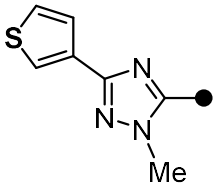
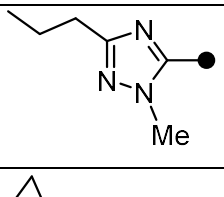
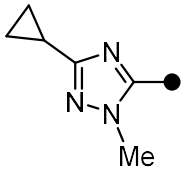
[Tabla 19-5]

Compuesto N.°	Q^a	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
19-28		NH_2	Et	SO_2Me	RMN
19-29		NH_2	Et	SO_2Me	RMN
19-30		NH_2	Et	SO_2Me	RMN
19-31		NH_2	Et	SO_2NHMe	
19-32		NH_2	Et	SO_2Me	

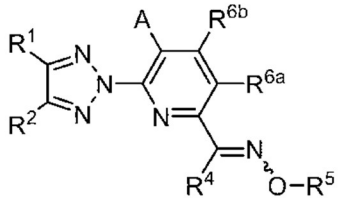
19-33		NH_2	Et	SO_2NHMe	
19-34		NH_2	Et	SO_2Me	

[0415]

[Tabla 19-6]

Compuesto N.°	Q^a	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
19-35		NH_2	Et	SO_2NHMe	
19-36		NH_2	Et	SO_2Me	
19-37		NH_2	Et	SO_2NHMe	
19-38		NH_2	Et	SO_2NHMe	

[0416] [Quím. 46]



(1-20)

[0417] Tabla 20 (En la Tabla 20, R^{6a} y R^{6b} representan átomos de hidrógeno.)

[Tabla 20-1]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
20-1	Ph	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
20-2	Ph	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	38-40
20-3	Ph	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
20-4	2-F-Ph	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
20-5	2-F-Ph	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
20-6	2-F-Ph	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
20-7	3-F-Ph	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
20-8	3-F-Ph	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
20-9	3-F-Ph	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
20-10	4-F-Ph	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
20-11	4-F-Ph	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
20-12	4-F-Ph	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
20-13	2,6-F_2-Ph	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
20-14	2,6-F_2-Ph	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
20-15	2,6-F_2-Ph	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
20-16	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
20-17	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	72-77
20-18	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
20-19	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	

20-20	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	RMN
20-21	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
20-22	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
20-23	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
20-24	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
20-25	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
20-26	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
20-27	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
20-28	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
20-29	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	38-43
20-30	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0418]

[Tabla 20-2]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
20-31	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
20-32	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
20-33	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
20-34	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
20-35	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
20-36	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
20-37	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
20-38	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
20-39	tiazol-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
20-40	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
20-41	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
20-42	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
20-43	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
20-44	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
20-45	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

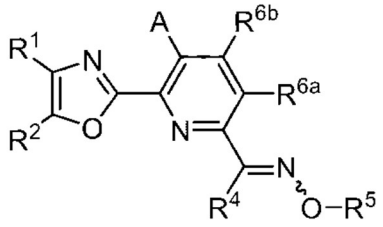
20-46	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
20-47	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
20-48	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
20-49	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
20-50	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
20-51	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
20-52	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
20-53	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
20-54	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
20-55	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
20-56	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
20-57	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
20-58	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
20-59	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
20-60	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0419]

[Tabla 20-3]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
20-61	piridin-2-ilo	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	75-80
20-62	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2Me	59-64
20-63	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2Me	50-55
20-64	3-Cl-pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2Me	
20-65	3-Cl-pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
20-66	3-Cl-piridin-2-ilo	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	52-57

[0420] [Quím. 47]



(1-21)

[0421] Tabla 21 (En la Tabla 21, R^{6a} y R^{6b} representan átomos de hidrógeno.)

[Tabla 21-1]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
21-1	Ph	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-2	Ph	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	165-166
21-3	Ph	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-4	2-F-Ph	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-5	2-F-Ph	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-6	2-F-Ph	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-7	3-F-Ph	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-8	3-F-Ph	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-9	3-F-Ph	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-10	4-F-Ph	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-11	4-F-Ph	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-12	4-F-Ph	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-13	2,6-F_2-Ph	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-14	2,6-F_2-Ph	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-15	2,6-F_2-Ph	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-16	Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-17	Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-18	Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-19	2-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	

21-20	2-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-21	2-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-22	3-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-23	3-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-24	3-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-25	4-F-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-26	4-F-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-27	4-F-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-28	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-29	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-30	2,6-F_2-Ph	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0422]

[Tabla 21-2]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^4	R^5	A	Valor de propiedad física
21-31	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-32	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-33	tiazol-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-34	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-35	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-36	tiazol-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-37	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-38	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-39	tiofen-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-40	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-41	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-42	tiofen-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-43	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-44	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-45	piridazin-3-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

21-46	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-47	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-48	pirazin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-49	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-50	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-51	pirimidin-2-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-52	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-53	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-54	pirimidin-4-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-55	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-56	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-57	pirimidin-5-ilo	Me	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-58	tiazol-5-ilo	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-59	tiazol-5-ilo	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-60	tiazol-5-ilo	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	

[0423]

[Tabla 21-3]

Compuesto N.°	R^1	R^2	R^4	R^5	A	Valor de pro pie-dad física
21-61	tiazol-4-ilo	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-62	tiazol-4-ilo	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-63	tiazol-4-ilo	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-64	tiofen-2-ilo	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-65	tiofen-2-ilo	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-66	tiofen-2-ilo	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-67	tiofen-3-ilo	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-68	tiofen-3-ilo	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-69	tiofen-3-ilo	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-70	piridazin-3-ilo	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-71	piridazin-3-ilo	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	

21-72	piridazin-3-ilo	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-73	pirazin-2-ilo	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-74	pirazin-2-ilo	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-75	pirazin-2-ilo	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-76	pirimidin-2-ilo	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-77	pirimidin-2-ilo	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-78	pirimidin-2-ilo	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-79	pirimidin-4-ilo	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-80	pirimidin-4-ilo	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-81	pirimidin-4-ilo	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-82	pirimidin-5-ilo	H	NH_2	Me	SO_2NHMe	
21-83	pirimidin-5-ilo	H	NH_2	Et	SO_2NHMe	
21-84	pirimidin-5-ilo	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHMe	
21-85	Ph	H	NH_2	Me	SO_2NHEt	
21-86	Ph	H	NH_2	Et	SO_2NHEt	
21-87	Ph	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	
21-88	2,6-F_2-Ph	H	NH_2	Me	SO_2NHEt	
21-89	2,6-F_2-Ph	H	NH_2	Et	SO_2NHEt	
21-90	2,6-F_2-Ph	H	NH_2	i-Pr	SO_2NHEt	

[0424] Tabla 22 (En la Tabla 22, * indica datos de ^{1}H-RMN en DMSO-d_6.)

[Tabla 22-1]

Compuesto N.°	Datos de ^{1}H-RMN ($CDCl_3$/TMS, ppm)
1-1	δ 8,47(d, 1H), 8,27(d, 1H), 7,94-7,89(m,1H), 7,86-7,80(m, 1H), 7,54-7,50(m, 1H), 7,40-7,36(m, 2H), 5,47(s, 2H), 4,25(q, 2H), 4,16(s, 3H), 2,74(d, 3H), 1,37(t, 3H)
1-2	δ 8,27(d, 1H), 8,13-8,06(m, 2H), 7,90(s, 1H), 7,81(d, 1H), 7,47-7,34(m, 3H), 4,32-4,26(q, 2H), 4,25-4,18(q, 2H), 3,99(s, 3H), 2,18(s, 3H), 1,37(t, 3H), 1,10(t, 3H)
1-4	δ 8,46(d, 1H), 8,26(d, 1H), 8,03-7,99(m, 2H), 7,79-

	7,73(m, 1H), 7,51–7,43(m, 3H), 5,44(s, 2H), 4,24(q, 2H), 4,10(s, 1H), 2,79(d, 3H), 1,37(t, 3H)
1–8	δ 8,26(d, 1H), 8,20(d, 1H), 8,13–8,10(m, 2H), 7,47–7,39(m, 3H), 5,49(s, 2H), 4,29–4,16(m, 4H), 3,98(s, 3H), 1,36(t, 3H), 1,13(t, 3H)
1–12	δ 8,79(d, 1H), 8,34(d, 1H), 7,93–7,90(m, 1H), 7,53–7,50(m, 1H), 7,38–7,35(m, 2H), 4,44(q, 2H), 3,85(s, 3H), 3,05(s, 3H), 2,32(s, 9H), 2,16(s, 3H), 1,40(t, 3H)
1–18	δ 8,37–8,24(m, 2H), 8,15–8,06(m, 2H), 7,49–7,34(m, 4H), 5,43(s, 2H), 4,47–4,35(m, 1H), 3,77(s, 3H), 2,75(s, 6H), 1,33(d, 6H)
1–20	δ 8,33–8,32(m, 2H), 7,95–7,91(m, 1H), 7,52–7,49(m, 1H), 7,36–7,32(m, 2H), 5,45(s, 2H), 4,47–4,37(m, 1H), 3,82(s, 3H), 2,75(s, 6H), 1,33(d, 3H)
1–21	δ 8,49(d, 1H), 8,28–8,21(m, 2H), 7,91(d, 1H), 7,45–7,39(m, 1H), 7,08–7,04(m, 2H), 5,48(s, 2H), 4,14(s, 3H), 3,96(s, 3H), 3,94(s, 3H), 2,76(d, 3H)
1–22	δ 8,49(d, 1H), 8,27–8,22(m, 2H), 7,91(dd, 1H), 7,45–7,40(m, 1H), 7,08–7,04(m, 2H), 5,45(s, 2H), 4,24(q, 2H), 4,14(s, 3H), 3,96(s, 3H), 2,76(d, 3H), 1,37(t, 3H)
1–28	δ 8,46(d, 1H), 8,27(d, 1H), 8,03–7,99(m, 2H), 7,75(q, 1H), 7,49–7,44(m, 3H), 5,41(s, 2H), 4,49–4,39(m, 1H), 4,10(s, 3H), 2,79(d, 3H), 1,35(d, 6H)
1–32	δ 8,37–8,28(m, 2H), 8,13–8,09(m, 1H), 7,47–7,39(m, 2H), 5,47(s, 2H), 4,23(m, 2H), 3,79(s, 3H), 2,75(s, 6H), 1,36(t, 3H)
1–38	δ 8,46(d, 1H), 8,27(d, 1H), 7,44–7,28(m, 4H), 7,18–7,12(m, 1H), 5,47(s, 2H), 4,28–4,22(m, 2H), 4,14(s, 3H), 2,71(d, 3H), 1,37(t, 3H)
1–39	δ 8,46(d, 1H), 8,27(d, 1H), 7,96–7,93(m, 2H), 7,56(q, 1H), 7,46–7,43(m, 2H), 5,44(s, 2H), 4,28–4,21(q, 2H), 4,08(s, 3H), 2,79(d, 3H), 1,37(t, 3H)

[0425]

[Tabla 22-2]

Compuesto N.°	Datos de 1H-RMN ($CDCl_3$/TMS, ppm)
1-40	δ 8,46(d, 1H), 8,27(d, 1H), 7,96-7,93(m, 2H), 7,56(q, 1H), 7,46-7,43(m, 2H), 5,44(s, 2H), 4,28-4,21(q, 2H), 4,08(s, 3H), 2,79(d, 3H), 1,37(t, 3H)
1-41	δ 8,36-8,30(m, 2H), 7,91(d, 1H), 7,82(d, 1H), 7,44-7,36(m, 1H), 7,13-7,06(m, 1H), 5,43(s, 2H), 4,47-4,38(m, 1H), 3,79(s, 3H), 2,78(s, 6H), 1,33(d, 6H)
1-42	δ 8,33(q, 2H), 7,42-7,33(m, 1H), 7,05-6,99(m, 2H), 5,48(s, 2H), 4,22(q, 2H), 3,84(s, 3H), 2,75(s, 6H), 1,36(t, 3H)
1-53	δ 8,46(d, 1H), 8,26(d, 1H), 7,85-7,77(m, 2H), 5,46(s, 2H), 4,28-4,22(m, 2H),4,13(s, 3H), 2,72(d, 3H), 2,62(s, 3H), 1,37(t, 3H)
1-188	δ 8,85(s, 1H), 8,47-8,40(m, 2H), 8,29-8,26(m, 1H), 7,24-7,17(m, 1H),5,42(brs, 2H), 4,07(s, 1H), 4,01(s, 3H), 2,79(d, 3H)
1-189	δ 8,85(s, 1H), 8,47-8,40(m, 2H), 8,30-8,27(m, 1H), 7,24-7,18(m, 1H), 5,42(brs, 2H), 4,24(q, Hz, 2H), 4,07(s, 3H), 2,79(d, 3H), 1,37(t, 3H)
1-200	δ 8,47-8,44(m, 1H), 8,27-8,24(m, 1H), 7,85(dd, 1H), 7,68(q, 1H), 7,60(dd, 1H), 7,41(dd, 1H), 5,43(brs, 2H), 4,06(s, 3H), 4,00(s, 3H), 2,78(d, 3H)
1-201	δ 8,47-8,42(m, 1H), 8,27-8,23(m, 1H), 7,85(dd, 1H), 7,71-7,59(m, 2H), 7,42-7,38(m, 1H), 5,43(brs, 2H), 4,28-4,21(m, 2H), 4,07-4,05(s, 3H), 2,79-2,75(m, 3H), 1,39-1,33(m, 3H)
1-206	δ 8,48-8,45(m, 1H), 8,29-8,26(m, 1H), 7,97(d, 1H), 7,45(d, 1H), 7,26-7,22(m, 1H), 5,43(brs, 1H), 4,12(s, 3H), 4,01(s, 3H), 2,81(d, 3H)
1-207	δ 8,48-8,45(m, 1H), 8,30-8,27(m, 1H), 7,98-7,97(m, 1H), 7,46-7,45(m, 1H), 7,26-7,23(m, 1H), 5,43(brs,

	2H), 4,25(q, 2H), 4,12(s, 3H), 2,82-2,80(m, 3H), 1,37(t, 3H)
1-211	δ 8,96-8,93(m, 1H), 8,50-8,45(m, 1H), 8,28-8,15(m, 2H), 7,63-7,53(m, 1H), 7,26-7,18(m, 1H), 5,45(brs, 2H), 4,16(s, 3H), 4,00(s, 3H), 2,73(dd, 3H)
1-212	δ 8,97-8,91(m, 1H), 8,47-8,44(m, 1H), 8,29-8,15(m, 2H), 7,61-7,53(m, 1H), 7,26-7,18(m, 1H), 5,47-5,43(brs, 2H), 4,25(q, 2H), 4,17(s, 3H), 2,73(d, 3H), 1,37(t, 3H)
1-213	δ 8,43(d, 1H), 8,23(d, 1H), 7,53-7,47(m, 1H), 5,43(brs, 2H), 4,00-3,99(m, 6H), 3,77(s, 2H), 2,74(d, 3H), 2,14(s, 3H)
1-214	δ 8,44-8,41(d, 1H), 8,26-8,23(d, 1H), 7,53-7,43(m, 1H), 5,43(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 4,00(s, 3H), 3,77(s, 2H), 2,75-2,73(d, 3H), 2,15(s, 3H), 1,37(t, 3H)

[0426]

[Tabla 22-3]

Compuesto N.°	Datos de 1H-RMN ($CDCl_3$/TMS, ppm)
1-215	δ 8,44-8,41(d, 1H), 8,28-8,26(d, 1H), 6,81-6,75(m, 1H), 5,44-5,40(brs, 2H), 4,45(s, 2H), 4,00-3,99(m, 6H), 2,95(s, 3H), 2,75(d, 3H)
1-216	δ 8,43-8,40(d, 1H), 8,27-8,24(d, 1H), 7,18(q, 2H), 5,42(brs, 2H), 4,27-4,20(m, 2H), 4,05(s, 2H), 3,98(s, 3H), 2,72(d, 3H), 2,63(s, 1H), 1,36(t, 3H)
1-217	δ 8,43-8,41(d, 1H), 8,29-8,26(d, 1H), 6,79(q, 1H), 5,42(brs, 2H), 4,45(s, 2H), 4,24(q, 2H), 4,00-3,99(s, 3H), 2,95(s, 3H), 2,75(d, 3H), 1,37(t, 3H)
1-218	δ 8,43(d, 1H), 8,22(d, 1H), 7,83(q, 1H), 5,42(brs, 2H), 4,00-3,98(m, 6H), 2,80-2,71(m, 5H), 1,66(m, 3H), 0,97-0,95(m, 6H)
1-219	δ 8,42(d, 1H), 8,21(d, 1H), 7,94(q, 1H), 5,42(brs, 2H), 4,00-3,99(m, 6H), 3,16-3,08(m, 1H), 2,74-

	2,72(m, 3H), 1,37(d, 6H)
1-220	δ 8,42(d, 1H), 8,22(d, 1H), 7,94(q, 1H), 5,42(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 4,00(s, 3H), 3,16-3,08(m, 1H), 2,74-2,71(m, 3H), 1,38-1,34(m, 9H)
1-221	δ 8,42(d, 1H), 8,21(d, 1H), 7,65(q, 1H), 5,42(brs, 2H), 3,99(m, 6H), 3,78(t, 2H), 3,40(d, 3H), 3,05(t, 2H), 2,72(d, 3H)
1-222	δ 8,42(d, 1H), 8,22(d, 1H), 7,66(q, 1H), 5,42-5,39(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 3,99(s, 3H), 3,78(t, 2H), 3,40-3,39(s, 3H), 3,05(t, 2H), 2,72(d, 3H), 1,36(t, 3H)
1-223	δ 8,42(d, 1H), 8,24(d, 1H), 7,44(q, 1H), 5,42(brs, 2H), 4,58(s, 2H), 4,27-4,21(m, 2H), 4,02(s, 3H), 3,46(s, 3H), 2,7(d, 3H), 1,39-1,34(t, 3H)
1-224	δ 8,42(d, 1H), 8,25(d, 1H), 7,44(q, 1H), 5,38(brs, 2H), 4,58(s, 2H), 4,48-4,38(m, 1H), 4,03-4,02(s, 3H), 3,46(s, 3H), 2,73(d, 3H), 1,34(d, 6H)
1-227	δ 8,57(s, 1H), 8,47-8,45(m, 1H), 8,28-8,25(m, 1H), 7,92-7,88(m, 1H), 7,66-7,61(m, 2H), 5,44(s, 2H), 4,24(q, 2H), 4,13(s, 3H), 2,81(d, 3H), 2,41(s, 3H), 1,37(t, 3H)
1-228*	δ 8,56-8,54(m, 1H), 8,46-8,43(m, 1H), 8,24-8,21(m, 1H), 8,01-7,98(m, 1H), 7,91-7,86(m, 1H), 7,78(dd, 1H), 6,34(brs, 2H), 4,02(s, 3H), 3,87(s, 3H), 2,63(d, 3H), 2,37(s, 3H)
1-229	δ 8,77-8,74(m, 1H), 8,49-8,46(m, 1H), 8,28-8,25(m, 1H), 8,05-8,00(m, 1H), 7,86-7,79(m, 1H), 7,60(q, 1H), 7,40-7,34(m, 1H), 5,44(brs, 2H), 4,14(s, 3H), 4,00(s, 3H), 2,82(d, 3H)
1-234	δ 8,45(dd, 1H), 8,26(dd, 1H), 7,64(dd, 1H), 7,41-7,37(m, 1H), 7,13(dd, 1H), 6,95-6,93(m, 1H), 5,45-5,40(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 4,06(m, 3H), 2,80-2,77(m, 3H), 1,37(t, 3H)
1-236	δ 8,44-8,42(m, 1H), 8,23-8,20(m, 1H), 7,87(q, 1H),

	5,43(brs, 2H), 4,00-3,99(m, 6H), 2,77-2,71(m, 5H), 1,83-1,76(m, 2H), 1,02(t, 3H)

[0427]

[Tabla 22-4]

Compuesto N.°	Datos de 1H-RMN ($CDCl_3$/TMS, ppm)
1-237	δ 8,44-8,41(m, 1H), 8,24-8,21(m, 1H), 7,87(q, 1H), 5,43(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 4,00(s, 3H), 2,77-2,71(m, 5H), 1,83-1,77(m, 2H), 1,36(t, 3H), 1,02(t, 3H)
1-248	δ 8,47-8,43(m, 1H), 8,27-8,24(m, 1H), 7,64(d, 1H), 7,39-7,36(m, 2H), 7,14-7,10(m, 1H), 5,43(brs, 2H), 4,37(q, 2H), 4,00(s, 3H), 2,79(d, 3H), 1,51(t, 3H)
1-249	δ 8,46-8,43(m, 1H), 8,28-8,25(m, 1H), 7,65-7,63(m, 1H), 7,39-7,36(m, 2H), 7,12(dd, 1H), 5,42(brs, 2H), 4,37(q, 2H), 4,24(q, 2H), 2,79(d, 3H), 1,51(t, 3H), 1,37(t, 3H)
1-269	δ 8,47-8,44(m, 1H), 8,27-8,24(m, 1H), 8,02(d, 2H), 7,59(q, 1H), 7,50-7,43(m, 3H), 5,44(brs, 2H), 4,43-4,36(m, 2H), 4,00(s, 3H), 2,80(d, 3H), 1,53(t, 3H)
1-270	δ 8,47-8,44(m, 1H), 8,28-8,25(m, 1H), 8,04-8,00(m, 2H), 7,60(q, 1H), 7,49-7,42(m, 3H), 5,44(brs, 2H), 4,40(q, 2H), 4,24(q, 2H), 2,79(d, 3H), 1,57(t, 3H), 1,37(t, 3H)
1-284	δ 8,44-8,41(m, 1H), 8,23-8,20(m, 1H), 7,84(q, 1H), 5,42(brs, 2H), 4,00-3,98(m, 6H), 2,79-2,71(m, 5H), 1,79-1,70(m, 2H), 1,48-1,38(m, 2H), 0,96(t, 3H)
1-285	δ 8,43-8,41(m, 1H), 8,23-8,21(m, 1H), 7,85(q, 1H), 5,43(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 3,98(s, 3H), 2,79-2,71(m, 5H), 1,80-1,70(m, 2H), 1,39-1,34(m, 5H), 0,96(t, 3H)
1-287	δ 8,48-8,45(m, 1H), 8,30-8,27(m, 1H), 7,75(s, 1H), 7,09-6,99(m, 1H), 5,42(brs, 2H), 4,10(s, 3H), 4,00(s, 3H), 2,81-2,79(m, 3H)

1-288	δ 8,72(s, 1H), 8,48-8,45(m, 1H), 8,28-8,25(m, 1H), 7,35(q, 1H), 5,43(brs, 2H), 4,08(s, 3H), 4,01(s, 3H), 2,82-2,76(m, 6H)
1-289	δ 8,72(s, 1H), 8,47-8,44(m, 1H), 8,29-8,26(m, 1H), 7,38-7,32(m, 1H), 5,43(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 4,08(s, 3H), 2,83-2,76(m, 6H), 1,40-1,34(t, 3H)
1-290	δ 8,72(s, 1H), 8,46-8,43(m, 1H), 8,30-8,27(m, 1H), 7,38-7,33(m, 1H), 5,48(brs, 2H), 4,49-4,39(m, 1H), 4,09(s, 3H), 2,83-2,76(m, 6H), 1,36-1,33(d, 6H)
1-299	δ 8,41(d, 1H), 8,23(d, 1H), 7,81(q, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,47-4,38(m, 1H), 4,31(q, 2H), 3,19-3,07(m, 1H), 2,73(d, 3H), 1,45-1,44(t, 3H), 1,35(m, 12H)
1-358	δ 8,43 (d, 1H), 8,21 (d, 1H), 8,04 (q, 1H), 5,43 (brs, 2H), 4,00 – 3,99 (m, 6H), 2,73 (d, 3H), 1,41 (s, 9H).
1-359	δ 8,42 (d, 1H), 8,21 (d, 1H), 8,04 (q, 1H), 5,43 (brs, 2H), 4,23 (q, 2H), 4,00 (s, 3H), 2,72 (d, 3H), 1,42 – 1,34 (m, 12H).

[0428]

[Tabla 22-5]

Compuesto N.°	Datos de 1H-RMN ($CDCl_3$/TMS, ppm)
2-4	δ 8,13-8,05(m, 2H), 7,63(s, 1H), 7,58-7,54(m, 1H), 7,30(s, 1H), 7,24(d, 1H), 7,07-7,03(m, 1H), 5,49(s, 2H), 4,28-4,18(m, 4H), 3,85(s, 3H), 2,37(s, 3H), 1,36(t, 3H), 1,15(t, 3H)
2-6	δ 8,14-8,06(m, 2H), 8,03-7,96(m,1H), 7,74-7,68(m, 1H), 7,59-7,52(m,1H), 7,40-7,30(m,2H), 5,50(s, 2H), 4,27-4,16(m, 4H), 1,36(t, 3H), 1,15(t, 3H)
2-8	δ 8,12-8,06(m, 1H), 7,81-7,75(m, 2H), 7,58-7,52(m, 1H), 7,34-7,30(m, 1H), 5,39(s, 2H), 4,23-4,14(m, 4H), 3,70(s, 3H), 1,35(t, 3H), 1,17(t, 3H)
2-15	δ 8,45(d, 1H), 8,18(d, 1H), 8,02(dt, 1H), 7,81(s, 1H), 7,45(dd, 1H), 7,34-7,27(m, 1H), 7,22-7,17(m, 1H), 5,32(s, 2H), 4,65(q, 2H), 3,85(s, 3H), 2,32(s,

	3H), 2,30(s, 3H), 1,38(t, 3H)
2-17	δ 8,27-8,19(m, 2H), 7,86(d, 1H), 7,65(s, 1H), 7,40(d, 1H), 7,23-7,15(m, 2H), 4,45(q, 2H), 4,27(q, 2H), 4,06(s, 3H), 2,50(s, 3H), 1,45(t, 3H), 1,10(t, 3H)
2-22	δ 8,07(d, 1H), 8,01(d, 1H), 7,80-7,76(m, 2H), 7,40-7,34(m, 2H), 7,32(s, 1H), 7,25-7,22(m, 1H), 5,59(s, 2H), 4,51(q, 2H), 3,94(s, 3H), 3,80(s, 3H)
2-32*	δ 8,46(d, 1H), 8,17(d, 1H), 8,09-8,04(m, 1H), 7,44-7,39(m, 1H), 7,30-7,25(m, 1H), 7,19-7,13(m, 1H), 4,34(q, 2H), 3,77(s, 3H), 3,70(s, 3H), 2,32(s, 3H), 1,37(t, 3H)
2-37	δ 8,13-8,02(m, 2H), 7,02(s, 1H), 5,65-5,42(m, 3H), 4,29-4,17(m, 4H), 4,15-4,10(m, 2H), 3,75(s, 3H), 2,20-2,14(m, 2H), 1,93-1,86(m, 2H), 1,35(t, 3H), 1,20(t, 3H)
3-1	δ 8,49(d, 1H), 8,27(d, 1H), 8,02-7,98(m, 1H), 7,29-7,19(m, 2H), 6,72-6,67(m, 1H), 5,37(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,81(d, 3H), 2,67(s, 3H), 1,37(t, 3H)
3-3	δ 8,48(d, 1H), 8,28(d, 1H), 8,04-8,01(m, 2H), 7,49-7,45(m, 3H), 6,34(q, 1H), 5,39(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,79(d, 3H), 2,61(s, 3H), 1,37(t, 3H)
3-4	δ 8,48(d, 1H), 8,27(d, 1H), 8,18(dd, 1H), 7,50(dd, 1H) 7,42-7,35(m, 2H), 6,74(q, 1H), 5,41(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,75(d, 3H), 2,65(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-6	δ 8,48(d, 1H), 8,28(d, 1H), 8,20-8,17(m, 1H), 7,26-7,23(m, 1H), 7,15-7,10(m, 1H), 6,65(q, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,74(d, 3H), 2,64(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-8	δ 8,49(d, 1H), 8,28(d, 1H), 7,46-7,38(m, 1H), 7,10-7,03(m, 2H), 6,32-6,28(m, 1H), 5,41(brs, 2H), 4,00(s, 3H), 2,76(d, 3H), 2,65(s, 3H)
3-9	δ 8,54(d, 1H), 8,34(d, 1H), 8,10-8,07(m, 2H), 7,46-7,41(m, 3H), 5,45(br.s, 2H), 4,23(q, 2H), 3,46(s,

	3H), 2,52(s, 3H), 1,34(t, 3H)

[0429]

[Tabla 22-6]

Compuesto N.°	Datos de 1H-RMN ($CDCl_3$/TMS, ppm)
3-12	δ 8,49(d, 1H), 8,25(d, 1H), 8,26-8,21(m, 1H), 7,46-7,40(m, 1H), 7,31-7,27(m, 1H) 7,22-7,16(m, 1H), 6,90-6,85(m, 1H), 5,38(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,80(d, 3H), 2,68(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-13	δ 8,48(d, 1H), 8,30(d, 1H), 7,43-7,32(m, 2H), 7,17-7,12(m, 1H), 6,04(q, 1H), 5,43(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,71(d, 3H), 2,63(s, 3H), 1,37(s, 3H)
3-14	δ 8,48(d, 1H), 8,30(d, 1H), 6,87-6,80(m, 1H), 6,23-6,19(m, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,75(d, 3H), 2,63(s, 3H), 1,36(s, 3H)
3-17	δ 8,49(d, 1H), 8,27(d, 1H), 8,19-8,17(m, 1H), 7,51-7,49(m, 1H), 7,43-7,36(m, 2H), 6,74(q, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,00(s, 3H), 2,75(d, 3H), 2,65(s, 3H)
3-18	δ 8,49(d, 1H), 8,22(d, 1H), 8,15(d, 1H), 7,53(q, 1H),7,4-7,39(m, 1H), 7,12-7,04(m, 2H), 5,40(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 3,95(s, 3H), 2,79(d, 3H), 2,68(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-114	δ 8,43(d, 1H), 8,22(d, 1H), 6,70(q, 1H), 5,37(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,78(tt, 1H) 2,73(d, 3H), 2,54(s, 3H), 2,13-2,09(m, 2H), 1,85(dt, 2H), 1,77-1,72(m, 1H), 1,59-1,49(m, 2H), 1,46-1,36(m, 2H), 1,34-1,26(m, 1H)
3-115	δ 8,69(d, 1H), 8,50(d, 1H), 8,25(d, 1H), 7,85-7,81(m, 1H), 7,38-7,35(m, 1H), 6,90(q, 1H), 5,44(brs, 2H), 4,00(s, 3H), 2,84(d, 3H), 2,68(s, 3H)
3-118	δ 8,73(s, 1H), 8,63(d, 1H), 8,48(d, 1H), 8,32(d, 1H), 8,16(d, 1H), 6,47(q, 1H), 5,35(brs, 2H), 4,48-4,39(m, 1H), 2,76(d, 3H), 2,64(s, 3H), 1,34(d, 6H)
3-122	δ 8,74(brs, 2H), 8,49(d, 1H), 8,33(d, 1H), 7,90(d,

	2H), 6,00(q, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,25(q, 2H), 2,80(d, 3H), 2,60(s, 3H), 1,37(t, 3H)
3-123	δ 9,25(s, 1H), 8,69(dd, 1H), 8,48(d, 1H), 8,33(dt, 1H), 8,31(d, 1H), 7,44-7,41(m, 1H), 6,09(q, 1H), 5,39(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,79(d, 3H), 2,61(s, 3H), 1,37(t, 3H)
3-124	δ 8,69(dd, 1H), 8,49(d, 1H), 8,28(d, 1H), 7,87(dd, 1H), 7,37-7,33(m, 1H), 6,75(q, 1H), 5,39(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,77(d, 3H), 2,69(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-125	δ 8,69(brs, 1H), 8,50(d, 1H), 8,27(d, 1H), 7,87-7,85(m, 1H), 7,37-7,33(m, 1H), 6,76(q, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,00(s, 3H), 2,78(d, 3H), 2,69(s, 3H)
3-127	δ 8,42(d, 1H), 8,23(d, 1H), 6,69(q, 1H), 5,34(brs, 2H), 4,45-4,43(m, 1H), 2,78(tt, 1H), 2,73(d, 3H), 2,54(s, 3H), 2,13-2,09(m, 2H), 1,85(dt, 2H), 1,76-1,71(m, 1H), 1,59-1,49(m, 2H), 1,46-1,36(m, 2H), 1,33(d, 6H), 1,33-1,26(m, 1H)

[0430]

[Tabla 22-7]

Compuesto N.°	Datos de 1H-RMN ($CDCl_3$/TMS, ppm)
3-129	δ 8,43(d, 1H), 8,22(d, 1H), 6,65(q, 1H), 5,37(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 3,22(tt, 1H), 2,73(d, 3H), 2,54(s, 3H), 2,16-2,07(m, 2H), 1,91-1,68(m, 6H), 1,36(t, 3H)
3-130	δ 8,42(d, 1H), 8,23(d, 1H), 6,65(q, 1H), 5,34(brs, 2H), 4,47-4,37(m, 1H), 3,22(tt, 1H), 2,73(d, 3H), 2,54(s, 3H), 2,16-2,08(m, 2H), 1,91-1,68(m, 6H), 1,33(d, 6H)
3-151	δ 8,43(d, 1H), 8,25(d, 1H), 6,53(q, 1H), 5,35(brs, 2H), 4,42(quin, 1H), 4,10-4,05(m, 2H), 3,56(dt, 2H), 3,01-3,09(m, 1H), 2,74(d, 3H), 2,55(s, 3H), 2,03-2,00(m, 2H), 1,95-1,85(m, 2H), 1,33(d, 6H)
3-168	δ 8,86(s, 1H), 8,47(s, 1H), 8,47(d, 1H), 8,30(d, 1H), 6,00(q, 1H), 5,37(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,79(d,

	3H), 2,59(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-171	δ 8,89(d, 1H), 8,48(d, 1H), 8,25(d, 1H), 8,07(d, 1H), 6,79(q, 1H), 5,41(s, 3H), 5,35(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,82(d, 3H), 2,67(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-174	δ 9,19(s, 1H), 8,47(d, 1H), 8,35(d, 1H), 5,58(q, 1H), 5,37(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,80(d, 3H), 2,59(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-176	δ 8,47(d, 1H), 8,26(d, 1H), 7,70(d, 1H), 7,39(d, 1H), 7,13(t, 1H)6,27(q, 1H), 5,38(brs, 2H), 4,00(s, 3H), 2,80(d, 3H), 2,60(s, 3H)
3-177	δ 8,46(d, 1H), 8,27(d, 1H), 7,70(dd, 1H), 7,39(dd, 1H), 7,13(dd, 1H)6,27(q, 1H), 5,37(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,80(d, 3H), 2,60(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-179	δ 8,47(d, 1H), 8,27(d, 1H), 7,96(dd, 1H), 7,54(dd, 1H), 7,41(dd, 1H)6,32(q, 1H), 5,38(brs, 2H), 4,00(s, 3H), 2,78(d, 3H), 2,59(s, 3H)
3-180	δ 8,46(d, 1H), 8,27(d, 1H), 7,96(dd, 1H), 7,54(dd, 1H), 7,41(dd, 1H)6,32(q, 1H), 5,38(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,78(d, 3H), 2,59(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-190	δ 8,43(d, 1H), 8,23(d, 1H), 6,60(q, 1H), 5,37(bs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,75(s, 3H), 2,74(q, 2H), 2,54(s, 3H), 1,82(m, 2H), 1,36(t, 3H), 1,03(t, 3H)
3-191	δ 8,53(d, 1H), 8,33(d, 1H), 7,72(d, 1H), 7,37(dd, 1H), 7,12(dd, 1H)5,41(brs, 1H), 4,24(q, 2H), 3,47(s, 3H), 2,53(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-192	δ 8,47(d, 1H), 8,27(d, 1H), 7,28(d, 1H), 6,93(d, 1H), 6,41(q, 1H), 5,37(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,76(d, 3H), 2,59(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-193	δ 8,47(d, 1H), 8,27(d, 1H), 7,39(d, 1H), 7,03(d, 1H), 6,78(q, 1H), 5,36(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,77(d, 3H), 2,61(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-194	δ 8,48(d, 1H), 8,20(d, 1H), 8,00(d, 1H), 7,45(q, 1H), 6,39(d, 1H)5,36(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 3,94(s, 3H), 2,80(d, 3H), 2,67(s, 3H), 1,36(t, 3H)

3-195	δ 8,47(d, 1H), 8,27(d, 1H), 6,89(s, 1H), 6,64(q, 1H), 5,36(brs, 2H), 4,00(s, 3H), 2,76(d, 3H), 2,59(s, 3H)

[0431]

[Tabla 22-8]

Compuesto N.°	Datos de 1H-RMN ($CDCl_3$/TMS, ppm)
3-196	δ 8,46(d, 1H), 8,27(d, 1H), 7,01(s, 1H), 6,64(q, 1H), 5,36(brs, 2H), 4,00(s, 3H), 2,76(d, 3H), 2,59(s, 3H)
3-197	δ 8,48(d, 1H), 8,25(d, 1H), 7,29(dd, 1H), 6,91(d, 1H), 6,72(q, 1H), 5,36(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,79(d, 3H), 2,65(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-201	δ 8,48(d, 1H), 8,26(d, 1H), 7,39(d, 1H), 7,03(d, 1H), 6,78(q, 1H), 5,37(brs, 2H), 4,00(s, 3H), 2,77(d, 3H), 2,61(s, 3H)
3-204	δ 8,43(d, 1H), 8,22(d, 1H), 6,58(q, 1H), 5,37(bs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,76(t, 2H), 2,74(d, 3H), 2,54(s, 3H), 1,77(m, 2H), 1,44(m, 2H), 1,36(t, 3H), 0,97(t, 3H)
3-207	δ 8,43(d, 1H), 8,24(d, 1H), 6,48(q, 1H), 5,36(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,74(d, 3H), 2,52(s, 3H), 2,44(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-229	δ 8,47(d, 1H), 8,26(d, 1H), 7,72(d, 1H), 7,38(d, 1H), 7,13(dd, 1H), 6,25(q, 1H), 5,39(brs, 2H), 4,00(s, 3H), 2,91(q, 2H), 2,79(d, 3H), 1,33(t, 3H)
3-230	δ 8,46(d, 1H), 8,27(d, 1H), 7,72(dd, 1H), 7,38(dd, 1H), 7,13(dd, 1H), 6,25(q, 1H), 5,38(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,91(q, 2H), 2,79(d, 3H), 1,36(t, 3H), 1,33(t, 3H)
3-250	δ 8,48(d, 1H), 8,28(d, 1H), 8,05-8,02(m, 2H), 7,49-7,43(m, 3H), 6,31(q, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,00(s, 3H), 2,91(q, 2H), 2,78(d, 3H), 1,35(t, 3H)
3-251	δ 8,47(d, 1H), 8,28(d, 1H), 8,05-8,03(m, 2H), 7,49-7,43(m, 3H), 6,31(q, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,24(q, 3H), 2,91(q, 2H), 2,78(d, 3H), 1,36(t, 3H), 1,35(t,

	3H)
3-265	δ 8,46(d, 1H), 8,30(d, 1H), 7,51(s, 1H), 5,88(q, 1H), 5,38(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,79(d, 3H), 2,57(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-267	δ 8,47(d, 1H), 8,28(d, 1H), 7,38(d, 1H), 7,09(d, 1H), 6,74(q, 1H), 5,36(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,77(d, 3H), 2,60(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-268	δ 8,86(d, 1H), 8,47(d, 1H), 8,47(d, 1H), 8,30(d, 1H), 6,00(q, 1H), 5,37(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,79(d, 3H), 2,59(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-269	δ 8,47(d, 1H), 8,25(d, 1H), 6,81(dd, 1H), 6,56(s, 1H), 6,32(q, 1H), 5,35(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,78(d, 3H), 2,62(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-270	δ 8,47(d, 1H), 8,34(d, 1H), 5,74(q, 1H), 5,38(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 3,03(s, 3H), 2,78(d, 3H), 2,59(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-271	δ 8,50(d, 1H), 8,28(d, 1H), 6,62(q, 1H), 5,39(brs, 2H), 4,24(q, 3H), 3,02(s, 3H), 2,82(d, 3H), 2,69(s, 3H), 1,37(t, 3H)
3-272	δ 8,46(d, 1H), 8,27(d, 1H), 8,06(dd, 1H), 7,51(dd, 1H), 6,78(dd, 1H), 6,28(q, 1H), 5,38(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,77(d, 3H), 2,57(s, 3H), 1,36(t, 3H)

[0432]

[Tabla 22-9]

Compuesto N.°	Datos de 1H-RMN ($CDCl_3$/TMS, ppm)
3-273	δ 8,54(d, 1H), 8,47(d, 1H), 8,32(d, 1H), 7,75(d, 1H), 5,86(q, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,79(d, 3H), 2,60(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-274	δ 8,47(d, 1H), 8,26(d, 1H), 7,54(dd, 1H), 7,04(dd, 1H), 6,54(dd, 1H), 6,47(q, 1H), 5,37(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,80(d, 3H), 2,62(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-279	δ 8,47(d, 1H), 8,31(d, 1H), 7,53(d, 1H), 6,75(d, 1H),

	5,99(q, 1H), 5,38(brs, 2H), 4,24(s, 3H), 4,24(q, 2H), 2,75(d, 3H), 2,58(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-286	δ 11,36(s, 1H), 8,38(d, 1H), 8,22(d, 1H), 7,76(dd, 2H),7,49-7,40(m, 3H), 6,61(q, 1H), 5,49(brs, 2H), 4,22(q, 2H), 2,75(d, 3H), 1,36(t, 3H)
3-318	δ 8,56(d, 1H), 8,31(d, 1H), 7,80(dd, 1H), 7,44(dd, 1H), 7,15(dd, 1H), 6,02(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 3,67(s, 3H), 3,27(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-321	δ 8,50(d, 1H), 8,36(d, 1H), 7,79(dd, 1H), 7,45(dd, 1H), 7,15(dd, 1H), 5,58(brs, 2H), 4,22(q, 2H), 3,47(s, 3H), 3,45(s, 3H), 1,35(t, 3H)
3-324	δ 8,55(d, 1H), 8,32(d, 1H), 7,78(d, 1H), 7,38(d, 1H), 7,13(t, 1H), 6,55(dd, 1H), 6,53(dd, 1H), 5,70(dd, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 3,52(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-377	δ 8,53(d, 1H), 8,33(d, 1H), 7,73(m, 1H), 7,35(m, 1H), 7,11(m, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 3,47(s, 3H), 2,83(q, 2H), 1,35(t, 3H), 1,32(t, 3H)
3-378	δ 8,54(d, 1H), 8,36(d, 1H), 7,79(d, 1H), 7,43(d, 1H), 7,15(dd, 1H), 6,92(t, 1H), 5,44(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 3,50(s, 3H), 1,36(t, 3H)
3-379	δ 8,56(d, 1H), 8,34(d, 1H), 7,82(dd, 1H), 7,39(dd, 1H), 7,14(dd, 1H), 5,34(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 3,42(s, 3H), 1,35(t, 3H)
4-1	δ 8,54(d, 1H), 8,26(d, 1H), 7,80-7,77(m, 2H), 7,42-7,38(m, 2H), 7,35-7,33(m, 1H), 6,61(s, 1H), 5,43(br.s, 2H), 4,23(q, 2H), 3,80(s, 3H), 2,36(s, 3H), 1,36(t, 3H)
4-2	δ 8,54(d, 1H), 8,26(d, 1H), 7,74-7,72(m, 1H), 7,48-7,46(m, 1H), 7,30-7,28(m, 2H), 6,77(s, 1H), 5,44(br.s, 2H), 4,23(q, 2H), 3,46(s, 3H), 2,39(s, 3H), 1,36(t, 3H)
4-5	δ 8,46(d, 1H), 8,18(d, 1H), 7,67-7,65(m, 1H), 7,49-7,47(m, 1H), 7,36-7,29(m, 2H), 6,91(q, 1H), 6,69(s,

	1H), 5,42(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,70(d, 3H), 2,47(s, 3H), 1,36(t, 3H)
4-6	δ 8,46(d, 1H), 8,20(d, 1H), 7,72-7,69(m, 1H), 7,45-7,40(m, 2H), 7,38-7,34(m, 1H), 6,79(q, 1H), 6,60(s, 1H), 5,41(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,77(d, 3H), 2,43(s, 3H), 1,37(t, 3H)

[0433]

[Tabla 22-10]

Compuesto N.°	Datos de 1H-RMN ($CDCl_3$/TMS, ppm)
4-7	δ 8,46(d, 1H), 8,19(d, 1H), 7,60(d, 1H), 7,50(d, 1H), 7,32(dd, 1H), 6,77(q, 1H), 6,67(s, 1H), 5,41(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,70(d, 3H), 2,46(s, 3H), 1,37(t, 3H)
4-8	δ 8,46(d, 1H), 8,18(d, 1H), 7,64(d, 2H), 6,96(d, 2H), 6,88(q, 1H), 6,53(s, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 3,86(s, 3H), 2,77(d, 3H), 2,42(s, 3H), 1,36(t, 3H)
4-10	δ 8,47(d, 1H), 8,22(d, 1H), 7,81(d, 1H), 7,77(d, 1H), 7,68-7,64(m, 1H), 7,48-7,37(m, 1H), 6,78(s, 1H), 6,65(q, 1H), 5,41(brs, 2H), 4,00(s, 3H), 2,77(d, 2H), 2,43(s, 2H)
4-11	δ 8,45(d, 1H), 8,21(d, 1H), 7,66(d, 2H), 7,40(d, 2H), 6,60(s, 1H), 6,57(q, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,77(q, 2H), 2,76(d, 3H), 1,36(t, 3H), 1,26(t, 3H)
4-14	δ 8,46(d, 1H), 8,21(d, 1H), 7,65-7,62(m, 2H), 7,41-7,38(m, 2H), 6,61(q, 1H), 6,58(s, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,76(d, 3H), 2,41(s, 3H), 1,36(t, 3H)
4-15	δ 8,45(d, 1H), 8,17(d, 1H), 7,51(d, 1H), 7,32-7,25(m, 3H), 6,94(q, 1H), 6,42(s, 1H), 5,43(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,68(d, 3H), 2,47(s, 3H), 2,46(s, 3H), 1,36(t, 3H)

4-16	δ 8,46(d, 1H), 8,22(d, 1H), 7,70-7,69(m, 1H), 7,60-7,58(m, 1H), 7,38-7,31(m, 2H), 6,60(s, 1H), 6,56(q, 1H), 5,41(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,78(d, 3H), 2,41(s, 3H), 1,36(t, 3H)
4-18	δ 8,38(d, 1H), 7,96(d, 1H), 7,80-7,78(m, 2H), 7,42-7,39(m, 2H), 7,34-7,30(m, 1H), 6,41(s, 1H), 5,15(br.s, 2H), 4,18(q, 4H), 3,34(s, 3H), 1,47(t, 3H), 1,32(t, 3H)
4-19	δ 8,49(d, 1H), 8,23(d, 1H), 7,79-7,76(m, 2H), 7,68-7,65(m, 1H), 7,34-7,30(m, 2H), 6,05(s, 1H), 5,46(br.s, 2H), 4,18(q, 2H), 3,94(s, 3H), 3,36(s, 3H), 1,32(t, 3H)
4-20	δ 12,0(br.s, 1H), 8,26(d, 1H), 7,81(d, 1H), 7,55-7,52(m, 2H), 7,32-7,27(m, 3H), 6,34(s, 1H), 5,16(br.s, 2H), 4,14(q, 2H), 3,21(s, 3H), 1,27(t, 3H)
4-21	δ 8,30(d, 1H), 7,87(d, 1H), 7,55-7,50(m, 2H), 7,39-7,34(m, 2H), 6,54(s, 1H), 5,63(q, 1H), 5,19(brs, 2H), 4,17(q, 2H), 2,73(d, 3H), 1,31(t, 3H)
4-22	δ 8,30(d, 1H), 7,86(d, 1H), 7,54(d, 2H), 7,47-7,36(m, 3H), 6,35(s, 1H), 6,12(brd, 1H), 5,16(brs, 2H), 4,16(q, 2H), 2,70(d, 3H), 1,30(t, 3H)
4-23	δ 8,48(d, 1H), 8,11(d, 1H), 7,64(d, 2H), 7,42(d, 2H), 7,12(q, 1H), 6,58(s, 1H), 5,54(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,77(d, 3H), 2,53(s, 3H), 1,36(t, 3H)

[0434]

[Tabla 22-11]

Compuesto N.°	Datos de 1H-RMN ($CDCl_3$/TMS, ppm)
4-24	δ 8,53(d, 1H), 8,18(d, 1H), 7,68(d, 2H), 7,48(d, 2H), 7,34(s, 1H), 6,91(q, 1H), 5,89(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,99(s, 3H), 2,80(d, 3H), 1,36(t, 3H)
4-25	δ 8,45(d, 1H), 8,29(d, 1H), 7,68(d, 2H), 7,45(d, 2H), 7,39(s, 1H), 5,60(q, 1H), 5,51(brs, 2H), 4,23(q,

	2H), 3,19(s, 3H), 2,76(d, 3H), 1,36(t, 3H)
4-26	δ 8,30(d, 1H), 7,87(d, 1H), 7,62-7,58(m, 1H), 7,41-7,35(m, 1H), 7,27-7,19(m, 2H), 6,54(s, 1H), 5,50(q, 1H), 5,16(brs, 2H), 4,17(q, 2H), 2,74(d, 3H), 1,31(t, 3H)
4-52	δ 8,43(d, 1H), 8,24(d, 1H), 7,60-7,55(m, 1H), 7,38-7,21(m, 3H), 6,61(m, 1H), 6,48(q, 1H), 5,36(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,74(d, 3H), 2,52(m, 3H), 2,44(m, 3H), 1,36(t, 3H)
4-77	δ 8,66-8,64(m, 1H), 8,49(d, 1H), 8,17(d, 1H), 7,78-7,73(m, 1H), 7,70-7,68(m, 1H), 7,31(q, 1H), 7,28-7,24(m, 1H), 6,80(s, 1H), 5,41(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,84(d, 3H), 2,51(s, 3H), 1,36(t, 3H)
4-115	δ 8,37(d, 1H), 8,06(d, 1H), 7,58(q, 1H), 5,78(s, 1H), 5,34(brs, 2H), 4,40(quin, 2H), 3,18(t, 4H), 2,69(d, 3H), 2,33(s, 3H), 1,70-1,56(m, 6H), 1,32(d, 6H)
4-135	δ 8,45(d, 1H), 8,19(d, 1H), 7,55(t, 1H), 7,39-7,38(m, 2H), 6,83(q, 1H), 6,51(s, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,26-4,20(m, 2H), 3,21(s, 3H), 2,77(d, 3H), 2,41(s, 3H), 1,38-1,34(m, 3H)
4-149	δ 8,48-8,45(m, 1H), 8,28-8,25(m, 1H), 6,76(d, 1H), 6,31-6,24(m, 1H), 5,38(brs, 2H), 4,27-4,20(m, 2H), 2,80-2,77(m, 3H), 2,55(s, 3H), 1,39-1,34(m, 3H)
4-150	δ 8,52(d, 1H), 8,29(d, 1H), 6,78(s, 1H), 5,39(brs, 2H), 4,39(q, 2H), 4,24(q, 2H), 3,51(s, 3H), 2,36(s, 3H), 2,59(s, 3H), 1,38(t, 3H), 1,36(t, 3H)
4-151	δ 8,42(d, 1H), 8,21(d, 1H), 6,44(s, 1H), 6,17(q, 1H), 5,33(brs, 2H), 4,42(quin, 2H), 2,75(d, 3H), 2,35(s, 3H), 1,33(d, 6H)
4-152	δ 8,43(d, 1H), 8,19(d, 1H), 6,44(s, 1H), 6,17(q, 1H), 5,33(brs, 2H), 3,99(s, 3H), 2,75(d, 3H), 2,35(s, 3H)
4-153	δ 8,46(d, 1H), 8,22(d, 1H), 6,76(s, 1H), 6,68(q, 1H), 5,34(brs, 2H), 4,42(quin, 1H), 4,38(q, 2H), 2,79(d, 3H), 2,46(s, 3H), 1,39(t, 3H), 1,34(d, 6H)

4-155	δ 8,45(d, 1H), 8,17-8,14(m, 1H), 7,58(q, 2H), 7,09-6,99(m, 1H), 6,77-6,74(m, 2H), 6,51(s, 1H), 5,45(brs, 2H), 4,26-4,18(m, 2H), 3,01-3,00(m, 3H), 2,78-2,76(m, 3H), 2,69-2,67(m, 3H), 2,42(m, 3H), 1,37(d, 3H)
4-156	δ 8,47-8,44(m, 1H), 8,21-8,18(m, 1H), 7,23-7,17(m, 2H), 6,88-6,85(m, 1H), 6,76(q, 1H), 6,51(s, 1H), 6,01(s, 2H), 5,40(brs, 2H), 4,26-4,19(m, 2H), 2,77(d, 3H), 2,41(s, 3H), 1,36(t, 8H)

[0435]

[Tabla 22-12]

Compuesto N.°	Datos de 1H-RMN ($CDCl_3$/TMS, ppm)
4-157	δ 8,48-8,41(m, 2H), 8,21(dd, 1H), 7,66(t, 1H), 7,24-7,19(m, 1H), 6,70-6,67(m, 1H), 6,18(q, 1H), 5,40-5,35(brs, 2H), 4,27-4,20(m, 2H), 2,77-2,74(m, 3H), 2,43(s, 3H), 1,39-1,33(t, 3H)
4-158	δ 8,49-8,46(m, 1H), 8,24-8,13(m, 3H), 7,32-7,26(m, 1H), 6,75(m, 1H), 6,66-6,61(m, 1H), 5,39(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,78(d, 3H), 2,44(s, 3H), 1,37(t, 3H)
4-159	δ 8,48-8,45(m, 1H), 8,26-8,24(m, 1H), 8,00-7,92(m, 2H), 7,67-7,63(m, 1H), 7,57-7,52(m, 1H), 6,62(s, 1H), 6,35(q, 1H), 5,42-5,39(m, 2H), 4,27-4,20(m, 2H), 2,78(d, 3H), 2,41(s, 3H), 1,39-1,34(m, 3H)
4-160	δ 8,77(d, 1H), 8,48-8,45(m, 1H), 8,26-8,23(m, 1H), 7,95(dd, 1H), 7,42-7,39(m, 1H), 6,62(d, 1H), 6,34(q, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,76(d, 3H), 2,41-2,41(m, 3H), 1,36(t, 3H)
4-161	δ 9,33(d, 1H), 8,50-8,42(m, 2H), 8,27-8,24(m, 1H), 8,16-8,08(m, 1H), 7,90-7,87(m, 1H), 7,78-7,71(m, 1H), 7,63-7,56(m, 1H), 6,79-6,78(m, 1H), 6,52(q, 1H), 5,42(brs, 2H), 4,25(q, 2H), 2,81-2,79(m, 3H), 2,46(s, 3H), 1,37(t, 3H)
4-162	δ 8,49-8,46(m, 1H), 8,22-8,19(m, 1H), 7,83-7,77(m,

	2H), 7,58(s, 1H), 7,39-7,32(m, 2H), 6,67-6,66(m, 1H), 6,63-6,60(m, 1H), 5,42-5,38(m, 2H), 4,27-4,19(m, 2H), 2,85(d, 3H), 2,45(s, 3H), 1,39-1,34(m, 3H)
4-163	δ 8,48-8,45(m, 1H), 8,24-8,22(m, 1H), 8,10(d, 2H), 7,80-7,77(m, 2H), 6,67(s, 1H), 6,55(q, 1H), 5,45(brs, 2H), 4,25-4,18(m, 2H), 3,95-3,94(m, 3H), 2,78(d, 3H), 1,37-1,32(m, 3H)
4-164	δ 8,47(d, 1H), 8,23-8,20(m, 1H), 7,43-7,40(m, 1H), 7,18-7,13(m, 1H), 7,06(dd, 1H), 6,91(q, 1H), 6,72(s, 1H), 5,42-5,36(m, 2H), 4,27-4,19(m, 2H), 2,81(d, 3H), 2,45(s, 3H), 1,39-1,34(m, 3H)
4-165	δ 8,47(d, 1H), 8,18(d, 1H), 6,91-6,86(m, 1H), 5,37(brs, 2H), 4,38(q, 2H), 4,26-4,20(m, 2H), 2,79(d, 3H), 2,37(s, 3H), 2,30(s, 3H), 1,42-1,34(m, 6H)
4-166	δ 8,29(d, 1H), 7,87(d, 1H), 6,67(s, 1H), 5,12(brs, 2H), 4,40-4,33(m, 2H), 4,19-4,14(m, 5H), 2,74-2,72(m, 3H), 1,40-1,30(m, 6H)
4-167	δ 8,48-8,40(m, 1H), 8,22-8,18(m, 1H), 7,77-7,70(m, 4H), 6,72(q, 1H), 5,52(brs, 2H), 4,25-4,19(m, 4H), 3,23(s, 3H), 2,71-2,69(m, 3H), 1,39-1,32(m, 6H)
4-168	δ 8,43(d, 1H), 8,12(d, 1H), 7,67(q, 1H), 6,40(s, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,22(q, 2H), 3,85(t, 3H), 2,77(d, 3H), 2,60(t, 2H), 2,43(s, 3H), 2,21(quin, 2H), 1,35(t, 3H)
4-169	δ 8,45(d, 1H), 8,18(d, 1H), 7,59(q, 1H), 5,37(brs, 2H), 4,22(q, 2H), 4,09(t, 2H), 2,75(d, 3H), 2,57(t, 2H), 2,22(quin, 2H), 1,36(t, 3H)

[0436]

[Tabla 22-13]

Compuesto N.°	Datos de 1H-RMN ($CDCl_3$/TMS, ppm)
4-170	δ 8,46-8,43(m, 1H), 8,17-8,14(m, 1H), 7,54-7,51(m,

	2H), 7,45-7,41(m, 2H), 7,00-6,96(m, 1H), 5,41(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,70(d, 3H), 2,60(q, 2H), 2,38(s, 3H), 1,39-1,34(m, 3H), 1,19-1,14(m, 3H)
4-171	δ 8,43-8,40(m, 1H), 8,18-8,15(m, 1H), 6,65(q, 1H), 5,36(brs, 2H), 4,25-4,19(m, 2H), 2,73(d, 3H), 2,38(s, 3H), 2,31(s, 3H), 1,36(t, 3H)
4-172	δ 8,48-8,45(m, 1H), 8,24-8,21(m, 1H), 7,80-7,75(m, 2H), 7,47-7,43(m, 2H), 6,42(q, 1H), 5,38(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,73(d, 3H), 2,43(s, 3H), 1,36(t, 3H)
4-173	δ 8,47-8,44(m, 1H), 8,13-8,10(m, 1H), 7,62-7,59(m, 2H), 7,44-7,41(m, 2H), 7,17(d, 1H), 5,38(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,85(m, 2H), 2,74(m, 5H), 1,90-1,84(m, 4H), 1,36(t, 3H)
4-174	δ 8,44-8,42(m, 1H), 8,17-8,15(m, 1H), 7,43(m, 4H), 6,85(s, 1H), 5,42(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 3,07-2,99(m, 1H), 2,65(d, 3H), 2,42(s, 3H), 1,37(t, 3H), 1,27(d, 6H)
4-175	δ 8,47-8,44(m, 1H), 8,20-8,17(m, 1H), 7,64-7,61(m, 2H), 7,29-7,25(m, 2H), 6,88-6,85(m, 1H), 6,57(s, 1H), 5,43-5,38(m, 2H), 4,23(q, 2H), 2,77(d, 3H), 2,57-2,50(m, 1H), 2,43-2,42(m, 3H), 1,94-1,82(m, 4H), 1,78-1,73(m, 1H), 1,39-1,34(m, 8H)
4-176	δ 8,45-8,43(m, 1H), 8,16-8,14(m, 1H), 7,32-7,19(m, 4H), 6,84-6,83(m, 1H), 5,98(q, 1H), 4,84(brs, 2H), 4,16(q, 2H), 2,82-2,80(m, 3H), 1,33-1,29(m, 3H)
4-177	δ 8,48-8,45(m, 1H), 8,27-8,25(m, 1H), 7,99-7,96(m, 2H), 7,78-7,75(m, 2H), 6,19(q, 1H), 5,38(brs, 2H), 4,27-4,21(m, 2H), 2,73(d, 3H), 2,44(s, 3H), 1,37(t, 3H)
4-178	δ 8,47-8,45(m, 1H), 8,24-8,21(m, 1H), 7,78-7,75(m, 2H), 7,48-7,43(m, 2H), 6,44(q, 1H), 5,48(brs, 2H), 4,27-4,21(m, 2H), 2,72(d, 3H), 2,44(s, 3H), 1,39-1,34(m, 3H)
4-179	δ 8,47-8,44(m, 1H), 8,21-8,18(m, 1H), 7,64-7,61(m,

	2H), 7,32-7,28(m, 2H), 6,75(m, 1H), 6,58(s, 1H), 5,45(brs, 2H), 4,25-4,18(m, 2H), 2,78-2,75(m, 3H), 2,52(s, 3H), 2,4(s, 3H), 1,38-1,32(m, 3H)
4-180	δ 8,45-8,42(m, 1H), 8,15-8,12(m, 1H), 7,17(q, 1H), 6,26(s, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,26-4,19(m, 2H), 4,09-3,96(m, 4H), 2,75(d, 3H), 2,42(d, 3H), 1,38-1,33(m, 3H)
4-181	δ 8,45(d, 1H), 8,13(d, 1H), 6,77(d, 1H), 6,28-6,25(m, 1H), 5,36(s, 2H), 4,27-4,20(m, 2H), 4,13-4,05(m, 2H), 3,96-3,90(m, 2H), 2,79-2,77(m, 2H), 2,56-2,54(m, 3H), 2,51-2,49(m, 3H), 2,41-2,38(m, 3H), 1,39-1,34(m, 3H)

[0437]

[Tabla 22-14]

Compuesto N.°	Datos de 1H-RMN ($CDCl_3$/TMS, ppm)
4-182	δ 8,46-8,44(m, 1H), 8,19-8,16(m, 1H), 7,15(d, 1H), 6,85(d, 1H), 6,70(q, 1H), 6,49(s, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,81-2,79(m, 3H), 2,42(s, 3H), 2,29(s, 3H), 1,38-1,34(m, 3H)
4-183	δ 8,47-8,44(m, 1H), 8,25-8,22(m, 1H), 7,52(d, 1H), 6,51-6,48(m, 2H), 6,37(q, 1H), 5,41(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 4,06(s, 3H), 2,72(d, 3H), 2,42(s, 3H), 1,37(t, 3H)
4-184	δ 8,48-8,45(m, 1H), 8,25-8,22(m, 1H), 7,85-7,81(m, 2H), 7,71-7,67(m, 2H), 6,66(s, 1H), 6,51(q, 1H), 5,41(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,77(d, 3H), 2,42(s, 3H), 1,36(t, 3H)
4-185	δ 8,48-8,45(m, 1H), 8,17-8,14(m, 1H), 7,61(dd, 1H), 7,39-7,28(m, 2H), 7,06-6,99(m, 2H), 6,63(s, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 3,92(s, 3H), 2,74(d, 3H), 2,45(s, 3H), 1,36(t, 3H)
4-186	δ 8,48-8,45(m, 1H), 8,21-8,18(m, 1H), 6,88-6,86(m, 2H), 6,84-6,75(m, 1H), 6,58-6,57(m, 1H), 6,48(t,

	1H), 5,42(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 3,84-3,82(m, 6H), 2,76(d, 3H), 2,43(s, 3H), 1,36(t, 3H)
4-187	δ 8,48-8,45(m, 1H), 8,21-8,18(m, 1H), 7,40-7,28(m, 3H), 6,94-6,90(m, 1H), 6,80(q, 1H), 6,60(s, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 3,85(s, 3H), 2,77(d, 3H), 2,43(s, 3H), 1,39-1,34(m, 3H)
4-188	δ 8,48-8,45(m, 1H), 8,22-8,19(m, 1H), 7,74-7,66(m, 1H), 6,98-6,90(m, 2H), 6,75(t, 1H), 6,65(s, 1H), 5,40(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,76(d, 3H), 2,43(s, 3H), 1,36(t, 3H)
4-237	δ 8,42(d, 1H), 8,16(d, 1H), 6,72(q, 1H), 6,66(dd, 1H), 6,41(s, 1H), 5,78(dd, 1H), 5,41(dd, 1H), 5,38(bs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,73(s, 3H), 2,37(s, 3H), 1,36(t, 3H)
4-238	δ 8,41(d, 1H), 8,13(d, 1H), 7,10(q, 1H), 6,11(s, 1H), 5,39(bs, 2H), 4,22(q, 2H), 2,72(d, 3H), 2,69(q, 2H), 2,36(s, 3H), 1,36(t, 3H), 1,28(t, 3H)
4-239	δ 8,47(d, 1H), 8,22(d, 1H), 7,50(m, 1H), 7,41(m, 1H), 7,21(m, 1H), 6,66(d, 1H), 6,42(s, 1H), 6,28(dt, 1H), 5,41(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,70(d, 3H), 2,39(s, 3H), 1,36(t, 3H)
4-243	δ 8,45(d, 1H), 8,18(d, 1H), 7,87(d, 1H), 7,71(d, 1H), 6,78(q, 1H), 6,48(s, 1H), 6,44(t, 1H), 5,41(brs, 2H), 4,21(q, 3H), 2,78(d, 3H), 2,44(s, 3H), 1,35(t, 3H)
4-247	δ 8,41(d, 1H), 8,19(d, 1H), 7,57-7,55(m, 4H), 7,48-7,38(m, 6H), 6,41(s, 1H), 6,20(q, 1H), 5,38(brs, 2H), 4,21(q, 3H), 2,72(d, 3H), 2,34(s, 3H), 1,36(t, 3H)

[0438]

[Tabla 22-15]

Compuesto N.°	Datos de 1H-RMN ($CDCl_3$/TMS, ppm)
4-249	δ 8,41(d, 1H), 8,14(d, 1H), 7,06(q, 1H), 6,14(s, 1H),

	5,38(bs, 2H), 4,22(q, 2H), 2,73(q, 2H), 2,69(q, 2H), 1,36(t, 3H), 1,29(t, 3H), 1,19(t, 3H)
4-251	δ 8,46(d, 1H), 8,22(d, 1H), 7,74(d, 2H), 7,28(d, 2H), 6,60(q, 1H), 6,59(s, 1H), 5,40(bs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,77(d, 3H), 2,42(s, 3H), 1,36(t, 3H)
4-303	δ 8,41(d,1H), 8,13(d,1H), 7,06(q, 1H), 6,14(s, 1H), 5,38(bs, 2H), 3,98(s, 3H), 2,73(q,2H), 2,71(s,3H), 2,69(q, 2H), 1,29(t,3H), 1,19(t, 3H)
4-304	δ 8,40 (d, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,08 (q, 1H), 5,76 (s, 1H), 5,46 (brs, 2H), 4,25-4,12 (m, 4H), 2,71 (d, 3H), 2,34 (s, 3H), 1,45-1,33 (m, 6H).
4-305	δ 8,41 (d, 1H), 8,12 (d, 1H), 6,93 (q, 1H), 5,80 (s, 1H), 5,37 (brs, 2H), 4,32-4,27 (m, 2H), 4,25-4,18 (m, 2H), 3,75 – 3,70 (m, 2H), 3,43 (s, 3H), 2,70 (d, 3H), 2,33 (s, 3H), 1,35 (t, 3H).
4-306	δ 8,40 (d, 1H), 8,12 (d, 1H), 6,96 (q, 1H), 5,78 (s, 1H), 5,37 (brs, 2H), 4,26-4,19 (m, 2H), 4,09-3,99 (m, 2H), 3,94-3,85 (m, 2H), 3,80 – 3,66 (m, 2H), 2,79 – 2,69 (m, 4H), 2,34 (s, 3H), 2,16-2,04 (m, 1H), 1,76-1,65 (m, 1H), 1,36 (t, 3H).
4-307	δ 8,41 (d,1H), 8,11 (d, 1H), 6,95 (q, 1H), 5,79 (s, 1H), 5,37 (brs, 2H), 4,27-4,16 (m, 4H), 4,13-4,07 (m, 1H), 3,96-3,88 (m, 1H), 3,84-3,76 (m, 1H), 2,70(d, 3H), 2,33 (d, 3H), 2,12-1,88 (m, 3H), 1,81-1,70 (m, 1H), 1,35 (t, 3H).
4-308	δ 8,40 (d, 1H), 8,11 (d, 1H), 7,04 (q, 1H), 5,79 (s, 1H), 5,37 (brs, 2H), 4,22 (q, 2H), 3,93 (d, 2H), 2,71 (d, 3H), 2,34 (s, 3H), 1,36 (t, 3H), 0,68 – 0,62 (m, 2H), 0,39 – 0,32 (m, 2H).
4-309	δ 8,42 (d, 1H), 8,16 (d, 1H), 6,52 (q, 1H), 6,24 – 5,94 (m, 1H), 5,82 (s, 1H), 5,37 (brs, 2H), 4,37 – 4,28 (m, 2H), 4,23 (q, 2H), 2,72 (d, 3H), 2,32 (s, 3H), 1,35 (t, 3H).
4-310	8,43-8,38 (m, 1H), 8,30-8,24 (m, 2H), 8,20-8,17(d,

	1H), 7,34-7,29(m, 2H), 6,16(q, 1H), 5,99(s, 1H), 5,39(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,59(d, 3H), 2,42(s, 3H), 1,37(t, 3H)
5-1	δ 8,17-8,12 (m, 1H), 8,00-7,92 (m, 2H), 7,76-7,70 (m, 1H), 7,47-7,40 (m, 2H), 7,26-7,21 (m, 1H), 5,42 (s, 2H), 4,22 (q, 2H), 3,66 (s, 3H), 3,14 (s, 3H), 2,95 (s, 3H), 1,36 (t, 3H)
5-19	δ 8,43(d, 1H), 8,29(d, 1H), 7,96-7,90(m, 2H), 7,78-7,72(m, 1H), 7,56-7,50(m, 1H), 5,84(q, 1H), 5,45(s, 2H), 4,24(q, 2H), 3,42(s, 3H), 2,71(d, 3H), 1,37(t, 3H)
6-1	δ 8,44 (d, 1H), 8,24 (d, 1H), 8,02-7,95 (m, 2H), 7,49-7,40 (m, 2H), 7,26-7,21 (m, 1H), 4,36 (q, 2H), 3,40 (s, 3H), 2,29 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,38 (t, 3H)
7-1	δ 8,06 (d, 1H), 8,01(d, 1H), 7,91-7,81 (m, 2H), 7,44-7,38 (m, 3H), 5,53 (s, 2H), 4,21 (q, 2H), 4,18 (q, 2H), 2,73 (s, 3H), 1,35 (t, 3H), 1,08 (t, 3H)

[0439]

[Tabla 22-16]

Compuesto N.°	Datos de 1H-RMN ($CDCl_3$/TMS, ppm)
10-17	δ 8,43(d, 1H), 8,11(d, 1H), 7,41-7,27(m, 6H), 5,52(bs, 2H), 5,30(s, 2H), 4,22(q, 2H), 3,28(s, 3H), 2,12(s, 3H), 1,35(t, 3H)
10-18	δ 8,50(d, 1H), 8,17(d, 1H), 7,91(s, 1H), 7,80(t, 1H), 7,32-7,20(m, 3H), 5,54(bs, 2H), 4,23(q, 2H), 3,55(s, 3H), 2,23(s, 3H), 1,37(t, 3H)
10-19	δ 8,46(d, 1H), 8,30(s, 1H), 8,19(d, 1H), 8,01(d, 2H), 7,59(t, 1H), 7,47(t, 2H), 5,50(bs, 2H), 4,23(q, 2H), 3,15(s, 3H), 2,22(s, 3H), 1,36(t, 3H)
10-20	δ 8,37(d, 1H), 8,15(d, 1H), 7,83(s, 1H), 7,70(d, 2H), 7,44(t, 2H), 7,26(t, 1H), 5,52(bs, 2H), 4,22(q, 2H), 2,63(s, 6H), 2,10(s, 3H), 1,35(t, 3H)
11-2	δ 8,47(d, 1H), 8,15(d, 1H), 8,08-8,06(m, 3H), 7,95-

	7,92(m, 2H), 6,72(q, 1H), 5,50(brs, 2H), 4,24(q, 2H), 2,77(d, 3H), 2,63(s, 3H), 1,42(t, 3H)
11-122	δ 8,78-8,77(m, 1H), 8,49(d, 1H), 8,25(d, 1H), 8,20-8,18(m, 1H), 7,57-7,54(m, 1H), 5,51(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 3,40(s, 3H), 2,50(s, 3H), 1,36(t, 3H)
17-4	δ 7,98(d, 1H),7,96-7,92(m, 2H), 7,75(dd, 1H), 7,71(d, 1H), 7,47-7,41(m, 3H), 4,83(brs, 2H), 4,19(q, 2H), 3,75(s, 3H), 2,27(s, 3H), 1,33(t, 2H)
17-5	δ 7,99-7,95(m, 2H),7,88(d, 1H), 7,79(dd, 1H), 7,76(s, 1H), 7,73(dd, 1H),7,49-7,43(m, 3H), 4,83(brs, 2H), 4,19(q, 2H), 3,79(s, 3H), 1,33(t, 2H)
17-6	δ 7,98-7,92(m, 3H), 7,83-7,79(m, 2H), 7,59(s, 1H), 7,46-7,40(m, 2H), 7,35(dd, 1H), 4,85(brs, 2H), 4,21(q, 2H),4,20(q, 2H), 1,35(t, 3H), 1,09(t, 3H)
19-28	δ 9,44(s, 1H), 7,08(s, 1H), 5,54(brs, 2H), 4,33(q, 2H), 3,93(s, 3H), 3,78(s, 3H), 1,39-1,34(m, 3H)
19-29	δ 9,48(s, 1H), 7,76-7,71(m, 3H), 7,45-7,37(m, 3H), 5,56(brs, 2H), 4,34(q, 2H), 4,01(s, 3H), 3,93(s, 3H), 1,38(t, 3H)
19-30	δ 9,47(s, 1H), 8,03-8,00(m, 1H), 7,72(s, 1H), 7,30-7,27(m, 1H), 7,06-6,98(m, 2H), 5,54(brs, 2H), 4,35(q, 2H), 4,02-3,93(m, 9H), 1,38(t, 3H)
20-20	δ 8,49(d, 1H), 8,20(d, 1H), 7,64(ddd, 1H), 7,50-7,45(m, 1H), 7,32-7,20(m, 2H), 6,66(q, 1H), 5,54(brs, 2H), 4,23(q, 2H), 2,78(d, 3H), 2,52(d, 3H), 1,36(t, 3H)

[0440] Ejemplos de plantas útiles para las que se puede utilizar el compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno de la presente invención o una sal del mismo incluyen, pero no se limitan particularmente a cereales (por ejemplo, arroz, cebada, trigo, centeno, avena, maíz, etc.), legumbres (por ejemplo, soja, judías azuki, habas, guisantes, alubias, maníes, etc.), árboles frutales y frutas (por ejemplo, manzanas, cítricos, peras, uvas, melocotones, ciruelas, cerezas, nueces, castañas,

almendras, plátanos, etc.), hortalizas de hoja y de fruto (por ejemplo, coles, tomates, espinacas, brócolis, lechugas, cebollas, cebollas verdes (cebollino y cebolla de Gales), pimientos verdes, berenjenas, frutillas, cultivos de pimiento, quimbombó, cebollino chino, etc.), hortalizas de raíz (por ejemplo, zanahorias, papas, batatas, taros, rábanos japoneses, nabos, raíces de loto, raíces de bardana, ajos, cebolletas chinas, etc.), cultivos para transformación (por ejemplo, algodón, cáñamo, remolacha, lúpulo, caña de azúcar, remolacha azucarera, aceitunas, caucho, café, tabaco, té, etc.), calabazas (por ejemplo, calabazas japonesas, pepinos, sandías, melones dulces orientales, melones, etc.), pastos (por ejemplo, hierba de huerto, sorgo, fleo de los prados, trébol, alfalfa, etc.), hierba de césped (por ejemplo, hierba de césped coreana, hierba doblada, etc.), cultivos de especias y aromáticas y cultivos ornamentales (por ejemplo, lavanda, romero, tomillo, perejil, pimienta, jengibre, etc.), plantas ornamentales de flor (crisantemo, rosa, clavel, orquídea, tulipán, lirio, etc.), árboles de jardín (ginkgo, cerezo, etc.), plantas ornamentales de jardín (ginkgo, cerezo, etc.), ginkgo, cerezo, aucuba japonesa, etc.) y árboles forestales (por ejemplo, Abies sachalinensis, Picea jezoensis, pino, cedro amarillo, cedro japonés, ciprés hinoki, eucalipto, etc.).

[0441] Las “plantas” antes mencionadas también incluyen plantas dotadas de tolerancia a herbicidas mediante una técnica clásica de mejora o una técnica de recombinación de genes. Ejemplos de dicha tolerancia a herbicidas incluyen la tolerancia a inhibidores de la HPPD, como el isoxaflutol; inhibidores de la ALS, como el imazetapir y el tifensulfurón-metilo; inhibidores de la EPSP sintasa, como el glifosato; inhibidores de la glutamina sintetasa, como el glufosinato; inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa, como el setoxidim; u otros herbicidas, como el bromoxinil, el dicamba y el 2,4-D.

[0442] Entre los ejemplos de plantas dotadas de tolerancia a herbicidas mediante una técnica de mejora clásica se incluyen variedades de colza, trigo, girasol y arroz tolerantes a la familia de herbicidas inhibidores de ALS de imidazolinona, como el imazetapir. Dicha variedad de arroz se vende bajo el nombre comercial de Clearfield (marca registrada). También se incluye una variedad de soja dotada de tolerancia a los herbicidas inhibidores de ALS de la familia de la sulfonil urea, como el tifensulfurón-metilo, mediante una técnica de mejora clásica, y que se vende con el nombre comercial de soja STS. También se incluyen las plantas dotadas de tolerancia a los inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa, como los herbicidas de triona oxima y los herbicidas de ácido ariloxifenoxipropiónico, mediante una técnica de cultivo clásica, por ejemplo, el maíz SR y similares.

Las plantas dotadas de tolerancia a los inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa se describen en Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 87, 7175-7179 (1990), y similares. Además, los mutantes de acetil-CoA carboxilasa resistentes a los inhibidores de acetil-CoA carboxilasa se describen en Weed Science, 53, 728-746 (2005), y similares, e introduciendo el gen de dicho mutante de acetil-CoA carboxilasa en plantas mediante una técnica de recombinación génica, o introduciendo una mutación que confiera resistencia a la acetil-CoA carboxilasa de las plantas, se pueden diseñar plantas tolerantes a los inhibidores de acetil-CoA carboxilasa. Otra posibilidad es introducir en las células vegetales un ácido nucleico que provoque una mutación por sustitución de bases (un ejemplo típico de esta técnica es la quimeraplastia (Gura T. 1999. Reparación de los errores ortográficos del genoma. Science 285: 316-318)) para permitir la mutación por sustitución específica de sitio en los aminoácidos codificados por un gen de acetil-CoA carboxilasa, un gen ALS o similar de plantas, se pueden diseñar plantas tolerantes a inhibidores de acetil-CoA carboxilasa,

inhibidores ALS o similares. El compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno de la presente invención o una sal del mismo puede utilizarse también para estas plantas. El compuesto de la presente invención no hace daño a estas plantas útiles.

[0443] Ejemplos de malezas que pueden ser controladas por el compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno de la presente invención o una sal del mismo incluyen géneros de dicotiledóneas tales como *Ipomoea*, *Lindernia*, *Sesbania*, *Abutilon*, *Matricaria*, *Rorippa*, *Urtica*, *Lamium*, *Xanthium*, *Sinapis*, *Rotala*, *Veronica*, *Papaver*, *Chenopodium*, *Trifolium*, *Portulaca*, *Viola*, *Pharbitis*, *Galeopsis*, *Datura*, *Solanum*, *Capsella*, *Cirsium*, *Sonchus*, *Galinsoga*, *Stellaria*, *Senecio*, *Amaranthus*, *Ambrosia*, *Kochia*, *Lamium*, *Leipidium*, *Polygonum*, *Galium*, *Centaurea y Artemisia*.

[0444] Ejemplos de malezas que pueden ser controladas por el compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno de la presente invención o una sal del mismo incluyen géneros monocotiledóneos tales como *Poa*, *Bolboschoenus*, *Festuca*, *Setaria*, *Eleusine*, *Sagittaria*, *Agropyron*, *Ischaemum*, *Cyperus*, *Avena*, *Bromus*, *Panicum*, *Cynodon*, *Monochoria*, *Alopecurus*, *Paspalum*, *Commelina*, *Fimbristylis*, *Lolium*, *Brachiaria*, *Agrostis*, *Eleocharis*, *Echinochloa esculenta*, *Scirpus*, *Schoenoplectus*, *Digitaria*, y *Sorghum*.

[0445] Otros ejemplos de malezas que pueden ser controladas por el compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno de la presente invención o una sal del mismo incluyen *Spirogyra* sp., *Amaranthus retroflexus*, *Amaranthus viridis*, *Setaria faberi*, *Leersia japonica*, *Leptochloa chinensis*, *Lindernia angustifolia*, *Lindernia procumbens*, *Dopatrium junceum*, *Ipomoea hederacea*, *Lindernia dubia*, *Sida spinosa*, *Polygonum pensylvanicum*, *Sesbania exaltata*, *Geranium carolinense*, *Chenopodium ambrosioides*, *Conyza bonariensis*, *Setaria italica*, *Amaranthus powellii*, *Polygonum cuspidatum*, *Abutilon theophrasti*, *Matricaria perforata*, *Polygonum longisetum*, *Veronica polita*, *Echinochloa crus-galli*, *Amaranthus lividus*,

Solanum nigrum, *Schoenoplectus juncoides* (Roxb.) Palla, *Bromus catharticus*, *Murdannia keisak*, *Bolboschoenus fluviatilis*, *Scirpus maritimus*, *Bromus tectorum*, *Sagittaria pygmaea* Miq, *Rumex obtusifolius*, *Leersia oryzoides* (L.) Sw., *Setaria viridis*, *Cassia obtusifolia*, *Conyza sumatrensis*, *Veronica persica*, *Spirodela polyrhiza*, *Xanthium canadens*, *Coreopsis lanceolata*, *Panicum dichotomiflorum*, *Asclepias syriaca*, *Euphorbia maculata*, *Plantago asiatica*, *Rudbeckia laciniata*, *Amaranthus palmeri*, *Avena sativa*, *Xanthium strumarium*, *Avena sterilis*, *Eleusine indica*, *Sagittaria trifolia*, *Erodium cicutarium*, *Cerastium glomeratum*, *Matricaria matricarioides*, *Matricaria chamomilla*, *Vicia angustifolia*, *Bromus secalinus*, *Avena fatua*, *Rotala indica* Koehne, *Rumex japonicus*, *Paspalum distichum*, *Bromus remotiflorus*, *Cyperus esculentus*, *Galium kinuta*, *Setaria glauca*, *Pueraria lobata*, *Eleocharis kuroguwai* Ohwi, *Sagittaria trifolia* Caerulea, *Ambrosia trifida*, *Hydrilla verticillata*, *Bolboschoenus maritimus* (L.) Palla, *Chrysanthemum segetum*, *Cyperus iria*, *Monochoria vaginalis*, *Echinochloa colona*, *Alisma plantago-aquatica*, *Oryza sativa*, *Polygonum lapathifolium*, *Eleusine coracana*, *Schoenoplectus nipponicus*, *Cyperus malaccensis*, *Agropyron repens*, *Sorghum vulgare*, *Apera spica-venti*, *Chenopodium album*, *Trifolium repens*, *Datura stramonium*, *Equisetum arvense*, *Poa annua*, *Bromus japonicus*, *Alopecurus aequalis*, *Portulaca oleracea*, *Solidago altissima*, *Sorghum halepense*, *Brassica juncea*, *Taraxacum officinale*, *Convolvulus arvensis*, *Oenanthe javanica*, *Polygonum convolvulus*, *Echinochloa oryzicola* Vasing, *Ischaemum rugosum*, *Veronica arvensis*, *Cyperus difformis* L., *Amaranthus rudis*, *Phleum pratense*, *Ludwigia prostrata* Roxburgh, *Commelina communis*, *Panicum texanum*, *Euphorbia helioscopia*, *Festuca parvigluma*, *Rumex crispus*, *Capsella bursa-pastoris*, *Euphorbia pseudochamaesyce*, *Brachiaria plantaginea*, *Lolium multiflorum*, *Cirsium japonicum*, *Alopecurus myosuroides*, *Sinapis arvensis*, *Senecio vulgaris*, *Galinsoga ciliata*,

Amaranthus tricolor, *Stellaria media*, *Cyperus papyrus*, *Cyperus rotundus*, *Amaranthus spinosus*, *Polygonum persicaria*, *Senecio cannabifolius*, *Cyperus flaccidus*, *Papaver rhoeas*, *Helianthus annuus*, *Lamium purpureum*, *Kyllinga gracillima*, *Ammannia multiflora*, *Erigeron canadensis*, *Potamogeton distinctus* A. Benn, *Amaranthus tuberculatus*, *Viola arvensis*, *Cirsium purpuratum*, *Ambrosia artemisiifolia*, *Schoenoplectus tabernaemontani*, *Veronica hederaefolia*, *Alopecurus myosuroides*, *Desmodium tortuosum*, *Plantago lanceolata*, *Kochia scoparia*, *Lolium rigidum*, *Ammannia coccinea*, *Lolium perenne*, *Scirpus juncoides* Roxburgh, *Lamium amplexicaule*, *Najas graminea*, *Amaranthus hybridus*, *Eleocharis acicularis* L., *Portulaca grandiflora*, *Ipomoea lacunosa*, *Ipomoea purpurea*, *Ipomoea hederacea* var. *integriuscula*, *Commelina bengharensis*, *Monochoria korsakowii*, *Cyperus serotinus* Rottboel, *Elatine triandra* Schk, *Digitaria ciliaris*, *Digitaria sanguinalis*, *Sorghum bicolor*, *Galium aparine*, *Artemisia princeps*, *Viola tricolor*, *Raphanus raphanistrum*, *Myosotis arvensis*, y *Alisma canaliculatum*. El compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno de la presente invención o una sal del mismo inhibe el crecimiento de estas malezas.

[0446] Cuando se utiliza el compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno de la presente invención o una sal del mismo, se formula comúnmente en una forma conveniente para su aplicación, que se prepara mediante el método habitual para preparar formulaciones agroquímicas.

Es decir, el compuesto representado por la fórmula general (1) de la presente invención o una sal del mismo y un portador inactivo apropiado, y si es necesario un adyuvante, se mezclan en una proporción apropiada, y mediante el paso de disolución, separación, suspensión, mezcla, impregnación, adsorción y/o adhesión, se formulan en una forma apropiada para su aplicación, como un concentrado en suspensión, un concentrado emulsionable, un concentrado soluble, un polvo humectable, un gránulo

dispersable en agua, un gránulo, un polvo, un comprimido y un envase.

[0447] La composición (herbicida agrícola u hortícola) de la presente invención puede contener opcionalmente un aditivo utilizado habitualmente para formulaciones agroquímicas o herbicidas agrícolas u hortícolas además del ingrediente activo. Entre los ejemplos de aditivos se incluyen portadores tales como portadores sólidos o líquidos, tensioactivos, dispersantes, agentes humectantes, aglutinantes, adherentes, espesantes, colorantes, esparcidores, agentes adherentes/esparcidores, agentes anticongelantes, agentes antiaglomerantes, desintegrantes y agentes estabilizadores. En caso necesario, también pueden utilizarse como aditivos conservantes, fragmentos de plantas, etc. Uno de estos aditivos puede utilizarse solo, y también dos o más de ellos en combinación.

[0448] Entre los ejemplos de portadores sólidos se incluyen minerales naturales, como cuarzo, arcilla, caolinita, pirofilita, sericita, talco, bentonita, arcilla ácida, atapulgita, zeolita y diatomita; sales inorgánicas, como carbonato cálcico, sulfato amónico, sulfato sódico y cloruro potásico; portadores sólidos orgánicos, como ácido silícico sintético, silicatos sintéticos, almidón, celulosa y polvos vegetales (por ejemplo, serrín, cáscara de coco, mazorca de maíz, tallo de tabaco, etc.); soportes plásticos, como polietileno, polipropileno y cloruro de polivinilideno; urea; materiales inorgánicos huecos; materiales plásticos huecos; y sílice pirogénica (carbón blanco). Uno de ellos puede utilizarse solo, y también dos o más de ellos pueden utilizarse en combinación.

[0449] Ejemplos del portador líquido son los alcoholes, incluidos los alcoholes monohídricos, como metanol, etanol, propanol, isopropanol y butanol, y los alcoholes polihídricos, como etilenglicol, dietilenglicol, propilenglicol, hexilenglicol, polietilenglicol, polipropilenglicol y glicerina; compuestos de poliol, como éter de propilenglicol;

cetonas, como la acetona, la metiletilcetona, la metilisobutilcetona, la diisobutilcetona y la ciclohexanona; éteres, como el éter etílico, el dioxano, el éter monoetilado de etilenglicol, el éter dipropílico y el tetrahidrofurano; hidrocarburos alifáticos, como la parafina normal, nafteno, isoparafina, querosén y aceite mineral; hidrocarburos aromáticos, como benceno, tolueno, xileno, nafta disolvente y alquilnaftaleno; hidrocarburos halogenados, como diclorometano, cloroformo y tetracloruro de carbono; ésteres, como acetato de etilo, ftalato de diisopropilo, ftalato de dibutilo, ftalato de dioctilo y adipato de dimetilo; lactonas, como gamma-butirolactona; amidas, como N,N-dimetilformamida, N,N-dietilformamida, N,N-dimetilacetamida y N-alquilpirrolidinona; nitrilos, como acetonitrilo; compuestos de azufre, como dimetilsulfóxido; aceites vegetales, como aceite de soja, aceite de colza, aceite de semilla de algodón y aceite de ricino; y agua. Uno de ellos puede utilizarse solo, y también dos o más de ellos pueden utilizarse en combinación.

[0450] Entre los tensioactivos ejemplares utilizados como dispersantes, humectantes, esparcidores, adherentes, etc. incluyen tensioactivos no iónicos, como el éster de ácido graso de sorbitano, el éster de ácido graso de sorbitano polioxietilenado, el éster de ácido graso de sacarosa, el éster de ácido graso de polioxietileno, el éster de ácido resínico de polioxietileno, el diéster de ácido graso de polioxietileno, polioxietileno alquil éter, polioxietileno alquil aril éter, polioxietileno alquil fenil éter, polioxietileno dialquil fenil éter, polioxietileno alquil fenil éter-condensados de formaldehído, copolímeros en bloque de polioxietileno-polioxipropileno, polímeros en bloque de poliestireno-polioxietileno, éter copolímero en bloque de alquilpolioxietileno-polipropileno, alquilamina de polioxietileno, amida de ácido graso de polioxietileno, bis(éter de fenilo) de ácido graso de polioxietileno, éter de

polialquilbencilfenilo, polioxialquileno estireno fenil éter, acetileno diol, polioxialquileno acetileno diol añadido, silicona de tipo éter polioxietileno, silicona de tipo éster, fluorotensioactivos, aceite de ricino polioxietileno y aceite de ricino hidrogenado polioxietileno; tensioactivos aniónicos, tales como alquilsulfatos, polioxietilen alquil éter sulfatos, polioxietilen alquil fenil éter sulfatos, polioxietilen estiril fenil éter sulfatos, alquilbencenosulfonatos, alquilaril sulfonatos, lignosulfonatos, alquil sulfosuccinatos, naftalenosulfonatos, alquilnaftalenosulfonatos, sales de condensados de ácido naftalenosulfónico–formaldehído, sales de condensados de ácido alquilnaftalenosulfónico–formaldehído, sales de ácidos grasos, sales de ácidos policarboxílicos, poliacrilatos, sarcosinatos de ácido N–metil–graso, resinatos, polioxietilen alquil éter fosfatos y polioxietilen alquil fenil éter fosfatos; tensioactivos catiónicos, incluidas las sales de alquil amina, como el clorhidrato de lauril amina, el clorhidrato de estearil amina, el clorhidrato de oleil amina, el acetato de estearil amina, el acetato de estearil aminopropil amina, el cloruro de alquil trimetil amonio y el cloruro de alquil dimetil benzalconio; y tensioactivos anfóteros, como los tensioactivos anfóteros de tipo aminoácido o betaína. Uno de estos tensioactivos puede utilizarse solo, y también pueden utilizarse dos o más de ellos en combinación.

[0451] Ejemplos de aglutinante o adhesivo: carboximetilcelulosa o sus sales, dextrina, almidón soluble, goma xantana, goma guar, sacarosa, polivinilpirrolidona, goma arábiga, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, poliacrilato de sodio, polietilenglicoles con un peso molecular medio de 6.000 a 20.000, óxidos de polietileno con un peso molecular medio de 100.000 a 5.000.000, fosfolípidos (por ejemplo, cefalina, lecitina, etc.), celulosa en polvo, dextrina, almidón modificado, compuestos quelantes del ácido

poliaminocarboxílico, polivinilpirrolidona reticulada, copolímeros de ácido maleico y estireno, copolímeros de ácido (met)acrílico, semiésteres de polímero de alcohol polihídrico y anhídrido dicarboxílico, sulfonatos de poliestireno solubles en agua, parafina, terpeno, resinas de poliamida, poliacrilatos, polioxietileno, ceras, polivinil alquil éter, condensados de alquilfenol–formaldehído y emulsiones de resinas sintéticas.

[0452] Algunos ejemplos de espesantes son los polímeros solubles en agua, como la goma xantana, la goma guar, la goma diután, la carboximetilcelulosa, la polivinilpirrolidona, los polímeros de carboxivinilo, los polímeros acrílicos, los compuestos de almidón y los polisacáridos; y los polvos finos inorgánicos, como la bentonita de alto grado y la sílice pirógena (carbón blanco).

[0453] Algunos ejemplos de colorantes son los pigmentos inorgánicos, como el óxido de hierro, el óxido de titanio y el azul de Prusia, y los colorantes orgánicos, como los colorantes alizarina, los colorantes azoicos y los colorantes de ftalocianina metálica.

[0454] Entre los ejemplos de agente anticongelante se incluyen los alcoholes polihídricos, como el etilenglicol, el dietilenglicol, el propilenglicol y la glicerina.

[0455] Entre los ejemplos de adyuvantes que evitan el apelmazamiento o facilitan la desintegración se encuentran los polisacáridos (almidón, ácido algínico, manosa, galactosa, etc.).), polivinilpirrolidona, sílice pirogénica (carbón blanco), goma éster, resina de petróleo, tripolifosfato sódico, hexametafosfato sódico, estearatos metálicos, polvo de celulosa, dextrina, copolímeros de metacrilato, polivinilpirrolidona, compuestos quelantes del ácido poliaminocarboxílico, copolímeros sulfonados de estireno–isobutileno–anhídrido maleico y copolímeros de injerto de almidón–poliacrilonitrilo.

[0456] Algunos ejemplos de agentes estabilizadores son los desecantes, como la zeolita, la cal viva y el óxido de magnesio; los antioxidantes, como los compuestos fenólicos, los compuestos de amina, los compuestos de azufre y los compuestos de ácido fosfórico; y los absorbentes de rayos ultravioleta, como los compuestos de ácido salicílico y los compuestos de benzofenona.

[0457] Algunos ejemplos de conservantes son el sorbato potásico y la 1,2-benzotiazolin-3-ona.

Además, si es necesario, también pueden utilizarse otros adyuvantes, como agentes de dispersión funcional, potenciadores de la actividad, como inhibidores metabólicos (butóxido de piperonilo, etc.), agentes anticongelantes (propilenglicol, etc.), antioxidantes (BHT, etc.) y absorbentes de rayos ultravioleta.

[0458] La cantidad del compuesto de ingrediente activo en el herbicida agrícola u hortícola de la presente invención puede ajustarse según sea necesario, y básicamente, la cantidad del compuesto de ingrediente activo se selecciona adecuadamente del rango de 0,01 a 90 partes en peso en 100 partes en peso del herbicida agrícola u hortícola. Por ejemplo, en el caso en que el herbicida agrícola u hortícola sea un polvo, un gránulo, un concentrado emulsionable o un polvo humectable, es adecuado que la cantidad del compuesto de ingrediente activo sea de 0,01 a 50% en peso en relación con el peso total del herbicida agrícola u hortícola.

[0459] La tasa de aplicación del compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno de la presente invención o una sal del mismo puede variar con varios factores, por ejemplo, el propósito, la maleza objetivo, las condiciones de crecimiento de los cultivos, la tendencia de infestación de malezas, el clima, las condiciones ambientales, la formulación, el método de aplicación, el sitio de aplicación, el momento de aplicación, etc., pero básicamente, la tasa de aplicación del compuesto de

ingrediente activo se selecciona apropiadamente del rango de 0,001 g a 10 kg, y preferiblemente de 0,01 g a 1 kg por 10 áreas dependiendo del propósito.

[0460] Para controlar las malezas, el herbicida agrícola u hortícola que comprende el compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno de la presente invención o una sal del mismo como ingrediente activo, con o sin dilución o suspensión adecuada en agua, etc., se aplica directamente al follaje de las malezas en una cantidad eficaz para el control de las mismas. Además de la aplicación foliar, puede realizarse el tratamiento de semillas de plantas útiles, como la inmersión, el recubrimiento con polvo y el recubrimiento con peróxido de calcio. Además, también puede realizarse el tratamiento del suelo o de los medios de cultivo, y ejemplos de dicho tratamiento incluyen la incorporación de todo el suelo, el tratamiento de la hilera de plantación, la incorporación del suelo del lecho, el tratamiento de las plántulas de tapón, el tratamiento del hoyo de plantación, el tratamiento del pie de la planta, el recebo, el tratamiento de las cajas de vivero para el arroz con cáscara y la aplicación sumergida.

[0461] Entre los métodos ejemplares de tratamiento de semillas para plantas útiles se incluyen la inmersión de semillas en un fluido diluido o sin diluir de una formulación líquida o sólida para la permeación de productos agroquímicos en las semillas; la mezcla o el recubrimiento en polvo de semillas con una formulación sólida o líquida para la adherencia de la formulación a las superficies de las semillas; el recubrimiento de semillas con una mezcla de una formulación sólida o líquida y un portador adhesivo como resinas y polímeros; y la aplicación de una formulación sólida o líquida en las proximidades de las semillas al mismo tiempo que se siembra.

El término “semilla” en el tratamiento de semillas se refiere a un cuerpo vegetal que se encuentra en las primeras fases de cultivo y que se utiliza para la propagación vegetal útil. Los

ejemplos incluyen, además de la denominada semilla, un cuerpo vegetal para propagación vegetativa, como un bulbo, un tubérculo, una papa de siembra, un bulbo, un propágulo, un tallo discoide y un tallo utilizado para esquejes.

[0462] El término "suelo" o "medio de cultivo" en el método de la presente invención para utilizar un herbicida agrícola u hortícola se refiere a un medio de soporte para el cultivo, en particular un medio de soporte que permite a las plantas de cultivo extender sus raíces en él, y los materiales no están particularmente limitados siempre que permitan el crecimiento de plantas útiles. Ejemplos del medio de soporte incluyen lo que se denomina suelos, esteras de siembra y agua, y ejemplos específicos de los materiales incluyen arena, piedra pómez, vermiculita, diatomita, agar, sustancias gelatinosas, sustancias de alto peso molecular, lana de roca, lana de vidrio, virutas de madera y corteza.

[0463] En el caso de la aplicación a cajas de vivero para arroz con cáscara, el tipo de formulación puede variar en función de si la aplicación se realiza en el momento de la siembra, en el periodo de reverdecimiento, en el momento del trasplante, o similares. Por ejemplo, puede utilizarse un polvo, un gránulo dispersable en agua, un gránulo, o similares. Dicha formulación puede aplicarse por incorporación al suelo del vivero. Por ejemplo, un polvo, un gránulo dispersable en agua, un gránulo, o similares pueden incorporarse a la tierra del lecho, a la tierra de cobertura, o a toda la tierra del vivero. Sencillamente, el suelo del vivero y dicha formulación pueden colocarse alternativamente en capas.

[0464] En la aplicación a arrozales, una formulación sólida, como un jumbo, un paquete, un gránulo y un gránulo dispersable en agua, o una formulación líquida, como un concentrado fluido y emulsionable, se aplica normalmente a arrozales inundados. En un período de plantación de arroz, una formulación adecuada, tal cual o después de mezclarse con un fertilizante, puede

aplicarse sobre el suelo o inyectarse en él. Además, un concentrado emulsionable, un fluido o similar puede aplicarse a la fuente de suministro de agua de los arrozales, como una toma de agua y un dispositivo de riego.

En este caso, el tratamiento se puede llevar a cabo con el suministro de agua y, por tanto, ahorrando mano de obra. En el caso de utilizar equipos de pulverización, puede tratarse de cualquier equipo que se utilice habitualmente, y entre los ejemplos se incluyen pulverizadores de barra montados en tractores, helicópteros tripulados, helicópteros teledirigidos, embarcaciones teledirigidas, drones, pulverizadores de un solo disparo, pulverizadores motorizados (manuales o automáticos), pulverizadores motorizados de transporte, pulverizadores motorizados de mochila y pulverizadores manuales.

[0465] Para la ampliación de la gama de malezas diana y el momento adecuado para el control de malezas, o para la reducción de la dosis, el compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno de la presente invención o una sal del mismo puede utilizarse después de mezclarse con otros herbicidas, reguladores del crecimiento de las plantas, reductores de la fitotoxicidad (protectores), acondicionadores del suelo, fertilizantes y/o similares. Además, el compuesto de la presente invención o una sal del mismo puede utilizarse después de mezclarse con insecticidas agrícolas u hortícolas, acaricidas, nematicidas, microbicidas, bioplaguicidas y/o similares dependiendo de la situación. A continuación se describen ejemplos no limitativos de compuestos típicos.

[0466] Entre los herbicidas ejemplares utilizados para los mismos fines que los anteriores se incluyen la 1-naftilacetamida, 2,4-PA, 2,3,6-TBA, 2,4,5-T, 2,4,5-TB, 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DEB, 2,4-DEP, 3,4-DA, 3,4-DB, 3,4-DP, 4-CPA, 4-CPB, 4-CPP, MCP, MCPA, MCPA- tioetilo, MCPB, ioxinil, icafolin, aclonifen, azafenidin, acifluorfen, aziprotrina, azimsulfuron,

asulam, acetocloro, atrazina, atratón, anisurón, anilofos, aviglicina, ácido abscísico, amicarbazona, amidosulfurón, amitrol, aminociclopiraclor, aminopiralida, amibuzina, amiprofos-metilo, ametridiona, ametrina, alacloro, alidocloro, aloxidim, alorac, iofensulfurón, isourón, isocarbamida, isoxaclortole, isoxapirifop, isoxaflutol, isoxaben, isocil, isonorurón, isoproturón, isopropalina, isopolinato, isometiozina, inabenfida, ipazina, iptriazopirida, ipfencarbazona, iprimidam, imazaquín, imazápico, imazapir, imazamethapir, imazamethabenz, imazamethabenz-metil, imazamox, imazethapir, imazosulfuron, indaziflam, indanofan, indolauxipir, indolauxipyr-cianomethyl, indolebutyric acid, uniconazol-P, eglinazina, esprocarb, etametsulfurón, etametsulfurón-metilo, etalfluralina, etiolato, etilozato-etilo, etidimurón, etinofeno, etefon, etoxisulfurón, etoxifen, etnipromid, etofumesate, etobenzanid, epyrifenacil, epronaz, erbon, endothal, oxadiazon, oxadiargil, oxaziclomefona, oxasulfuron, oxapirazon, oxifluorfen, orizalina, ortosulfamurón, orbencarb, cafenstrol, cambendicloro, carbasulam, carfentrazona, carfentrazona-etilo, karbutilato, carbetamida, carboxazol, quizalofop, quizalofop-P, quizalofop-etilo, xilacloro, quinoclamina, quinonamida, quinclorac, quinmerac, cumilurón, clacifós, cliodinato, glifosato, glufosinato, glufosinato-P, credazina, cletodim, cloxifonac, clodinafop, clodinafop-propargilo, clorotolurón, clopiralida, cloproxidim, cloprop, clorbromurón, clofop, clomazona, clometoxinil, clometoxifeno, clomeprop, clorazifop, clorazina, cloransulam, cloranocril, cloramben, cloransulam-metilo, cloridazón, clorimurón, clorimurón-etilo, clorsulfurón, clortal, clortiamida, clornitrofen, clorfenac, clorfenprop, clorbufam, clorflurazol, clorflurenol, clorprocarb, clorprofam, clormequat, cloreturon, cloroxinil, cloroxurón, cloropón, saflufenacil, cianazina, cianatrina, di-alato, diurón, dietamquat, dioxopiritriona, dicamba,

ciclurón, cicloato, cicloxidim, diclosulam, ciclosulfamurón, ciclopiranil, ciclopirimorato, diclorprop, diclorprop-P, diclobenil, diclofop, diclofop-metil, diclormato, dicloralurea, dicuat, cisanilida, disul, sidurón, ditiopir, dinitramina, cinidón-etilo, dinosam, cinosulfurón, dinoseb, dinoterb, dinofenato, dinoprop, cihalofop-butilo, cipirafluona, difenamida, difenoxuron, difenopenten, difenzoquat, cibutrina, ciprazina, ciprazol, diflufenican, diflufenzopir, dipropetrina, cipromid, ciperquat, gibberelina, simazina, dimexano, dimesulfazet, dimetacloro, dimidazón, dimetametrina, dimetenamida, simetrina, simetón, dimepiperato, dimefurón, cinmetilina, swep, sulglicapina, sulcotriona, sulfalato, sulfentrazona, sulfosulfurón, sulfometurón, sulfometurón-metilo, secbumetón, setoxidim, sebutilazina, terbacil, daimurón, dazomet, dalapón, tiazaflurón, tiazopir, tiafenacil, tiencarbazona, tiencarbazona-metilo, tiocarbazil, tioclorim, tiobencarb, tidiazimina, tidiazurón, tifensulfurón, tifensulfurón-metilo, desmedipham, desmetrina, tetflupirrolimet, tetraflurón, tenilclor, tebutam, tebuturón, terbumeton, tepraloxidim, tefuriltriona, tembotriona, delacloro, terbacil, terbucarb, terbucloro, terbutilazina, terbutrina, topramezona, tralkoxidim, triaziflam, triasulfurón, triafamona, trialato, trietazina, tricamba, triclopir, tridifano, tritac, tritosulfurón, tripirasulfona, trifludimoxazina, triflusulfurón, triflusulfurón-metilo, trifluralina, trifloxisulfurón, tripropindán, tribenurón-metilo, tribenurón, trifop, trifopsima, trimeturón, tolpiralato, naptalam, naproanilida, napropamida, nicosulfurón, nitralina, nitrofeno, nitrofluorfeno, nipiraclofeno, neburón, norflurazón, norurón, barban, paclobutrazol, paraquat, paraflurón, haloxidina, halauxifeno, haloxifop, haloxifop-P, haloxifop-metilo, halosafeno, halosulfurón, halosulfurón-metilo, bixlozona, picloram, picolinafeno, biciclopirona, bispiribac, bispiribac-sodio,

pydanon, pinoxaden, bipirazona, bifenox, piperofós, himexazol, piraquinato, piraclonil, pirasulfotol, pirazoxifeno, pirazosulfurón, pirazosulfurón-etilo, pirazolato, bilanafós, piraflufeno-etilo, piricloro, piridafol, piritibac, piritiobac-sodio, piridato, piriftalida, piributicarb, piriflubenzoxim, piribenzoxim, pirimisulfán, primisulfurón, piriminobac-metilo, flusulfinam, broclozona, piroxasulfona, piroxsulam, fenasulam, fenisopham, fenurón, fenoxasulfona, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etilo, fenotiol, fenoprop, fenobenzurón, fenquinotriona, fentiaprop, fenteracol, fentrazamida, fenpirazona, fenmedifam, fenmedifam-etilo, butacloro, butafenacil, butamifos, butiurón, buhidazol, butilato, buturón, butenacloro, butroxidim, butralin, flazasulfuron, flamprop, furiloxifen, prinaclor, primisulfuron-metilo, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butilo, fluazolato, flucloraminopir, flucloraminopir-tefurilo, fluroxipir, fluotiuron, fluometuron, fluoroglicofen, flurocloridona, fluorodifen, fluoronitrofen, fluoromidina, flucarbazona, flucarbazona-sodio, flucloralina, flucetosulfurón, flutiacet, flutiacet-metilo, flupirsulfurón, flufenacet, flufenoximacil, flufenican, flufenpir, flupropacil, flupropanato, flupoxam, flumioxazina, flumiclorac, flumiclorac-pentilo, flumipropina, flumezina, fluometuron, flumetsulam, fluridona, flurtamona, fluroxipir, pretilaclor, proxan, proglinazina, prociazina, prodiamina, prosulfalina, prosulfurona, prosulfocarb, propaquizafop, propaclor, propazina, propanilo, propizamida, propisoclor, prohidrojasmona, propirisulfuron, propham, profluazol, profluralina, prohexadiona-calcio, propoxicarbazona, propoxicarbazona-sodio, profoxidim, bromacil, brompirazón, prometrina, prometón, bromoxinil, bromofenoxim, bromobutida, bromobonil, florasulam, florpirauxifeno, hexacloroacetona, hexazinona, petoxamida, benazolina, penoxsulam, pebulado, beflubutamida, beflubutamida-M, vernolato, perfluidona,

bencarbazona, benquitriona, benzadox, benzipram, bencilaminopurina, benzotiazurón, benzfendizona, bensulida, bensulfurón-metilo, benzoilprop, benzobiciclón, benzofenap, benzofluor, bentazona, pentanocloro, bentiocarb, pendimetalina, pentoxazona, benfluralina, benfuresato, fosamina, fomesafeno, foramsulfurón, forclorfenurón, hidrazida maleica, mecoprop, mecoprop-P, medinoterb, mesosulfurón, mesosulfurón-metilo, mesotriona, mesoprazina, metoprotrina, metazacloro, metazol, metazosulfurón, metabenztiazurón, metamitrón, metamifop, metam, metalpropalina, metiurón, metiozolina, metiobencarb, metildimrón, metoxurón, metosulam, metsulfurón, metsulfurón-metilo, metflurazón, metobromurón, metobenzurón, metometón, metolacloro, metribuzina, cloruro de mepiquat, mefenacet, mefluidida, monalida, monisourón, monurón, ácido monocloroacético, monolinurón, molinato, morfamquat, yodosulfurón, yodosulfurón-metil-sodio, yodobonil, yodometano, lactofeno, lancotriona, linurón, rimisoxafeno, rimsulfurón, lenacil, rodetanil, peróxido de calcio y bromuro de metilo. También pueden utilizarse bioplaguicidas disponibles como herbicidas, como Xanthomonas campestris, una vez mezclados con el compuesto de la presente invención o una sal del mismo.

[0467] Entre los ejemplos de reductores de fitotoxicidad (protectores) se incluyen el anhídrido 1,8-naftálico, isoxadifeno-etilo, furilazol, ciprosulfamida, ciometrinil, diclormid, dimepiperato, tiencarbazona-metilo, fenclorazona-etilo, fenclorim, fluxofenim, flurazol, benoxacor, metcamifeno y mefenpir-dietilo.

[0468] Otros ejemplos de bioplaguicidas son los depredadores naturales como *Encarsia formosa*, *Aphidius colemani*, *Aphidoletes aphidimyza*, *Diglyphus isaea*, *Dacnusa sibirica*, *Phytoseiulus persimilis*, *Amblyseius cucumeris* y *Orius sauteri*; plaguicidas microbianos como *Beauveria brongniartii*; y

feromonas como el acetato de (Z)-10-tetradecenilo, acetato de (E,Z)-4,10-tetradecadienilo, acetato de (Z)-8-dodecenilo, acetato de (Z)-11-tetradecenilo, (Z)-13-icosen-10-ona y 14-metil-1-octadeceno.

EJEMPLOS

[0469] De ahora en más, se muestran los Ejemplos representativos en relación con la presente invención, pero la presente invención no se limita a ellos.

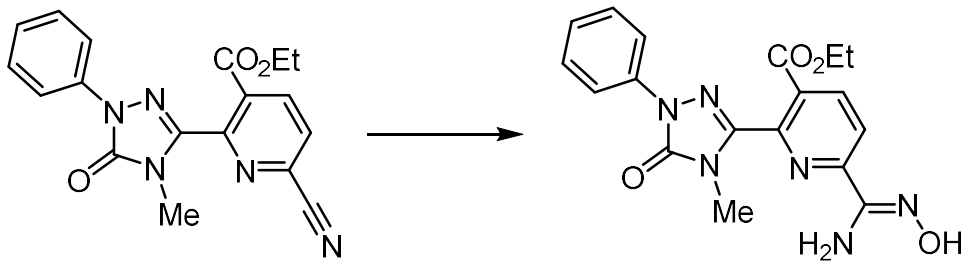
[0470] Ejemplo de producción 1

Producción de (Z)-etil 6-(N'-etoxicarbamimidoil)-2-(4-metil-5-oxo-1-fenil-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)nicotinato (Compuesto N.° 5-3)

Ejemplo 1-1

Producción de (Z)-etil 6-(N'-hidroxicarbamimidoil)-2-(4-metil-5-oxo-1-fenil-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)nicotinato

[Quím. 48]



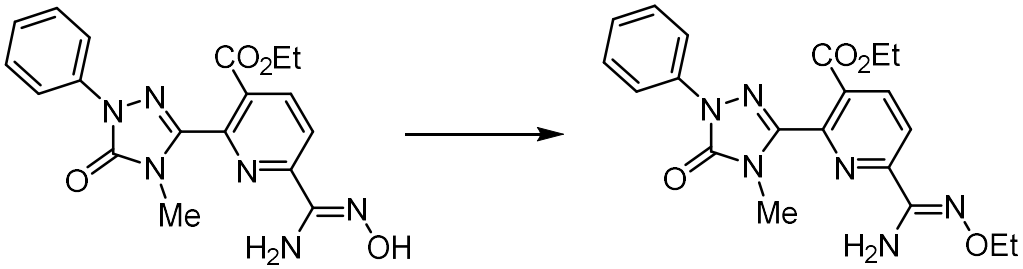
A una solución de etil 6-ciano-2-(4-metil-5-oxo-1-fenil-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)nicotinato (0,73 g, 2,1 mmol) en etanol (21 mL), clorhidrato de hidroxilamina (0,22 g, 3,2 mmol) y acetato de sodio (0,26 g, 3,2 mmol) se añadieron y la mezcla se agitó y se calentó a reflujo durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró al vacío. Una solución saturada acuosa de hidrógeno-carbonato de sodio se añadió al residuo y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por

cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-etil 6-(N'-hidroxicarbamimidoil)-2-(4-metil-5-oxo-1-fenil-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)nicotinato (0,72 g, 1,6 mmol).
Rendimiento: 89 %
Propiedad física: punto de fusión: 127 a 128 °C

[0471] Ejemplo de producción 1-2

Producción de (Z)-etil 6-(N'-etoxicarbamimidoil)-2-(4-metil-5-oxo-1-fenil-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)nicotinato (Compuesto N.° 5-3)

[Quím. 49]



A una solución de (Z)-etil 6-(N'-hidroxicarbamimidoil)-2-(4-metil-5-oxo-1-fenil-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)nicotinato (0,30 g, 0,78 mmol) en N,N-dimetilformamida (8,0 mL), carbonato de cesio (0,51 g, 1,6 mmol) y yoduro de etilo (0,13 mL, 1,6 mmol) se añadieron a temperatura ambiente y la mezcla se agitó a temperatura ambiente. Una solución saturada acuosa de cloruro de amonio se añadió a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-etil 6-(N'-etoxicarbamimidoil)-2-(4-metil-5-oxo-1-fenil-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)nicotinato (0,35 mg, 0,78 mmol).
Rendimiento: 100 %
Propiedad física: índice de refracción: 1,4692 (20,1 °C)

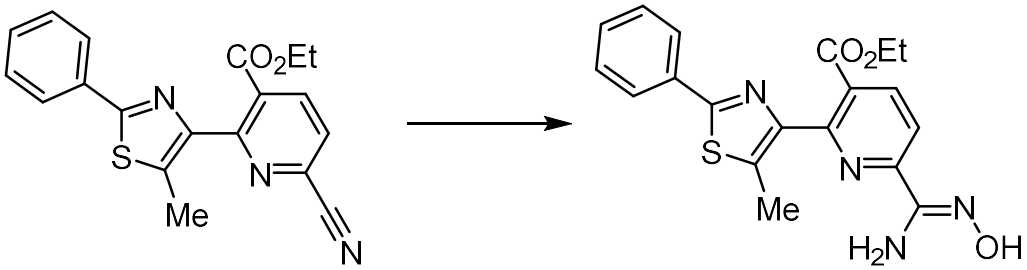
[0472] Ejemplo de producción 2

Producción de (Z)-etil 6-(N'-etoxicarbamimidoil)-2-(5-metil-2-feniltiazol-4-il)nicotinato (Compuesto N.° 7-1)

Ejemplo de producción 2-1

Producción de (Z)-etil 6-(N'-hidroxicarbamimidoil)-2-(5-metil-2-feniltiazol-4-il)nicotinato

[Quím. 50]



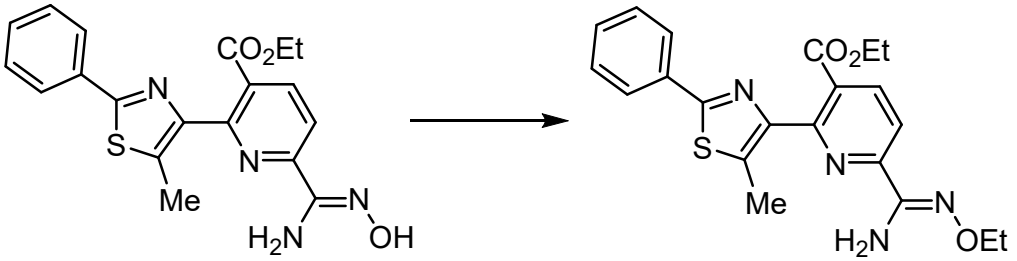
A una solución de etil 6-ciano-2-(5-metil-2-feniltiazol-4-il)nicotinato (63 mg, 0,18 mmol) en etanol (1,0 mL), clorhidrato de hidroxilamina (20 mg, 0,27 mmol) y acetato de sodio (23 mg, 0,27 mmol) se añadieron a temperatura ambiente y la mezcla se agitó y se calentó a reflujo durante 3 horas. Después de completar la reacción, la mezcla de reacción se concentró al vacío. Una solución saturada acuosa de hidrógeno-carbonato de sodio se añadió al residuo y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío para dar (Z)-etil 6-(N'-hidroxicarbamimidoil)-2-(5-metil-2-feniltiazol-4-il)nicotinato (51 mg, 0,13 mmol).

Rendimiento: 74 %

[0473] Ejemplo de producción 2-2

Producción de (Z)-etil 6-(N'-etoxicarbamimidoil)-2-(5-metil-2-feniltiazol-4-il)nicotinato (Compuesto N.° 7-1)

[Quím. 51]



A una solución de (Z)-etil 6-(N'-hidroxicarbamimidoil)-2-(5-metil-2-feniltiazol-4-il)nicotinato (40 mg, 0,11 mmol) en N,N-dimetilformamida (8,0 mL), carbonato de cesio (70 mg, 0,21 mmol) y yoduro de etilo (20 μL, 0,21 mmol) se añadieron a temperatura ambiente y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Después de completar la reacción, una solución saturada acuosa de cloruro de amonio se añadió a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-etil 6-(N'-etoxicarbamimidoil)-2-(5-metil-2-feniltiazol-4-il)nicotinato (36 mg, 0,088 mmol).

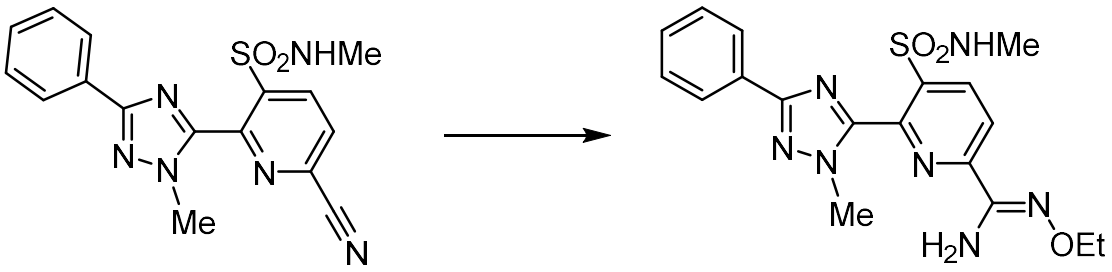
Rendimiento: 83 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 8,06 (d, 1H), 8,01 (d, 1H), 7,91-7,81 (m, 2H), 7,44-7,38 (m, 3H), 5,53 (s, 2H), 4,21 (q, 2H), 4,18 (q, 2H), 2,73 (s, 3H), 1,35 (t, 3H), 1,08 (t, 3H)

[0474] Ejemplo de producción 3

Producción de (Z)-N'-etoxi-6-(1-metil-3-fenil-1H-1,2,4-triazol-5-il)-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (Compuesto N.° 1-4)

[Quím. 52]



A una solución de 6-ciano-N-metil-2-(1-metil-3-fenil-1H-1,2,4-triazol-5-il)piridin-3-sulfonamida (0,16 g, 0,45 mmol) en metanol (2,0 mL), una solución metanólica de metóxido de sodio (28 % p, 0,10 mL, 0,45 mmol) se añadió y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. Después de confirmar la desaparición del compuesto de partida, clorhidrato de O-

etilhidroxilamina (67 mg, 0,69 mmol) se añadió a la mezcla de reacción y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. Una solución saturada acuosa de cloruro de amonio se añadió y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se concentró al vacío y el residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-N'-etoxi-6-(1-metil-3-fenil-1H-1,2,4-triazol-5-il)-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (89,1 mg, 0,21 mmol).

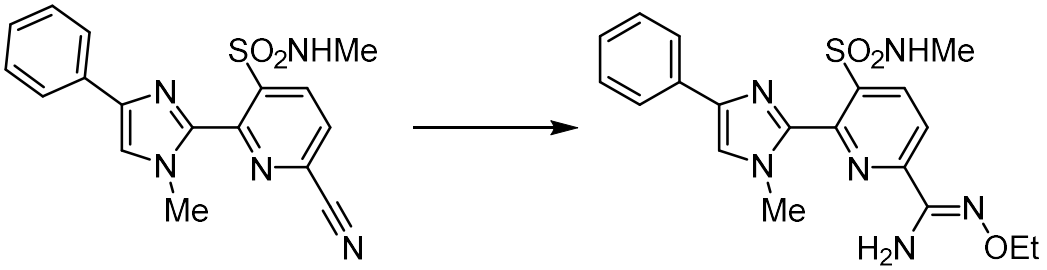
Rendimiento: 47 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 8,46 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 8,03-7,99 (m, 2H), 7,79-7,73 (m, 1H), 7,51-7,43 (m, 3H), 5,44 (s, 2H), 4,24 (q, 2H), 4,10 (s, 1H), 2,79 (d, 3H), 1,37 (t, 3H)

[0475] Ejemplo de producción 4

Producción de (Z)-N'-etoxi-6-(1-metil-4-fenil-1H-imidazol-2-il)-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (Compuesto N.° 2-33)

[Quím. 53]



A una solución de 6-ciano-N-metil-2-(1-metil-4-fenil-1H-imidazol-2-il)piridin-3-sulfonamida (0,10 g, 0,28 mmol) en metanol (1,0 mL), una solución metanólica de metóxido de sodio (28 % p, 0,050 mL, 0,77 mmol) se añadió y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. Después de confirmar la desaparición del compuesto de partida, clorhidrato de O-etilhidroxilamina (42 mg, 0,42 mmol) se añadió y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. Una solución saturada acuosa de cloruro de amonio se añadió a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se concentró y el residuo se purificó por

cromatografía en columna de gel de sílice para dar el producto deseado (83 mg, 0,20 mmol).

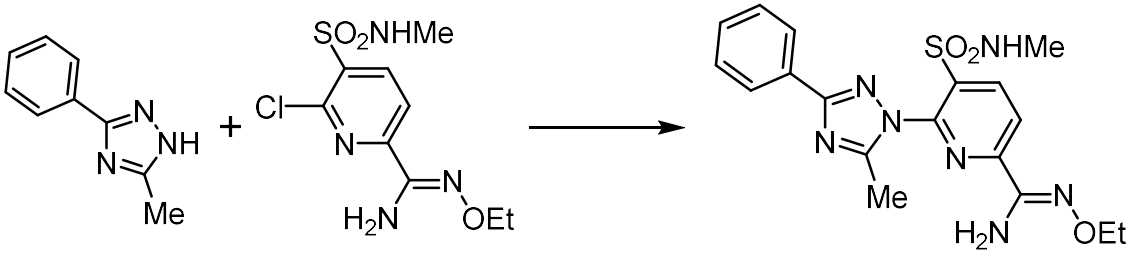
Rendimiento: 72 %

Propiedad física: punto de fusión: 237 a 238 °C

[0476] Ejemplo de producción 5

Producción de (Z)-N'-etoxi-6-(5-metil-3-fenil-1H-1,2,4-triazol-1-il)-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (Compuesto N.° 3-3)

[Quím. 54]



A una solución de (Z)-6-cloro-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (80 mg, 0,27 mmol) en N,N-dimetilacetamida (1,5 mL), carbonato de potasio (0,13 g, 0,96 mmol) y 5-metil-3-fenil-1H-1,2,4-triazol (53 mg, 0,27 mmol) se añadieron y la mezcla se agitó a 130 °C durante 4 horas. Después de completar la reacción, agua y acetato de etilo se añadieron para extracción. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-N'-etoxi-6-(5-metil-3-fenil-1H-1,2,4-triazol-1-il)-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (84 mg, 0,19 mmol).

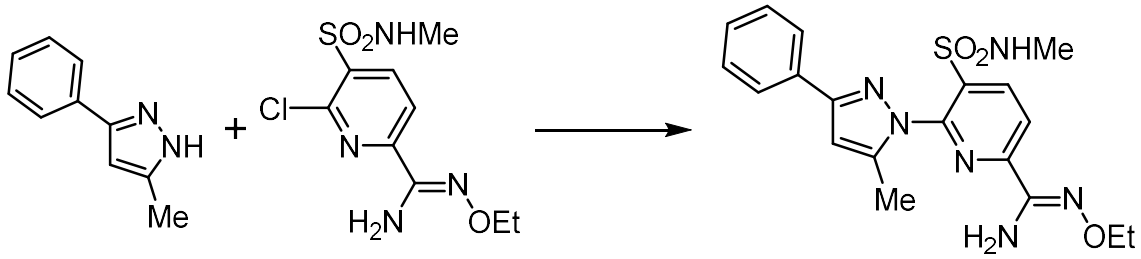
Rendimiento: 68 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 8,48 (d, 1H), 8,28 (d, 1H), 8,04-8,01 (m, 2H), 7,49-7,45 (m, 3H), 6,34 (q, 1H), 5,39 (brs, 2H), 4,24 (q, 2H), 2,79 (d, 3H), 2,61 (s, 3H), 1,37 (t, 3H)

[0477] Ejemplo de producción 6

Producción de (Z)-N'-etoxi-6-(5-metil-3-fenil-1H-pirazol-1-il)-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (Compuesto N.° 4-6)

[Quím. 55]



A una solución de (Z)-6-cloro-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (70 mg, 0,25 mmol) en N,N-dimetilacetamida (1,4 mL), carbonato de potasio (0,12 g, 0,87 mmol) y 5-metil-3-fenil-1H-pirazol (40 mg, 0,25 mmol) se añadieron y la mezcla se agitó a 130 °C durante 5 horas. Después de completar la reacción, agua y acetato de etilo se añadieron a la mezcla de reacción para extracción. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-N'-etoxi-6-(5-metil-3-fenil-1H-pirazol-1-il)-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (28 mg, 0,070 mmol).

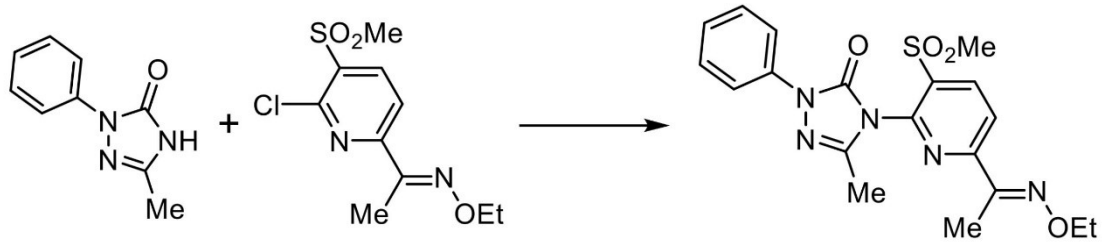
Rendimiento: 28 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 8,46 (d, 1H), 8,20 (d, 1H), 7,72-7,69 (m, 1H), 7,45-7,40 (m, 2H), 7,38-7,34 (m, 1H), 6,79 (q, 1H), 6,60 (s, 1H), 5,41 (brs, 2H), 4,23 (q, 2H), 2,77 (d, 3H), 2,43 (s, 3H), 1,37 (t, 3H)

[0478] Ejemplo de producción 7

Producción de (E)-4-(6-(1-(etoxiimino)etil)-3-(metilsulfonil)piridin-2-il)-3-metil-1-fenil-1H-1,2,4-triazol-5(4H)-ona (Compuesto N.° 6-1)

[Quím. 56]



A una solución de N,N-dimetilformamida (1,0 mL) de (E)-1-(6-cloro-5-(metilsulfonil)piridin-2-il)etanona O-etil oxima (60 mg, 0,22 mmol), 3-metil-1-fenil-1H-1,2,4-triazol-5(4H)-ona (76 mg, 0,43 mmol), 4,5'-bis(difenilfosfino)-9,9'-dimetil xanteno (25 mg, 0,043 mmol) y tris(dibencilidenacetona)dipaladio(0) (20 mg, 0,022 mmol) se añadieron y la mezcla se agitó a 120 °C durante 3 horas. Una solución saturada acuosa de cloruro de amonio se añadió a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo, seguido de lavado con salmuera saturada. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (E)-4-(6-(1-(etoxiimino)etil)-3-(metilsulfonil)piridin-2-il)-3-metil-1-fenil-1H-1,2,4-triazol-5(4H)-ona (4,0 mg, 0,0084 mmol).

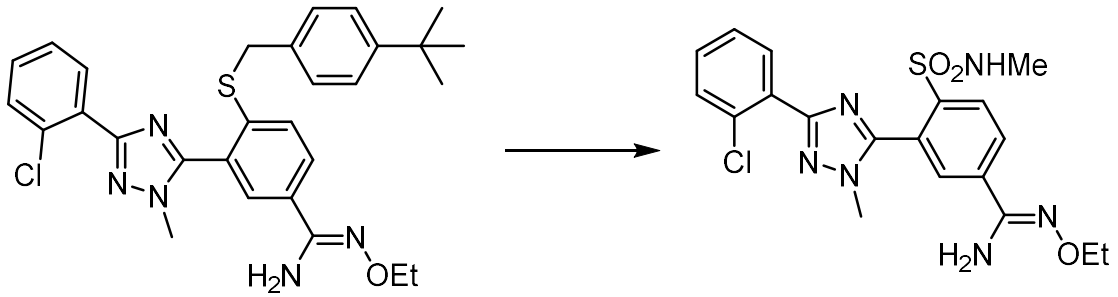
Rendimiento: 4 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 8,44 (d, 1H), 8,24 (d, 1H), 8,02-7,95 (m, 2H), 7,49-7,40 (m, 2H), 7,26-7,21 (m, 1H), 4,36 (q, 2H), 3,40 (s, 3H), 2,29 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,38 (t, 3H)

[0479] Ejemplo de producción 8

Producción de (Z)-3-(3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-1,2,4-triazol-5-il)-N'-etoxi-4-(N-metilsulfamoil)bencimidamida (Compuesto N.° 17-2)

[Quím. 57]



A una solución de (Z)-4-((4-(ter-butil)bencil)tio)-3-(3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-1,2,4-triazol-5-il)-N'-etoxibencimidamida (0,23 g, 0,42 mmol) en cloroformo (4,2 mL),

1,3-dicloro-5,5-dimetilhidantoína (0,25 g, 1,3 mmol), ácido acético (75 μL, 1,3 mmol) y agua (45 μL, 2,5 mmol) se añadieron a 0 °C y la mezcla se agitó a la misma temperatura durante 10 minutos. Una solución metanólica de metilamina (9,8 M, 0,43 mL, 4,2 mmol) se añadió y la mezcla se agitó durante 10 minutos. Se añadió agua a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de cloroformo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-3-(3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-1,2,4-triazol-5-il)-N'-etoxi-4-(N-metilsulfamoil)bencimidamida (72 mg, 0,16 mmol).

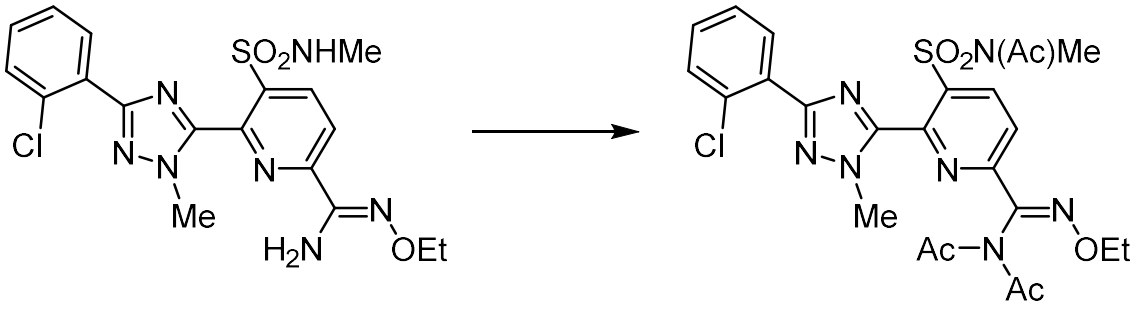
Rendimiento: 37 %

Propiedad física: punto de fusión: 167 a 168 °C

[0480] Ejemplo de producción 9

Producción de (Z)-3-(3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-1,2,4-triazol-5-il)-N'-etoxi-4-(N-metilsulfamoil)bencimidamida (Compuesto N.° 1-12)

[Quím. 58]



A una solución de (Z)-6-(3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-1,2,4-triazol-5-il)-N'-etoxi-5-(N-metilsulfanil)picolinimidamida (0,10 g, 0,22 mmol) en N,N-dimetilacetamida (2 mL), anhídrido acético (0,067 g, 0,33 mmol) y carbonato de cesio (0,22 g, 0,33 mmol) se añadieron a temperatura ambiente y la mezcla se agitó a 50 °C durante 10 minutos. Una solución metanólica de metilamina (9,8 M, 0,43 mL, 4,2 mmol) se añadió y la mezcla se agitó durante 10 minutos.

Se añadió agua a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de cloroformo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-N-acetil-N-((5-(N-acetil-N-metilsulfamoil)-6-(3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-1,2,4-triazol-5-il)piridin-2-il)(etoxiimino)metil)acetamida (62 mg, 0,11 mmol).

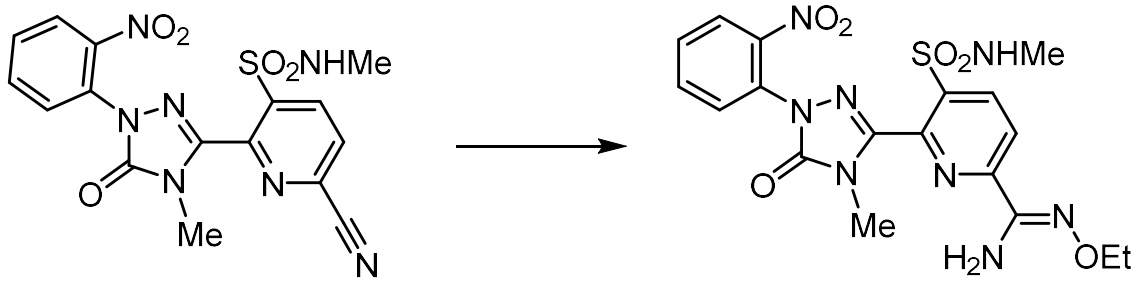
Rendimiento: 50 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 8,79 (d, 1H), 8,34 (d, 1H), 7,93-7,90 (m, 1H), 7,53-7,50 (m, 1H), 7,38-7,35 (m, 2H), 4,44 (q, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,05 (s, 3H), 2,32 (s, 9H), 2,16 (s, 3H), 1,40 (t, 3H)

[0481] Ejemplo de producción 10

Producción de (Z)-N'-etoxi-6-(4-metil-1-(2-nitrofenil)-5-oxo-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (Compuesto N.° 5-19)

[Quím. 59]



A una solución de 6-ciano-N-metil-2-(4-metil-1-(2-nitrofenil)-5-oxo-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-sulfonamida (1,0 g, 2,4 mmol) en metanol (10 mL), una solución metanólica de metóxido de sodio (28 % p, 0,55 mL, 2,4 mmol) se añadió y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. Después de confirmar la desaparición del compuesto de partida, clorhidrato de O-etilhidroxilamina (0,36 g, 3,7 mmol) se añadió a la mezcla de reacción y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. Una solución saturada acuosa de cloruro de amonio se añadió a la mezcla de

reacción y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se concentró al vacío y el residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-N'-etoxi-6-(4-metil-1-(2-nitrofenil)-5-oxo-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (0,92 g, 1,9 mmol).

Rendimiento: 79 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 8,43 (d, 1H), 8,29 (d, 1H), 7,96-7,90 (m, 2H), 7,78-7,72 (m, 1H), 7,56-7,50 (m, 1H), 5,84 (q, 1H), 5,45 (s, 2H), 4,24 (q, 2H), 3,42 (s, 3H), 2,71 (d, 3H), 1,37 (t, 3H)

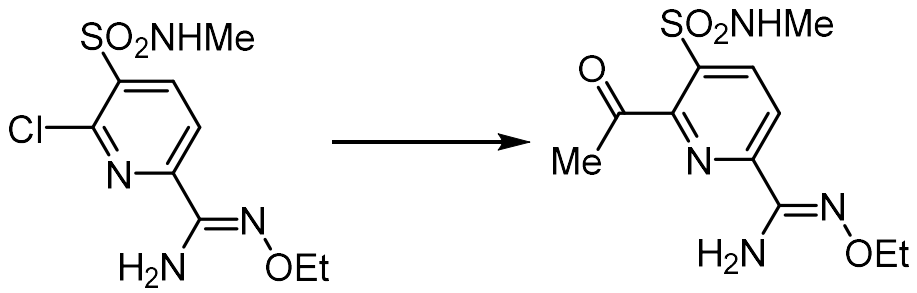
[0482] Ejemplo de producción 11

Producción de (Z)-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)-6-(2-feniltiazol-4-il)picolinimidamida (Compuesto N.° 7-18) y (Z)-6-(5-bromo-2-feniltiazol-4-il)-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (Compuesto N.° 7-19)

Ejemplo de producción 11-1

Producción de (Z)-6-acetil-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida

[Quím. 60]



A una solución de (Z)-6-cloro-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (1,0 g, 3,4 mmol) en dimetoxietano (20 mL), tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0) (0,40 g, 0,34 mmol) y tributil(1-etoxivinil)estaño (1,7 mL, 5,1 mmol) se añadieron y la mezcla se agitó bajo una atmósfera de argón a 110 °C durante 5 horas. Después de completar la reacción, tetrahidrofurano (10 mL) y 1 N ácido clorhídrico (10 mL) se

añadieron a la mezcla de reacción y la mezcla se agitó durante la noche a temperatura ambiente. Agua y acetato de etilo se añadieron para extracción. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-6-acetil-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (0,55 g, 1,8 mmol).

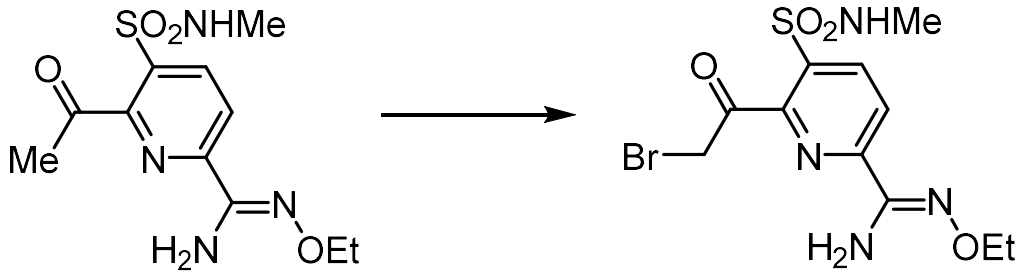
Rendimiento: 54 %

Propiedad física: punto de fusión: 100 a 101 °C

[0483] Ejemplo de producción 11-2

Producción de (Z)-6-(2-bromoacetil)-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida

[Quím. 61]



A una solución de (Z)-6-acetil-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (0,50 g, 1,7 mmol) en tetrahidrofurano (10 mL), se añadió tribromuro de feniltrimetilamonio (0,62 g, 1,7 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Después de completar la reacción, agua y acetato de etilo se añadieron a la mezcla de reacción para extracción. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y luego se concentró al vacío para dar (Z)-6-(2-bromoacetil)-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (0,71 g, 1,8 mmol).

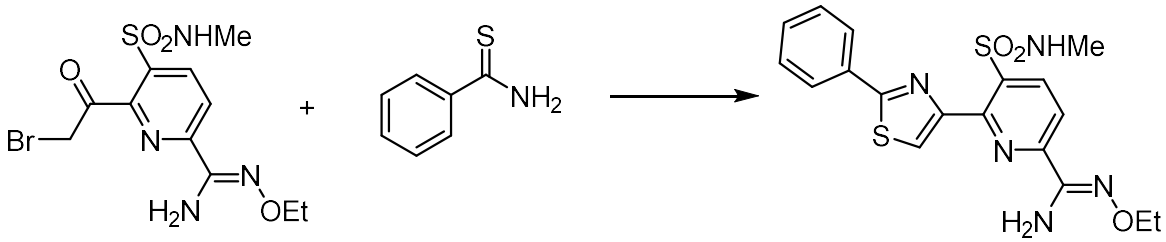
Rendimiento: 100 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 8,31-8,27 (m, 1H), 8,11-8,09 (m, 1H), 5,51 (brs, 2H), 4,23 (q, 2H), 3,00 (s, 2H), 1,36 (t, 3H)

[0484] Ejemplo de producción 11-3

Producción de (Z)-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)-6-(2-feniltiazol-4-il)picolinimidamida (Compuesto N.° 7-18)

[Quím. 62]



A una solución de (Z)-6-(2-bromoacetil)-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (0,71 g, 1,8 mmol) en etanol (10 mL), se añadió tiobenzamida (0,21 g, 1,5 mmol) y la mezcla se agitó y se calentó a reflujo durante 2 horas. Después de completar la reacción, la mezcla de reacción se concentró al vacío. Una solución saturada acuosa de hidrógeno-carbonato de sodio y acetato de etilo se añadieron al residuo para extracción. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)-6-(2-feniltiazol-4-il)picolinimidamida (0,28 g, 0,68 mmol).

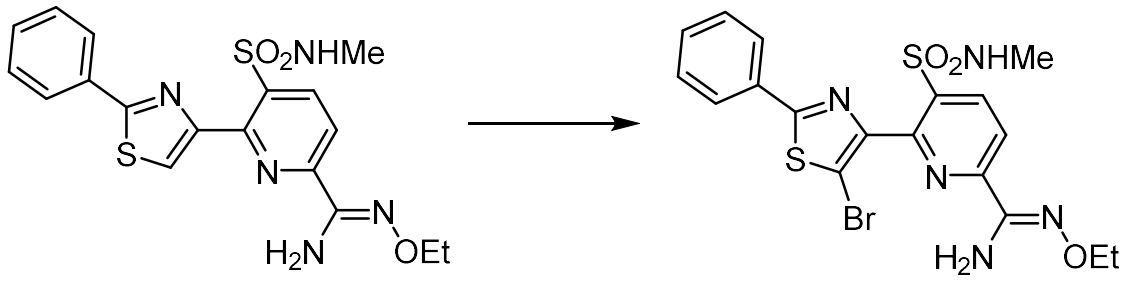
Rendimiento: 36 %

Propiedad física: punto de fusión: 189 a 190 °C

[0485] Ejemplo de producción 11-4

Producción de (Z)-6-(5-bromo-2-feniltiazol-4-il)-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (Compuesto N.° 7-19)

[Quím. 63]



A una solución de (Z)-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)-6-(2-feniltiazol-4-il)picolinimidamida (0,24 g, 0,58 mmol) en cloroformo (5,0 mL), N-bromosuccinimida (0,13 g, 0,70 mmol) se añadió y la mezcla se agitó a 50 °C durante 7 horas y luego a temperatura ambiente durante la noche. Después de completar la reacción, se añadió agua a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de cloroformo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-6-(5-bromo-2-feniltiazol-4-il)-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (0,23 g, 0,46 mmol).
Rendimiento: 79 %
Propiedad física: punto de fusión: 159 a 160 °C

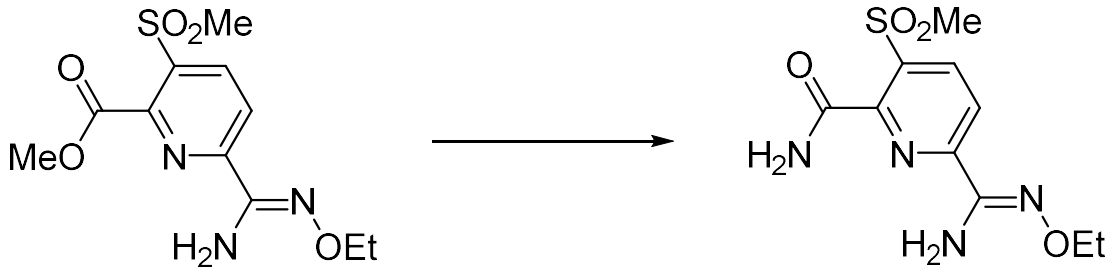
[0486] Ejemplo de producción 12

Producción de (Z)-N'-etoxi-5-(metilsulfonil)-6-(4-feniltiazol-2-il)picolinimidamida (Compuesto N.° 8-17) y (Z)-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)-6-(4-feniltiazol-2-il)picolinimidamida (Compuesto N.° 8-2)

Ejemplo de producción 12-1

Producción de (Z)-6-(N'-etoxicarbamimidoil)-3-(metilsulfonil)picolinamida

[Quím. 64]



(Z)-Metil 6-(N'-etoxicarbamimidoil)-3-(metilsulfonil)picolinato (1,4 g, 4,5 mmol) se añadió a una solución metanólica de amoníaco (2 mol/L, 10 mL) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Después de completar la reacción, la mezcla de reacción se concentró al vacío. Agua y acetato de etilo se añadieron al residuo para

extracción. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-6-(N'-etoxicarbamimidoil)-3-(metilsulfonil)picolinamida (0,32 g, 1,1 mmol).

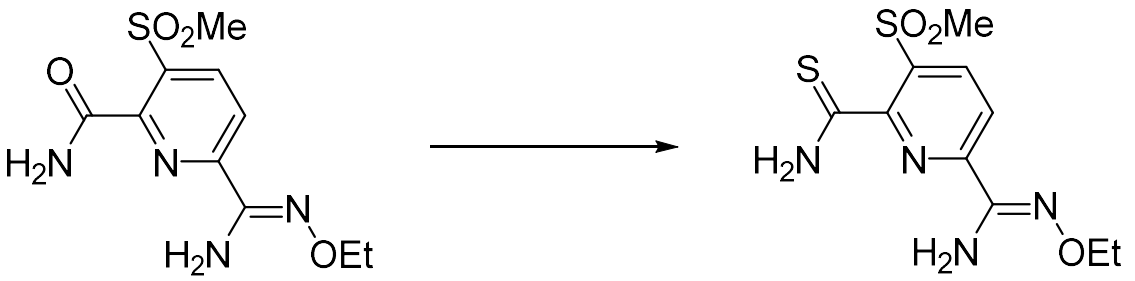
Rendimiento: 24 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 8,49 (d, 1H), 8,28 (d, 1H), 6,79 (brs, 1H), 5,81 (brs, 1H), 5,43 (brs, 2H), 4,23 (q, 2H), 3,56 (s, 3H), 1,36 (t, 3H)

[0487] Ejemplo de producción 12-2

Producción de (Z)-6-(N'-etoxicarbamimidoil)-3-(metilsulfonil)piridin-2-carbotioamida

[Quím. 65]



A una solución de (Z)-6-(N'-etoxicarbamimidoil)-3-(metilsulfonil)picolinamida (0,32 g, 1,1 mmol) en tolueno (5,0 mL), reactivo de Lawesson (0,45 g, 1,1 mmol) se añadió y la mezcla se agitó a 90 °C durante 3 horas. Después de completar la reacción, la mezcla de reacción se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-6-(N'-etoxicarbamimidoil)-3-(metilsulfonil)piridin-2-carbotioamida (0,27 g, 0,90 mmol).

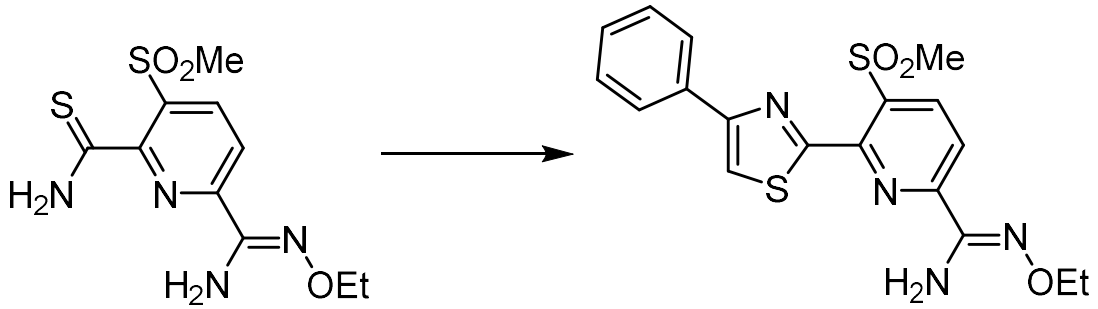
Rendimiento: 82 %

Propiedad física: punto de fusión: 243 a 245 °C

[0488] Ejemplo de producción 12-3

Producción de (Z)-N'-etoxi-5-(metilsulfonil)-6-(4-feniltiazol-2-il)picolinimidamida (Compuesto N.° 8-17)

[Quím. 66]



A una solución de (Z)-6-(N'-etoxicarbamimidoil)-3-(metilsulfonil)piridin-2-carbotioamida (0,23 g, 0,77 mmol) en etanol (2,5 mL), se añadió bromuro de fenacilo (0,17 g, 0,84 mmol) y la mezcla se agitó y se calentó a reflujo durante 2 horas. Después de completar la reacción, la mezcla de reacción se concentró al vacío. Una solución saturada acuosa de hidrógeno-carbonato de sodio y acetato de etilo se añadieron al residuo para extracción. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-N'-etoxi-5-(metilsulfonil)-6-(4-feniltiazol-2-il)picolinimidamida (0,27 g, 0,67 mmol).

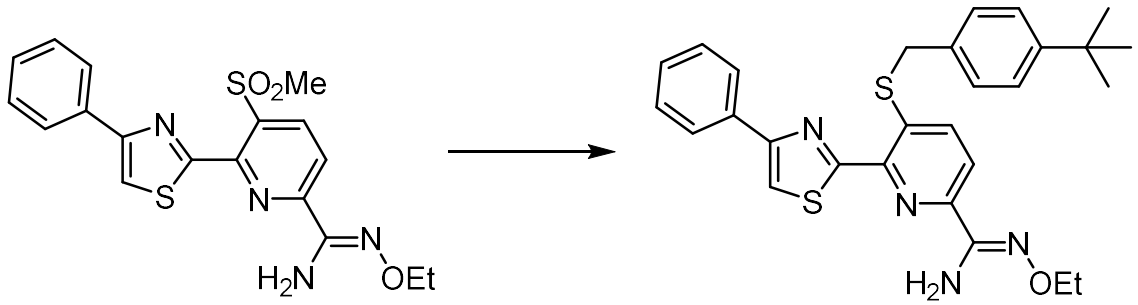
Rendimiento: 87 %

Propiedad física: punto de fusión: 177 a 179 °C

[0489] Ejemplo de producción 12-4

Producción de (Z)-5-((4-(ter-butil)bencil)tio)-N'-etoxi-6-(4-feniltiazol-2-il)picolinimidamida

[Quím. 67]



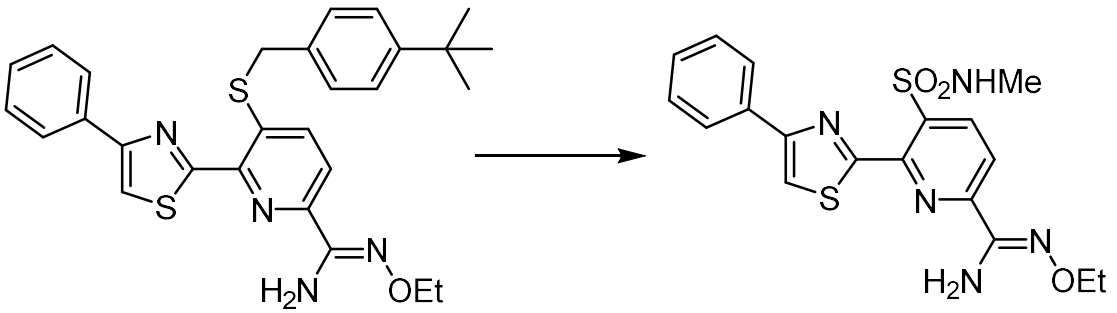
A una solución de (Z)-N'-etoxi-5-(metilsulfonil)-6-(4-feniltiazol-2-il)picolinimidamida (0,23 g, 0,58 mmol) en N,N-

dimetilacetamida (3,0 mL), se añadieron carbonato de cesio (0,38 g, 1,2 mmol) y (4-(ter-butil)fenil)metanotiol (0,16 mL, 0,87 mmol) y la mezcla se agitó a 60 °C durante 1 hora. Después de completar la reacción, agua y acetato de etilo se añadieron a la mezcla de reacción para extracción. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-5-((4-(ter-butil)bencil)tio)-N'-etoxi-6-(4-feniltiazol-2-il)picolinimidamida (0,23 g, 0,46 mmol).
Rendimiento: 80 %
Propiedad física: punto de fusión: 204 a 206 °C

[0490] Ejemplo de producción 12-5

Producción de (Z)-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)-6-(4-feniltiazol-2-il)picolinimidamida (Compuesto N.° 8-2)

[Quím. 68]



A una solución de (Z)-5-((4-(ter-butil)bencil)tio)-N'-etoxi-6-(4-feniltiazol-2-il)picolinimidamida (0,11 g, 0,22 mmol) en cloroformo (5,0 mL), ácido acético (0,038 mL, 0,66 mmol) y agua (0,024 mL, 1,3 mmol) se añadieron y 1,3-dicloro-5,5-dimetilhidantoína (0,13 g, 0,66 mmol) se añadió con enfriamiento en baño de hielo. Tras agitar durante 5 minutos, la mezcla de reacción se añadió gota a gota a una solución metanólica de metilamina (9,8 mol/L, 5,0 mL) y la mezcla se agitó durante 5 minutos. Después de completar la reacción, se añadió agua a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de cloroformo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó

por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)-6-(4-feniltiazol-2-il)picolinimidamida (44 mg, 0,11 mmol).

Rendimiento: 48 %

Propiedad física: punto de fusión: 157 a 158 °C

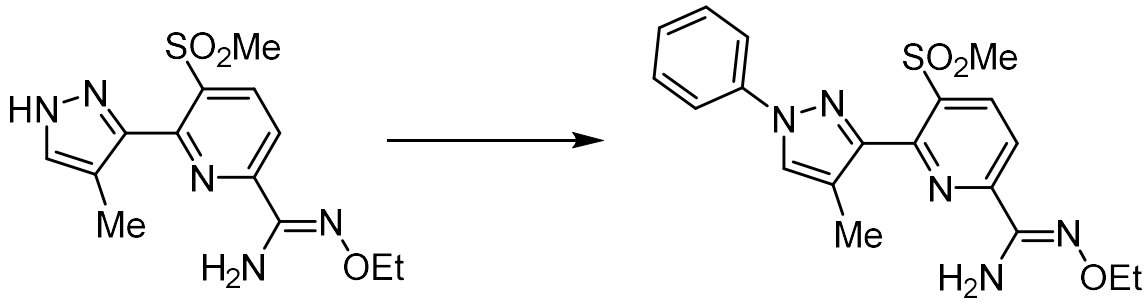
[0491] Ejemplo de producción 13

Producción de (Z)-N'-etoxi-6-(4-metil-1-fenil-1H-pirazol-3-il)-5-(metilsulfonil)picolinimidamida (Compuesto N.° 10-16) y (Z)-N'-etoxi-6-(4-metil-1-fenil-1H-pirazol-3-il)-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (Compuesto N.° 10-2)

Ejemplo de producción 13-1

Producción de (Z)-N'-etoxi-6-(4-metil-1-fenil-1H-pirazol-3-il)-5-(metilsulfonil)picolinimidamida (Compuesto N.° 10-16)

[Quím. 69]



A una solución de (Z)-N'-etoxi-6-(4-metil-1H-pirazol-3-il)-5-(metilsulfonil)picolinimidamida (0,58 g, 1,8 mmol) en N,N-dimetilacetamida (10 mL), yodobenceno (0,20 mL, 1,8 mmol), carbonato de cesio (1,2 g, 3,7 mmol) y acetato de cobre (II) monohidrato (38 mg, 0,19 mmol) se añadieron y la mezcla se agitó a 140 °C durante 3 horas. Después de completar la reacción, una solución saturada acuosa de cloruro de amonio se añadió a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-

N'-etoxi-6-(4-metil-1-fenil-1H-pirazol-3-il)-5-(metilsulfonil)picolinimidamida (0,15 g, 0,37 mmol).

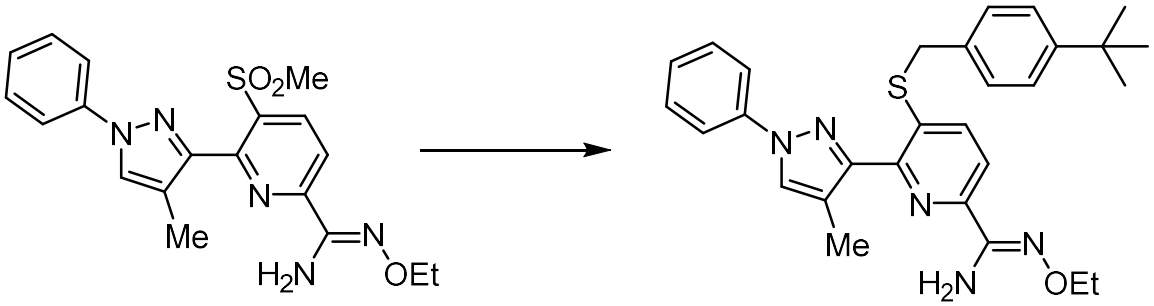
Rendimiento: 21 %

Propiedad física: punto de fusión: 150 a 151 °C

[0492] Ejemplo de producción 13-2

Producción de (Z)-5-((4-(ter-butil)bencil)tio)-N'-etoxi-6-(4-metil-1-fenil-1H-pirazol-3-il)picolinimidamida

[Quím. 70]



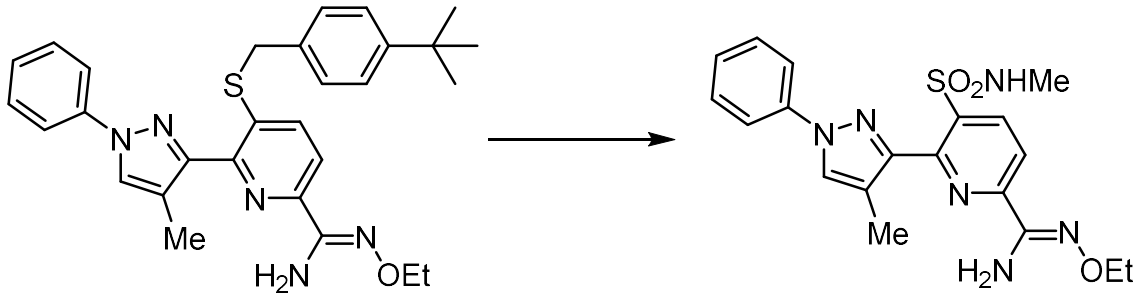
A una solución de (Z)-N'-etoxi-6-(4-metil-1-fenil-1H-pirazol-3-il)-5-(metilsulfonil)picolinimidamida (0,15 g, 0,42 mmol) en N,N-dimetilacetamida (2,0 mL), carbonato de cesio (0,41 g, 1,3 mmol) y (4-(ter-butil)fenil)metanotiol (0,15 mL, 0,82 mmol) se añadieron a temperatura ambiente y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Después de completar la reacción, una solución saturada acuosa de cloruro de amonio se añadió a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-5-((4-(ter-butil)bencil)tio)-N'-etoxi-6-(4-metil-1-fenil-1H-pirazol-3-il)picolinimidamida (0,10 g, 0,21 mmol).

Rendimiento: 50 %

[0493] Ejemplo de producción 13-3

Producción de (Z)-N'-etoxi-6-(4-metil-1-fenil-1H-pirazol-3-il)-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (Compuesto N.° 10-2)

[Quím. 71]



A una solución de (Z)-5-((4-(ter-butil)bencil)tio)-N'-etoxi-6-(4-metil-1-fenil-1H-pirazol-3-il)picolinimidamida (0,10 g, 0,21 mmol) en cloroformo (2,0 mL), 1,3-dicloro-5,5-dimetilhidantoína (0,12 g, 0,62 mmol), ácido acético (40 μL, 0,63 mmol) y agua (25 μL, 1,2 mmol) se añadieron a 0 °C y la mezcla se agitó a la misma temperatura durante 10 minutos. Después de completar la reacción, metilamina (40 % solución en metanol, 0,21 mL, 2,1 mmol) se añadió a la mezcla de reacción y la mezcla luego se agitó durante 10 minutos. Después de completar la reacción, se añadió agua a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de cloroformo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-N'-etoxi-6-(4-metil-1-fenil-1H-pirazol-3-il)-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (67 mg, 0,16 mmol).

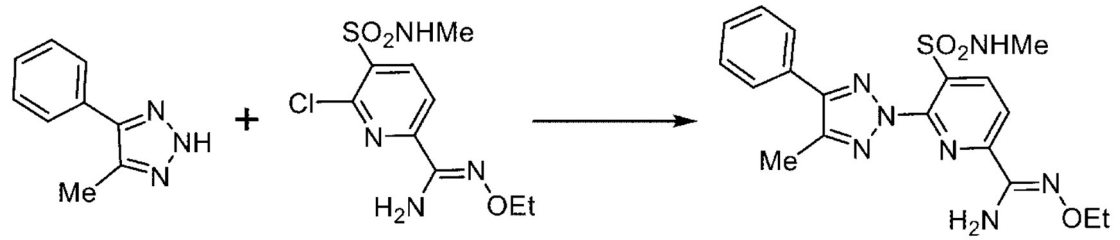
Rendimiento: 76 %

Propiedad física: punto de fusión: 130 a 131 °C

[0494] Ejemplo de producción 14

Producción de (Z)-N'-etoxi-6-(4-metil-5-fenil-2H-1,2,3-triazol-2-il)-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (Compuesto N.° 20-17)

[Quím. 72]



A una solución de (Z)-6-cloro-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (0,12 g, 0,41 mmol) en N,N-dimetilacetamida (2,0 mL), carbonato de potasio (87 mg, 0,87 mmol) y 4-metil-5-fenil-2H-1,2,3-triazol (66 mg, 0,41 mmol) se añadieron y la mezcla se agitó a 130 °C durante 17 horas. Después de completar la reacción, agua y acetato de etilo se añadieron a la mezcla de reacción para extracción. El extracto se concentró al vacío y el residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-N'-etoxi-6-(4-metil-5-fenil-2H-1,2,3-triazol-2-il)-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (28 mg, 0,067 mmol).

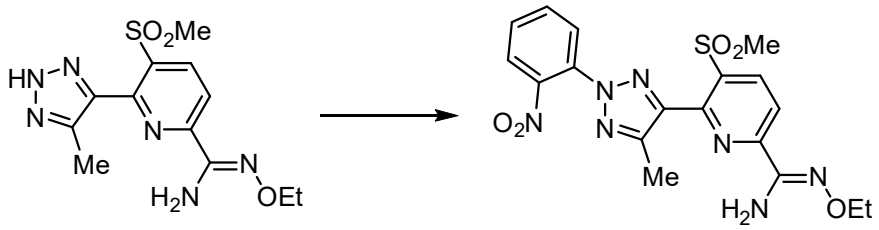
Rendimiento: 16 %

Propiedad física: punto de fusión: 72 a 77 °C

[0495] Ejemplo de producción 15

Producción de (Z)-N'-etoxi-6-(5-metil-2-(2-nitrofenil)-2H-1,2,3-triazol-4-il)-5-(metilsulfonil)picolinimidamida (0,21 g, 0,47 mmol) (Compuesto N.° 11-95)

[Quím. 73]



A una solución de (Z)-N'-etoxi-6-(5-metil-2H-1,2,3-triazol-4-il)-5-(metilsulfonil)picolinimidamida (0,18 g, 0,56 mmol) en N,N-dimetilacetamida (3 mL), carbonato de potasio (0,17 g, 0,85 mmol) y 2-fluoronitrobenceno (0,059 mL, 0,56 mmol) se añadieron y la mezcla se agitó a 130 °C durante 7 horas. La mezcla de reacción se enfrió hasta temperatura ambiente y

acetato de etilo y agua se añadieron para extracción. La capa orgánica se concentró al vacío y el residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice para dar (Z)-N'-etoxi-6-(5-metil-2-(2-nitrofenil)-2H-1,2,3-triazol-4-il)-5-(metilsulfonil)picolinimidamida (0,21 g, 0,47 mmol).

Rendimiento: 83 %

Propiedad física: punto de fusión: 179 a 184 °C

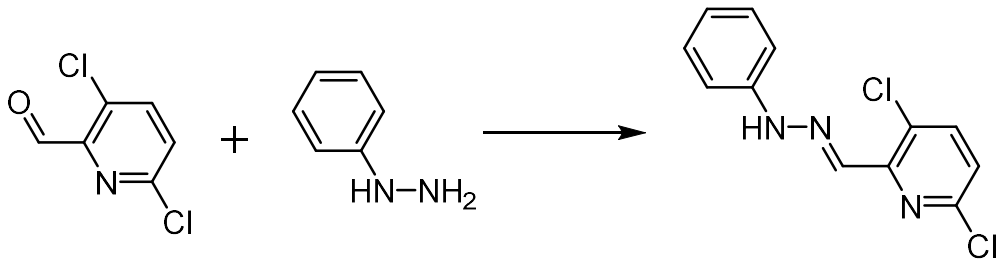
[0496] Ejemplo de referencia 1

Producción de etil 6-ciano-2-(4-metil-5-oxo-1-fenil-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)nicotinato (compuesto de partida para el Ejemplo de producción 1-1)

[0497] Ejemplo de producción de referencia 1-1

Producción de (E)-3,6-dicloro-2-((2-fenilhidrazono)metil)piridina

[Quím. 74]



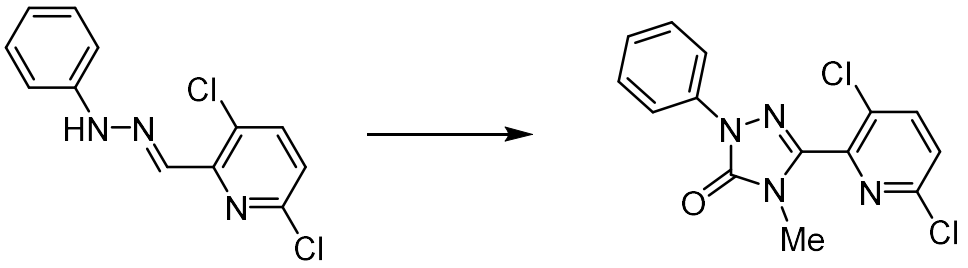
Fenilhidrazina (1,7 mL, 31 mmol) se añadió a una solución etanólica (60 mL) de 3,6-dicloropicolinaldehído (3,0 g, 17 mmol) y la mezcla se agitó durante 3 horas. El sólido resultante se recolectó por filtración, se lavó con etanol y se secó para dar el producto deseado (4,3 g, 16 mmol).

Rendimiento: 96 %

[0498] Ejemplo de producción de referencia 1-2

Producción de 3-(3,6-dicloropiridin-2-il)-4-metil-1-fenil-1H-1,2,4-triazol-5(4H)-ona

[Quím. 75]



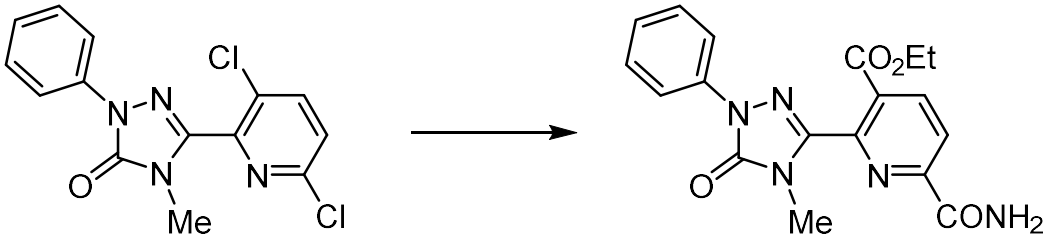
Pentacloruro de fósforo (4,1 g, 20 mmol) se añadió a una solución de (E)-3,6-dicloro-2-((2-fenilhidrazono)metil)piridina (3,5 g, 13 mmol) en cloroformo (65 mL) a temperatura ambiente y la mezcla se agitó a 80 °C durante 3 horas. Se añadió agua a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de cloroformo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se disolvió en tetrahidrofurano (65 mL), a 40 % metilamina solución (6,6 mL, 65 mmol) se añadió y la mezcla se agitó durante 1 hora. Luego se añadió agua a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se disolvió en cloroformo (130 mL), piridina (2,6 mL, 33 mol) y trifosgeno (5,8 g, 20 mmol) se añadieron y la mezcla se agitó durante 1 hora. Se añadió agua a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de cloroformo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 3-(3,6-dicloropiridin-2-il)-4-metil-1-fenil-1H-1,2,4-triazol-5(4H)-ona (1,5 g, 4,7 mmol).

Rendimiento: 36 %

[0499] Ejemplo de producción de referencia 1-3

Producción de etil 6-carbamoil-2-(4-metil-5-oxo-1-fenil-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)nicotinato

[Quím. 76]



A una solución de 3-(3,6-dicloropiridin-2-il)-4-metil-1-fenil-1H-1,2,4-triazol-5(4H)-ona (1,5 g, 4,8 mmol) en etanol (47 mL), 1,4-bis(difenilfosfino)butano(tetrametilenbis(difenilfosfina)) (72 mg, 0,0020 mmol), dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II) (67 mg, 0,0010 mmol) y trietilamina (2,0 mL, 1,4 mmol) se añadieron y la mezcla se agitó bajo una atmósfera de monóxido de carbono de 4 MPa a 130 °C durante 3 horas. La mezcla de reacción se filtró y el filtrado se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice. Una solución al 4 % de amoníaco-etanol (50 mL) se añadió al sólido resultante y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Se añadió agua a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar etil 6-carbamoil-2-(4-metil-5-oxo-1-fenil-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)nicotinato (0,78 g, 2,1 mmol).

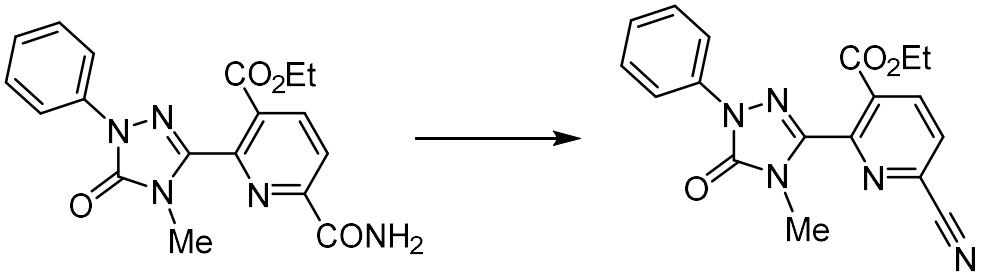
Rendimiento: 45 %

Propiedad física: punto de fusión: 137 a 138 °C

[0500] Ejemplo de producción de referencia 1-4

Producción de etil 6-ciano-2-(4-metil-5-oxo-1-fenil-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)nicotinato

[Quím. 77]



A una solución de etil 6-carbamoil-2-(4-metil-5-oxo-1-fenil-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)nicotinato (0,78 g, 2,1 mmol) en N,N-dimetilformamida (21 mL), cloruro de fosforilo (0,79 mL, 8,5 mmol) se añadió a temperatura ambiente y la mezcla se agitó durante 1 hora. Una solución saturada acuosa de hidrógeno-carbonato de sodio se añadió a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío para dar etil 6-ciano-2-(4-metil-5-oxo-1-fenil-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)nicotinato (0,73 g, 2,1 mmol).

Rendimiento: 100 %

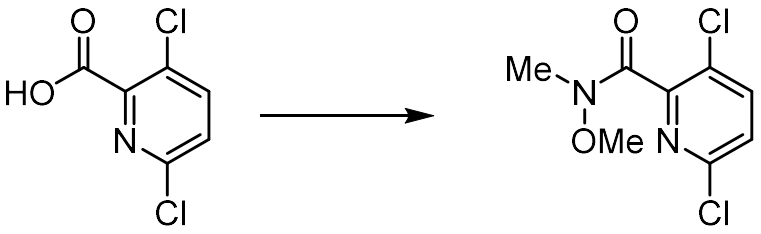
Propiedad física: punto de fusión: 138 a 139 °C

[0501] Ejemplo de referencia 2

Producción de etil 6-ciano-2-(5-metil-2-feniltiazol-4-il)nicotinato (compuesto de partida para el Ejemplo de producción 2)

Ejemplo de producción de referencia 2-1

Producción de 3,6-dicloro-N-metoxi-N-metilpicolinamida [Quím. 78]



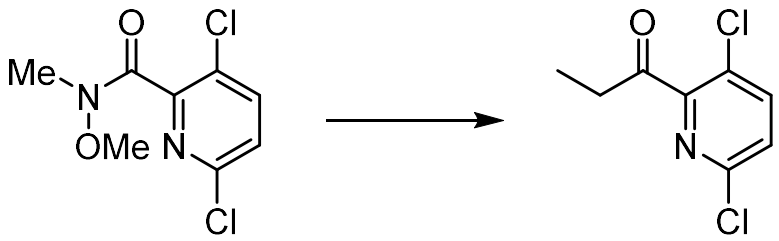
N,N-dimetilformamida (0,4 mL, 5,3 mmol) y cloruro de oxalilo (5,0 mL, 57 mmol) se añadieron a una solución de ácido 3,6-

dicloropicolínico (10 g, 52 mmol) en tetrahidrofurano (0,10 L) a temperatura ambiente y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 0,5 horas. La mezcla de reacción se concentró al vacío y cloroformo (0,10 L), trietilamina (28 mL, 0,21 mol) y N-metoxi-N-metilamina clorhidrato (6,1 g, 62 mmol) se añadieron al residuo. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Después de completar la reacción, se añadió agua a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 3,6-dicloro-N-metoxi-N-metilpicolinamida (12 g, 52 mmol).
Rendimiento: 100 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 7,70 (d, 1H), 7,33 (d, 1H), 3,61 (s, 3H), 3,39 (s, 3H)

[0502] Ejemplo de producción de referencia 2-2

Producción de 1-(3,6-dicloropiridin-2-il)propan-1-ona [Quím. 79]



A una solución de 3,6-dicloro-N-metoxi-N-metilpicolinamida (5,0 g, 21 mmol) en tetrahidrofurano (0,10 L), una solución en éter dietílico de bromuro de etilmagnesio (27 mL, 81 mmol) se añadió a 0 °C y la mezcla se agitó durante 2 horas. Después de completar la reacción, una solución saturada acuosa de cloruro de amonio se añadió a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía

en columna de gel de sílice para dar 1-(3,6-dicloropiridin-2-il)propan-1-ona (1,8 g, 8,7 mmol).

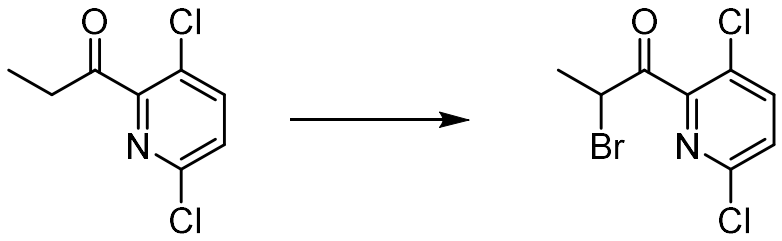
Rendimiento: 41 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 7,74 (d, 1H), 7,39 (d, 1H), 3,10 (q, 2H), 1,20 (t, 3H)

[0503] Ejemplo de producción de referencia 2-3

Producción de 2-bromo-1-(3,6-dicloropiridin-2-il)propan-1-ona

[Quím. 80]



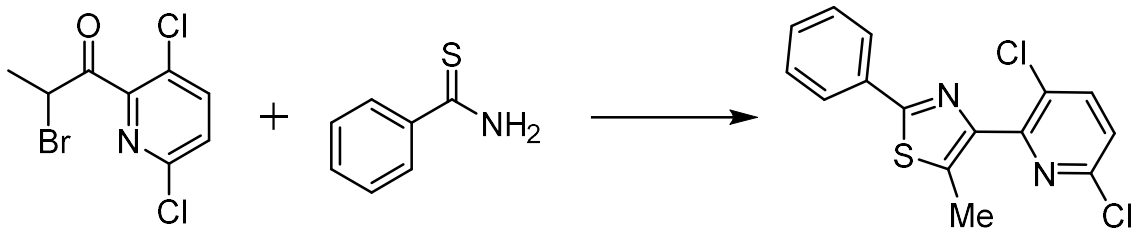
Bromo (0,30 mL, 5,6 mmol) se añadió a una solución de 1-(3,6-dicloropiridin-2-il)propan-1-ona (1,1 g, 5,2 mmol) en ácido acético (17 mL) y la mezcla se agitó a 120 °C durante 2 horas. Después de completar la reacción, la mezcla de reacción se concentró al vacío. Se añadió agua al residuo y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 2-bromo-1-(3,6-dicloropiridin-2-il)propan-1-ona (1,2 g, 4,3 mmol).

Rendimiento: 85 %

[0504] Ejemplo de producción de referencia 2-4

Producción de 4-(3,6-dicloropiridin-2-il)-5-metil-2-feniltiazol

[Quím. 81]



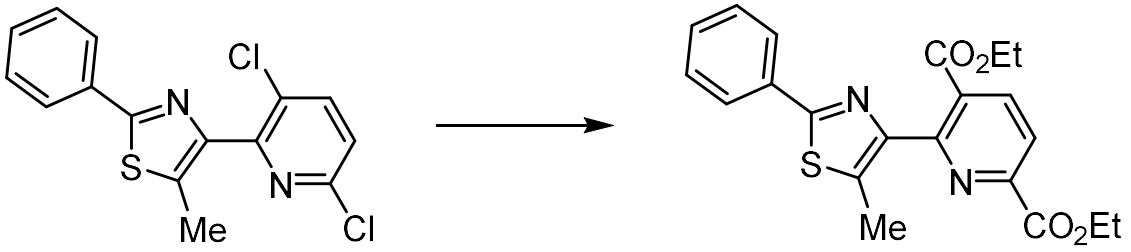
Benzotioamida (1,1 g, 3,6 mmol) se añadió a una solución de 2-bromo-1-(3,6-dicloropiridin-2-il)propan-1-ona (0,51 g, 3,6 mmol) en etanol (7,0 mL) y la mezcla se agitó a 80 °C durante 2,5 horas. Después de completar la reacción, la mezcla de reacción se concentró al vacío. Una solución saturada acuosa de hidrógeno-carbonato de sodio se añadió al residuo y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 4-(3,6-dicloropiridin-2-il)-5-metil-2-feniltiazol (0,95 g, 3,0 mmol).

Rendimiento: 75 %

[0505] Ejemplo de producción de referencia 2-5

Producción de dietil 6-(5-metil-2-feniltiazol-4-il)piridin-2,5-dicarboxilato

[Quím. 82]



En un recipiente de reacción de autoclave, se colocaron 4-(3,6-dicloropiridin-2-il)-5-metil-2-feniltiazol (0,95 g, 3,0 mmol), diclorobis(trifenilfosfina)paladio (42 mg, 0,060 mmol), bis(difenilfosfino)butano (51 mg, 0,12 mmol), trietilamina (1,0 mL, 7,4 mmol) y etanol (10 mL) y la mezcla se agitó bajo una atmósfera de monóxido de carbono (4,0 MPa) a 130 °C durante 3 horas. La mezcla de reacción se concentró al vacío, una solución saturada acuosa de hidrógeno-carbonato de sodio se añadió al residuo y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío para dar dietil 6-(5-

metil-2-feniltiazol-4-il)piridin-2,5-dicarboxilato (0,82 g, 2,1 mmol).

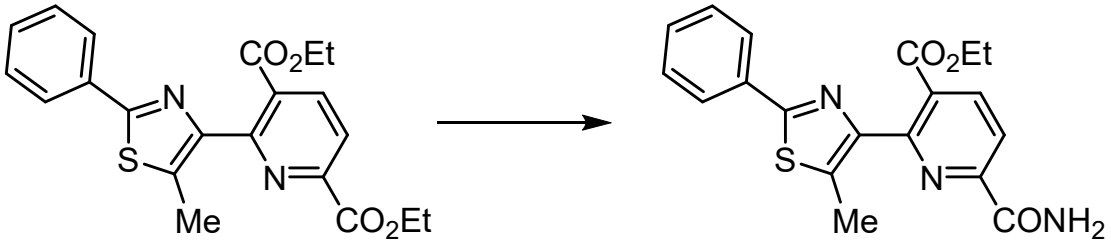
Rendimiento: 70 %

Propiedad física: punto de fusión: 69 a 70 °C

[0506] Ejemplo de producción de referencia 2-6

Producción de etil 6-carbamoil-2-(5-metil-2-feniltiazol-4-il)nicotinato

[Quím. 83]



A una solución de dietil 6-(5-metil-2-feniltiazol-4-il)piridin-2,5-dicarboxilato (0,80 g, 2,0 mmol) en etanol (10 mL), se añadió amoníaco (28 % solución en agua, 10 mL) a temperatura ambiente y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. La mezcla de reacción se filtró y el residuo se lavó con etanol para dar etil 6-carbamoil-2-(5-metil-2-feniltiazol-4-il)nicotinato (0,74 g, 2,0 mmol).

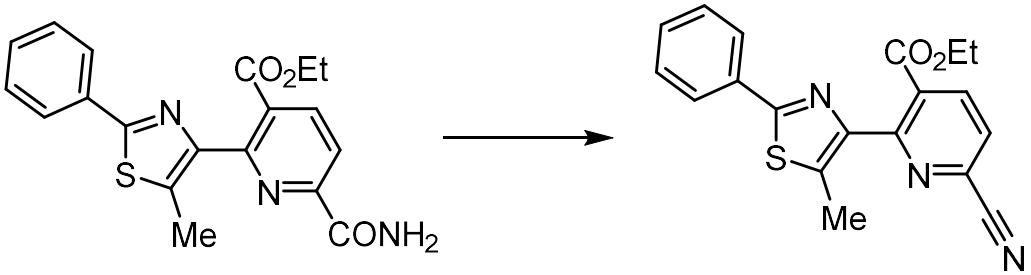
Rendimiento: 100 % (en 3 etapas)

Propiedad física: punto de fusión: 147 a 148 °C

[0507] Ejemplo de producción de referencia 2-7

Producción de etil 6-ciano-2-(5-metil-2-feniltiazol-4-il)nicotinato

[Quím. 84]



A una solución de etil 6-carbamoil-2-(5-metil-2-feniltiazol-4-il)nicotinato (0,50 g, 1,4 mmol) en N,N-dimetilformamida (6,8 mL), cloruro de fosforilo (0,5 mL, 5,4 mmol) se añadió a 0 °C y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. Después de completar la reacción, una solución saturada acuosa de hidrógeno-carbonato de sodio se añadió a la mezcla de reacción a 0 °C y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío para dar etil 6-ciano-2-(5-metil-2-feniltiazol-4-il)nicotinato (0,48 g, 1,4 mmol).

Rendimiento: 100 %

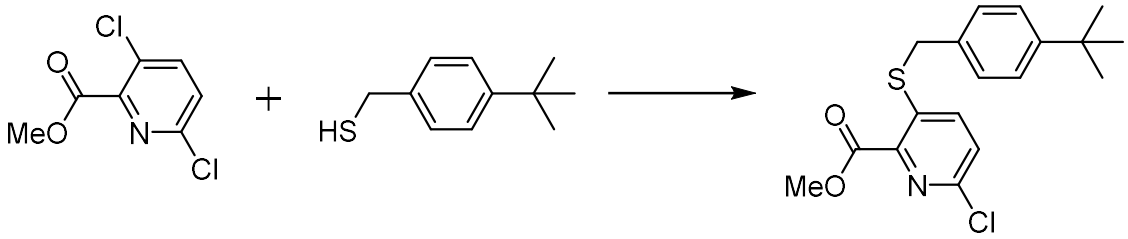
[0508] Ejemplo de referencia 3

Producción de 6-ciano-N-metil-2-(1-metil-3-fenil-1H-1,2,4-triazol-5-il)piridin-3-sulfonamida (compuesto de partida para el Ejemplo de producción 3)

Ejemplo de producción de referencia 3-1

Producción de metil 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloropicolinato

[Quím. 85]



Hidruro de sodio (60 % p, 4,70 g, 0,12 mol) se añadió a una solución de metil 3,6-dicloropicolinato (20 g, 97 mmol) en tetrahidrofurano (0,50 L) con enfriamiento en un baño de hielo y la mezcla se agitó durante 15 minutos. 4-(Ter-butil)fenil)metanotiol (18 mL, 0,10 mol) se añadió gota a gota y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas. Una solución saturada acuosa de cloruro de amonio se añadió a la mezcla de reacción con enfriamiento en un baño de hielo y

se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y luego se concentró. El residuo se lavó con hexano para dar metil 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloropicolinato (30 g, 86 mmol).

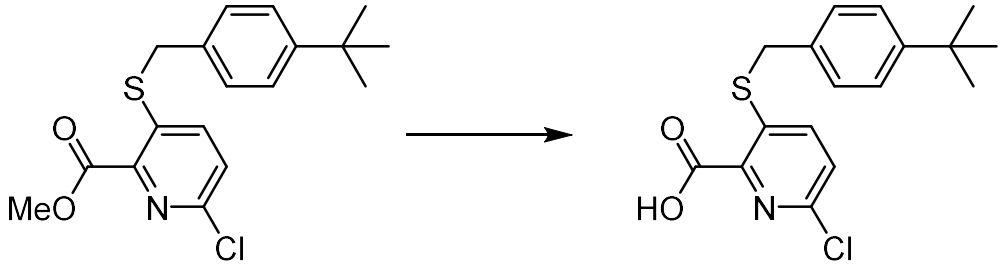
Rendimiento: 88 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 7,66-7,63 (m, 1H), 7,37-7,28 (m, 5H), 4,12 (s, 2H), 3,98 (s, 3H), 1,31 (s, 9H)

[0509] Ejemplo de producción de referencia 3-2

Producción de ácido 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloropicolínico

[Quím. 86]



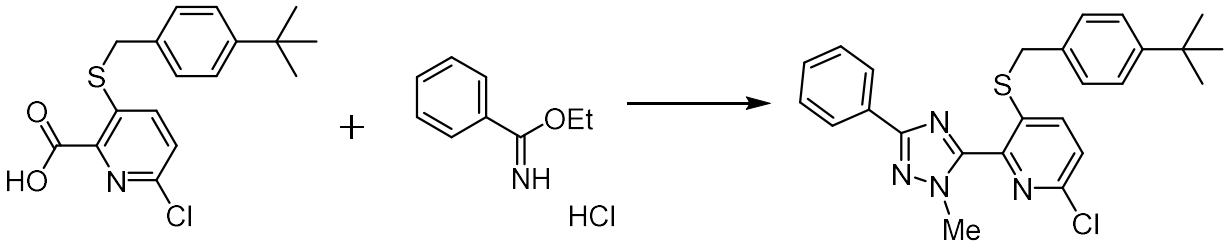
A una solución de metil 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloropicolinato (30 g, 86 mmol) en metanol (200 mL) y tetrahidrofurano (50 mL), se añadió hidróxido de litio (4,3 g, 0,10 mol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 6 horas. La mezcla de reacción se concentró al vacío y ácido clorhídrico 2 M se añadió al residuo. El sólido resultante se recolectó por filtración y se lavó con hexano para dar ácido 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloropicolínico (30 g, 85 mmol).

Rendimiento: 100 %

[0510] Ejemplo de producción de referencia 3-3

Producción de 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloro-2-(1-metil-3-fenil-1H-1,2,4-triazol-5-il)piridina

[Quím. 87]



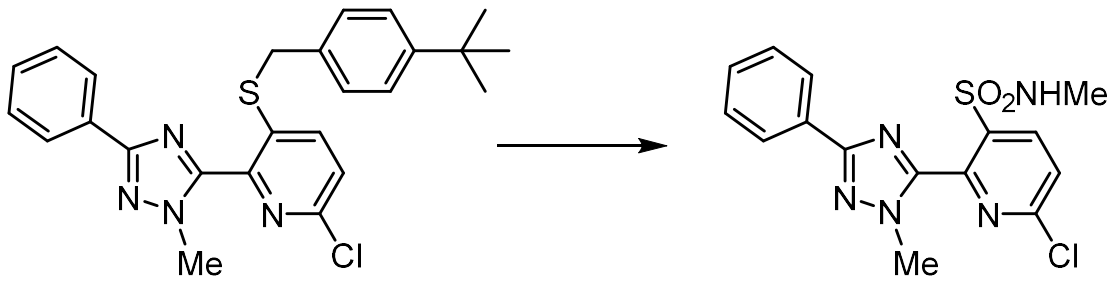
A una solución de ácido 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloropicolínico (10 g, 30 mmol) y etil bencimidato clorhidrato (5,6 g, 30 mmol) en N,N-dimetilformamida (60 mL), N,N-diisopropiletilamina (15 mL, 90 mmol) y hexafluorofosfato de 1-[bis(dimetilamino)metilen]-1H-benzotriazolio 3-óxido (17 g, 45 mmol) se añadieron y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Se añadió agua a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de cloroformo. La capa orgánica se lavó con salmuera saturada, se secaron sobre sulfato de sodio anhidro y se concentraron al vacío. El residuo se disolvió en etanol (60 mL), se añadió metilhidrazina (2,4 mL, 45 mmol) y la mezcla se calentó a reflujo durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró al vacío y el residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloro-2-(1-metil-3-fenil-1H-1,2,4-triazol-5-il)piridina (2,1 g, 4,6 mmol).

Rendimiento: 5 %

[0511] Ejemplo de producción de referencia 3-4

Producción de 6-cloro-N-metil-2-(1-metil-3-fenil-1H-1,2,4-triazol-5-il)piridin-3-sulfonamida

[Quím. 88]



A una solución de 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloro-2-(1-metil-3-fenil-1H-1,2,4-triazol-5-il)piridina (2,1 g, 4,6 mmol) en cloroformo (50 mL), agua (0,50 mL, 27 mmol) y ácido acético (0,80 mL, 14 mmol) se añadieron y 1,3-dicloro-5,5-dimetilhidantoína (2,7 g, 14 mmol) se añadió con enfriamiento en baño de hielo. Después de confirmar la desaparición del compuesto de partida, la mezcla de reacción se añadió gota a gota a una solución de metilamina-metanol (9,8 mol/L, 20 mL) con enfriamiento en un baño de hielo y la mezcla se agitó durante 30 minutos. Una solución saturada acuosa de cloruro de amonio luego se añadió y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se concentró y el residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 6-cloro-N-metil-2-(1-metil-3-fenil-1H-1,2,4-triazol-5-il)piridin-3-sulfonamida (0,70 g, 1,9 mmol).

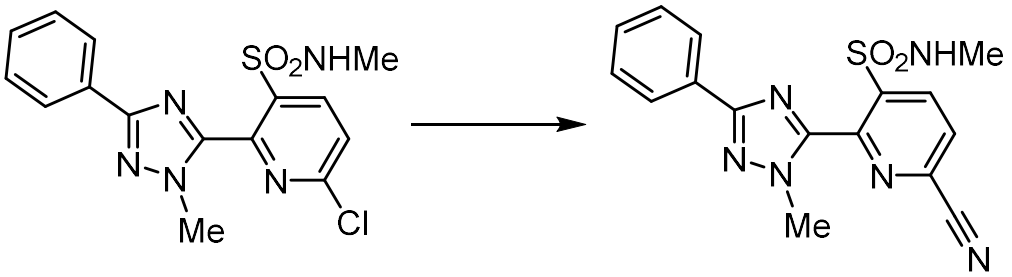
Rendimiento: 42 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 8,46 (d, 1H), 8,14 (q, 1H), 8,00-7,95 (m, 2H), 7,59 (d, 1H), 7,50-7,41 (m, 3H), 4,18 (s, 3H), 2,80 (s, 3H)

[0512] Ejemplo de producción de referencia 3-5

Producción de 6-ciano-N-metil-2-(1-metil-3-fenil-1H-1,2,4-triazol-5-il)piridin-3-sulfonamida

[Quím. 89]



A una solución de 6-cloro-N-metil-2-(1-metil-3-fenil-1H-1,2,4-triazol-5-il)piridin-3-sulfonamida (0,30 g, 0,83 mmol) en dimetilsulfóxido (2,0 mL), cianuro de sodio (61 mg, 1,2 mmol) y 1,4-diazabiciclo[2,2,2]octano (47 mg, 0,4 mmol) se añadieron y la mezcla se agitó a 40 °C durante 2 horas. Salmuera saturada

se añadió y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se concentró al vacío y el residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 6-ciano-N-metil-2-(1-metil-3-fenil-1H-1,2,4-triazol-5-il)piridin-3-sulfonamida (0,16 g, 0,45 mmol).

Rendimiento: 55 %

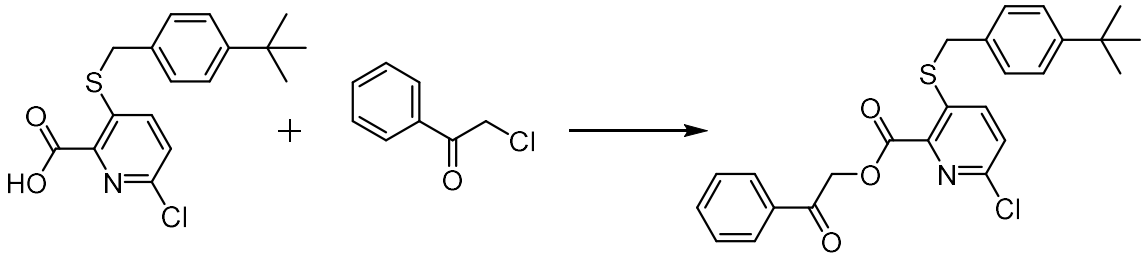
[0513] Ejemplo de referencia 4

Producción de 6-ciano-N-metil-2-(1-metil-4-fenil-1H-imidazol-2-il)piridin-3-sulfonamida (compuesto de partida para el Ejemplo de producción 4)

Ejemplo de producción de referencia 4-1

Producción de 2-oxo-2-feniletil 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloropicolinato

[Quím. 90]



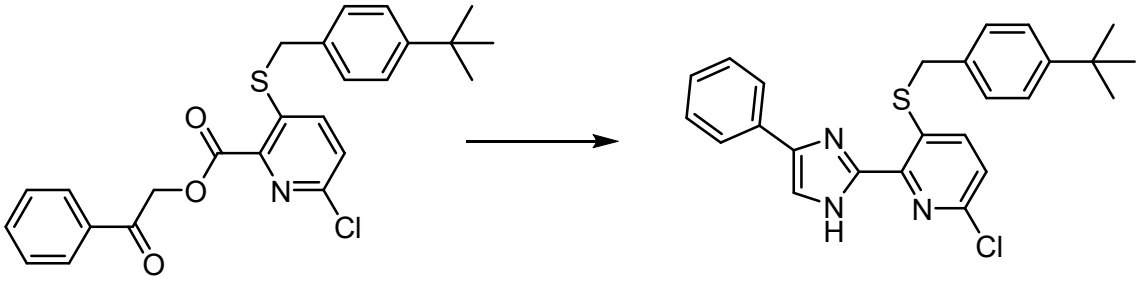
A una solución de 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloropicolínico (6,6 g, 20 mmol) en N,N-dimetilformamida (28 mL), cloruro de fenacilo (3,0 g, 20 mmol) y N,N-diisopropiletilamina (8,3 mL, 49 mmol) se añadieron bajo enfriamiento con hielo y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Después de completar la reacción, agua y acetato de etilo se añadieron para extracción. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y luego se concentró al vacío para dar 2-oxo-2-feniletil 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloropicolinato (7,8 g, 17 mmol) en forma de un producto crudo.

Rendimiento: 88 %

[0514] Ejemplo de producción de referencia 4-2

Producción de 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloro-2-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)piridina

[Quím. 91]



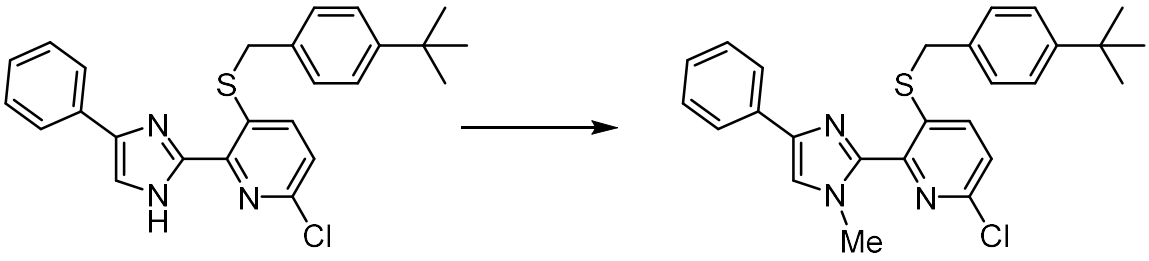
A una solución de 2-oxo-2-feniletil 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloropicolinato (7,8 g, 17 mmol) en ácido acético (86 mL), amonio acetato (27 g, 0,34 mol) se añadió y la mezcla se agitó y se calentó a reflujo. La mezcla de reacción se concentró al vacío. Una solución saturada acuosa de hidrógeno-carbonato de sodio y acetato de etilo se añadieron al residuo para extracción. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloro-2-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)piridina (7,4 g, 17 mmol).

Rendimiento: 99 %

[0515] Ejemplo de producción de referencia 4-3

Producción de 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloro-2-(1-metil-4-fenil-1H-imidazol-2-il)piridina

[Quím. 92]



A una solución de 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloro-2-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)piridina (7,4 g, 17 mmol) en tetrahidrofurano (90 mL), ter-butóxido de potasio (2,1 g, 18,8

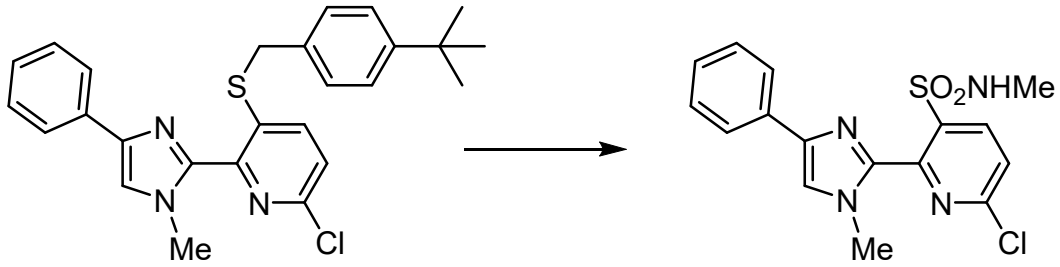
mmol) y yodometano (1,2 mL, 19 mmol) se añadieron bajo enfriamiento con hielo y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Una solución saturada acuosa de cloruro de amonio y acetato de etilo se añadieron para extracción. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio y luego se concentró. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloro-2-(1-metil-4-fenil-1H-imidazol-2-il)piridina (4,6 g, 10 mmol).

Rendimiento: 59 %

[0516] Ejemplo de producción de referencia 4-4

Producción de 6-cloro-N-metil-2-(1-metil-4-fenil-1H-imidazol-2-il)piridin-3-sulfonamida

[Quím. 93]



A una solución de 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloro-2-(1-metil-4-fenil-1H-imidazol-2-il)piridina (2,0 g, 4,5 mmol) en cloroformo (50 mL), agua (0,50 mL, 27 mmol) y ácido acético (0,77 mL, 13 mmol) se añadieron y 1,3-dicloro-5,5-dimetilhidantoína (2,6 g, 13 mmol) se añadió con enfriamiento en baño de hielo. Después de confirmar la desaparición del compuesto de partida, la mezcla de reacción se añadió gota a gota a una solución de metilamina-metanol (30 mL) con enfriamiento en un baño de hielo y la mezcla se agitó durante 30 minutos. Una solución saturada acuosa de cloruro de amonio se añadió y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se concentró y el residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 6-cloro-

N-metil-2-(1-metil-4-fenil-1H-imidazol-2-il)piridin-3-sulfonamida (0,51 mg, 1,4 mmol).

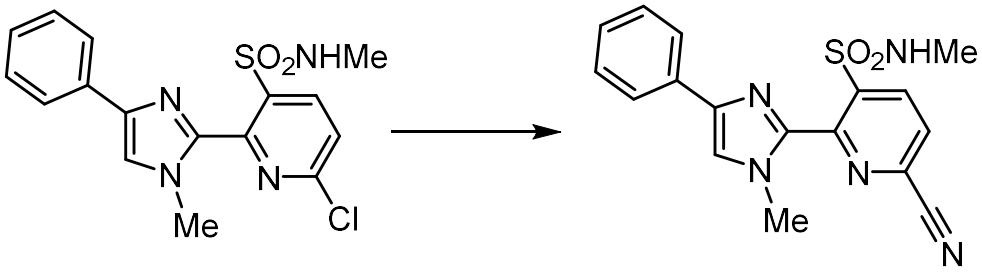
Rendimiento: 31 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 8,95 (q, 1H), 8,42 (d, 1H), 7,67-7,63 (m, 2H), 7,48-7,38 (m, 3H), 7,33-7,29 (m, 2H), 3,97 (s, 3H), 2,78 (d, 3H)

[0517] Ejemplo de producción de referencia 4-5

Producción de 6-ciano-N-metil-2-(1-metil-4-fenil-1H-imidazol-2-il)piridin-3-sulfonamida

[Quím. 94]



A una solución de 6-cloro-N-metil-2-(1-metil-4-fenil-1H-imidazol-2-il)piridin-3-sulfonamida (0,43 g, 1,2 mmol) en dimetilsulfóxido (10 mL), cianuro de sodio (70 mg, 1,4 mmol) y 1,4-diazabiciclo[2,2,2]octano (67 mg, 0,60 mmol) se añadieron y la mezcla se agitó a 40 °C durante 2 horas. Salmuera saturada se añadió y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se concentró al vacío y el residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 6-ciano-N-metil-2-(1-metil-4-fenil-1H-imidazol-2-il)piridin-3-sulfonamida (0,10 g, 0,28 mmol).

Rendimiento: 24 %

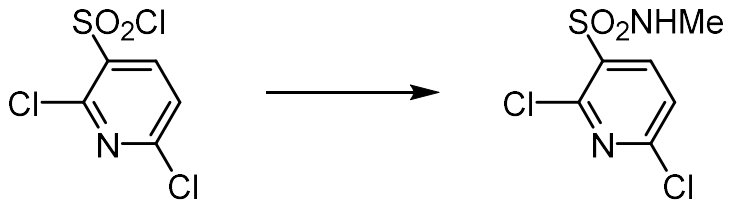
[0518] Ejemplo de referencia 5

Producción de (Z)-6-cloro-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (compuesto de partida para los Ejemplos de producción 5 y 6)

Ejemplo de producción de referencia 5-1

Producción de 2,6-dicloro-N-metilpiridin-3-sulfonamida

[Quím. 95]



A una solución de cloruro de 2,6-dicloropiridin-3-sulfonilo en tetrahidrofurano (0,20 L), una solución al 7,0 % en tetrahidrofurano de metilamina (31 mL, 61 mmol) se añadió bajo enfriamiento con hielo y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Después de completar la reacción, una solución saturada acuosa de cloruro de amonio y acetato de etilo se añadieron a la mezcla de reacción para extracción. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 2,6-dicloro-N-metilpiridin-3-sulfonamida (6,4 g, 27 mmol).

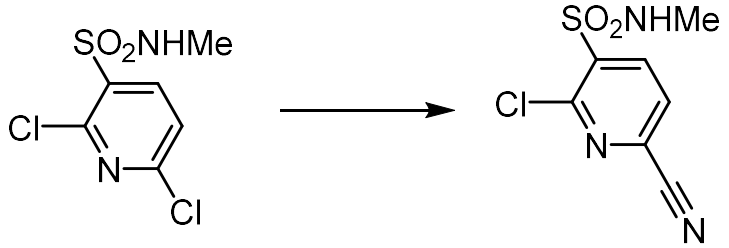
Rendimiento: 44 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 8,35 (d, 1H), 7,46 (d, 1H), 5,10 (br.s, 1H), 2,71 (d, 3H)

[0519] Ejemplo de producción de referencia 5-2

Producción de 2-cloro-6-ciano-N-metilpiridin-3-sulfonamida

[Quím. 96]



A una solución de 2,6-dicloro-N-metilpiridin-3-sulfonamida (9,8 g, 40 mmol) y 1,4-diazabiciclo[2,2,2]octano (0,81 g, 7,2 mmol) en dimetilsulfóxido (0,10 L), una solución de cianuro de sodio (2,3 g, 47 mmol) en agua (10 mL) se añadió gota a gota y la mezcla se agitó a temperatura ambiente. Después

de completar la reacción, agua y acetato de etilo se añadieron a la mezcla de reacción para extracción. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 2-cloro-6-ciano-N-metilpiridin-3-sulfonamida (7,7 g, 33 mmol).

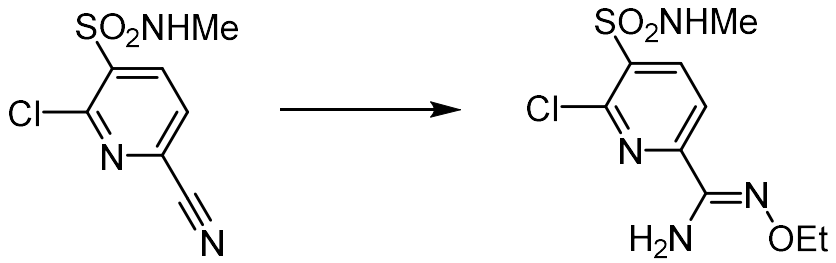
Rendimiento: 82 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 8,56 (d, 1H), 7,82 (d, 1H), 5,07 (q, 1H), 2,74 (d, 3H)

[0520] Ejemplo de producción de referencia 5-3

Producción de (Z)-6-cloro-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida

[Quím. 97]



A una solución de 2-cloro-6-ciano-N-metilpiridin-3-sulfonamida (1,1 g, 2,9 mmol) en metanol (20 mL), a 28 % p metanol solución de metóxido de sodio (0,59 mL, 2,9 mmol) se añadió y la mezcla se agitó a temperatura ambiente. Después de confirmar la desaparición del compuesto de partida, se añadió clorhidrato de O-etilhidroxilamina (0,37 g, 3,8 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente. Después de completar la reacción, agua y acetato de etilo se añadieron para extracción. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y luego se concentró al vacío para dar (Z)-6-cloro-N'-etoxi-5-(N-metilsulfamoil)picolinimidamida (1,2 g, 2,9 mmol).

Rendimiento: 100 %

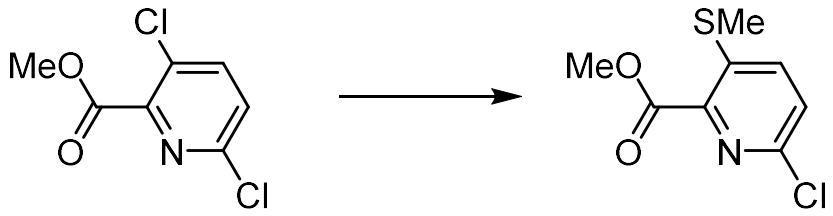
Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 8,35 (d, 1H), 8,07 (d, 1H), 5,45 (br.s, 2H), 5,05 (q, 1H), 4,20 (q, 2H), 2,68 (d, 3H), 1,34 (t, 3H)

[0521] Ejemplo de referencia 6

Producción de (E)-1-(6-cloro-5-(metilsulfonil)piridin-2-il)etanona O-etil oxima (compuesto de partida para el Ejemplo de producción 7)

Ejemplo de producción de referencia 6-1

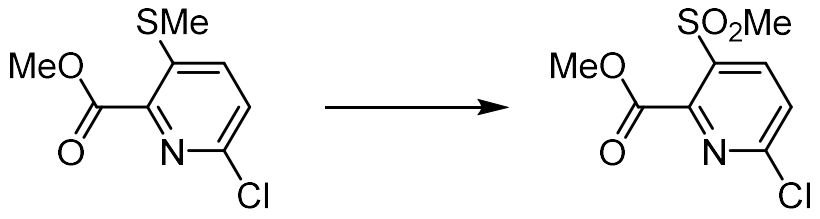
Producción de metil 6-cloro-3-(metilsulfanil)picolinato [Quím. 98]



A una solución de metil 3,6-dicloropicolinato (21 g, 0,10 mol) en N,N-dimetilformamida (0,20 L), metanotiolato de sodio (8,2 g, 0,11 mol) se añadió lentamente a 0 °C y la mezcla se agitó a 0 °C durante 2 horas. Después de completar la reacción, se añadió agua a la mezcla de reacción. El sólido precipitado se recolectó por filtración, se lavó con etanol y se secó para dar metil 6-cloro-3-(metilsulfanil)picolinato (18 g, 80 mmol). Rendimiento: 80 %

[0522] Ejemplo de producción de referencia 6-2

Producción de metil 6-cloro-3-(metilsulfonil)picolinato [Quím. 99]



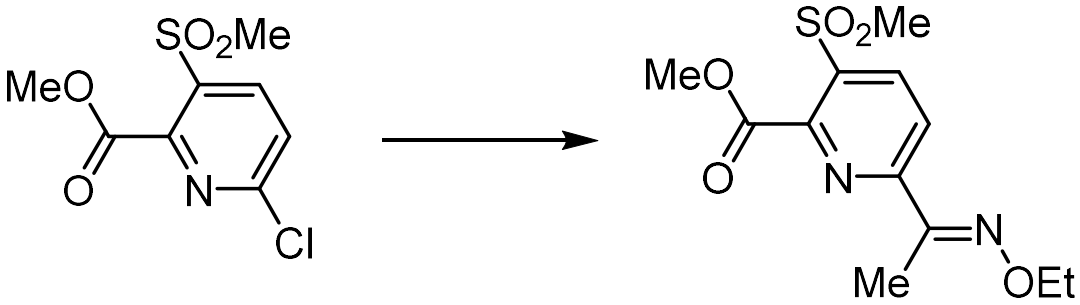
Ácido m-cloroperbenzoico (22 g, 82 mmol) se añadió a una solución en cloroformo (160 mL) de metil 6-cloro-3-(metilsulfanil)picolinato (7,2 g, 33 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Después de completar la reacción, una solución saturada acuosa de hidrógeno-carbonato de sodio y a saturado acuoso sodio tiosulfato solución

se añadieron a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de cloroformo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío para dar metil 6-cloro-3-(metilsulfonil)picolinato (8,1 g, 33 mmol).
Rendimiento: 99 %

[0523] Ejemplo de producción de referencia 6-3

Producción de (E)-metil 6-(1-(etoxiimino)etil)-3-(metilsulfonil)picolinato

[Quím. 100]



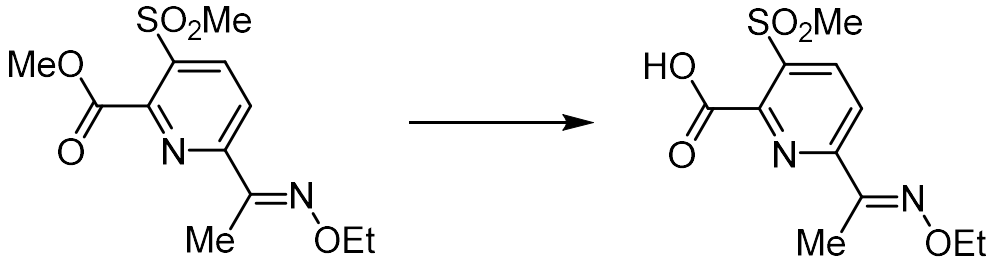
A una solución en 1,2-dimetoxietano (0,20 L) de metil 6-cloro-3-(metilsulfonil)picolinato (11 g, 41 mmol), tributil(1-etoxivinil)estaño (17 mL, 49 mmol) y tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0) (2,5 g, 2,2 mmol) se añadieron bajo una atmósfera de argón a temperatura ambiente y la mezcla se agitó a 110 °C durante 3 horas. Después de la mezcla de reacción se dejó llegar hasta temperatura ambiente, se añadieron tetrahidrofurano (0,10 L) y 2 N ácido clorhídrico (0,10 L) y la mezcla se agitó a 50 °C durante 3 horas. Después de completar la reacción, acetato de etilo y agua se añadieron a la mezcla de reacción para extracción. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar metil 6-acetil-3-(metilsulfonil)picolinato. El metil 6-acetil-3-(metilsulfonil)picolinato obtenido se disolvió en cloroformo (0,20 L) y piridina (60 mL) y clorhidrato de O-etilhidroxilamina (5,94 g, 60,9 mmol) se añadieron. La mezcla se agitó a

temperatura ambiente durante la noche. Ácido clorhídrico 1 N se añadió a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de cloroformo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío para dar (E)-metil 6-(1-(etoxiimino)etil)-3-(metilsulfonil)picolinato en forma de un producto crudo. Este producto crudo se usó en la siguiente etapa sin ulterior purificación.

[0524] Ejemplo de producción de referencia 6-4

Producción de (E)-6-(1-(etoxiimino)etil)-3-(metilsulfonil)picolínico

[Quím. 101]



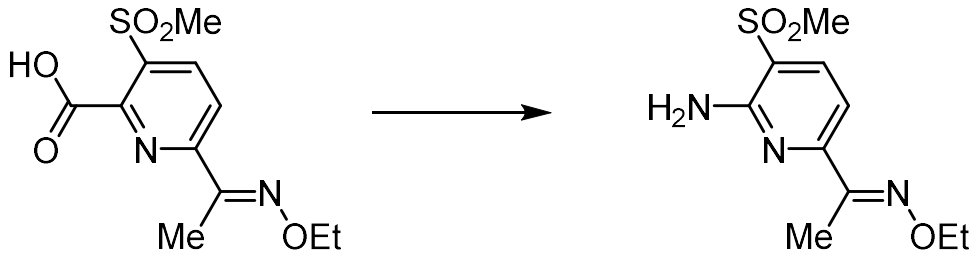
A una solución metanólica (0,15 L) de (E)-metil 6-(1-(etoxiimino)etil)-3-(metilsulfonil)picolinato, una solución 4 M acuosa de hidróxido de litio (16 mL) se añadió a temperatura ambiente y la mezcla se agitó durante 1 hora. Ácido clorhídrico 2 N y cloroformo se añadieron a la mezcla de reacción para extracción. A 2 N acuoso hidróxido de sodio solución se añadió y la capa acuosa se separó. Una solución acuosa 2 N de ácido clorhídrico se añadió a la capa acuosa y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo en condiciones ácidas. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. Metil ter-butil éter y hexano se añadieron al residuo y el sólido precipitado se recolectó por filtración para dar ácido (E)-6-(1-(etoxiimino)etil)-3-(metilsulfonil)picolínico (8,4 g, 32 mmol).

Rendimiento: 80 % (en 3 etapas)

[0525] Ejemplo de producción de referencia 6-5

Producción de (E)-1-(6-amino-5-(metilsulfonil)piridin-2-il)etanona O-etil oxima

[Quím. 102]



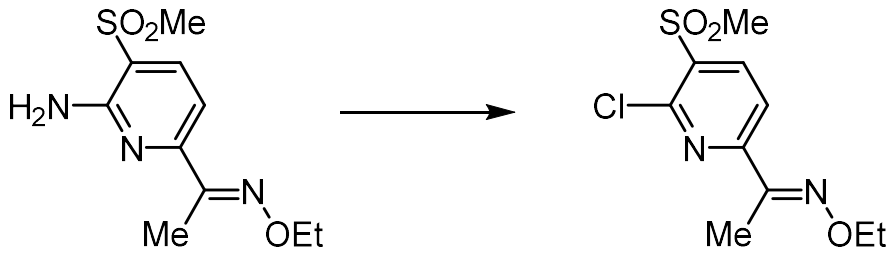
A una solución de alcohol ter-butílico (20 mL) de ácido (E)-6-(1-(etoxiimino)etil)-3-(metilsulfonil)picolínico (1,0 g, 3,5 mmol), trietilamina (0,73 mL, 5,2 mmol) y difenilfosforil azida (1,2 mL, 5,2 mmol) se añadieron y la mezcla se agitó a 100 °C durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró al vacío. Se añadió agua al residuo y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. Ácido trifluoroacético (10 mL) se añadió al residuo y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Después de completar la reacción, la mezcla de reacción se concentró al vacío. Una solución saturada acuosa de hidrógeno-carbonato de sodio se añadió al residuo y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (E)-1-(6-amino-5-(metilsulfonil)piridin-2-il)etanona O-etil oxima (0,68 g, 2,6 mmol).

Rendimiento: 75 %

[0526] Ejemplo de producción de referencia 6-6

Producción de (E)-1-(6-cloro-5-(metilsulfonil)piridin-2-il)etanona O-etil oxima

[Quím. 103]



A una solución en tetrahidrofurano (4,0 mL) de (E)-1-(6-amino-5-(metilsulfonil)piridin-2-il)etanona O-etil oxima (0,22 g, 0,84 mmol), cloruro de cobre (II) (0,17 g, 1,3 mmol) y nitrito de ter-butilo (0,20 mL, 1,7 mmol) se añadieron a temperatura ambiente y la mezcla se agitó a 60 °C durante 1 hora. Una solución saturada acuosa de cloruro de amonio se añadió y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo, seguido de lavado con salmuera saturada. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (E)-1-(6-cloro-5-(metilsulfonil)piridin-2-il)etanona O-etil oxima (0,14 g, 0,51 mmol).

Rendimiento: 60 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 8,37 (d, 1H), 8,08 (d, 1H), 4,33 (q, 2H), 3,32 (s, 3H), 2,31 (s, 3H), 1,36 (t, 3H)

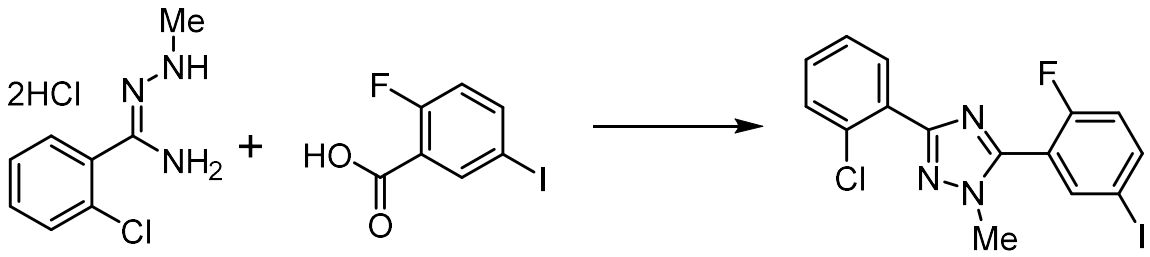
[0527] Ejemplo de referencia 7

Producción de (Z)-4-((4-(ter-butil)bencil)tio)-3-(3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-1,2,4-triazol-5-il)-N'-etoxibencimidamida (compuesto de partida para el Ejemplo de producción 8)

Ejemplo de producción de referencia 7-1

Producción de 3-(2-clorofenil)-5-(2-fluoro-5-yodofenil)-1-metil-1H-1,2,4-triazol

[Quím. 104]



A una solución de 2-cloro-N'-metilbencimidohidrazida diclorhidrato (3,5 g, 19 mmol) y ácido 2-fluoro-5-yodobenzoico (5,1 g, 19 mmol) en piridina (50 mL), N,N-dimetil-4-aminopiridina (2,4 g, 19 mmol) y 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida clorhidrato (4,1 g, 21 mmol) se añadieron y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Después de completar la reacción, la mezcla de reacción se concentró al vacío. Ácido clorhídrico 0,5 N se añadió al residuo y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. Ácido acético (50 mL) se añadió al residuo y la mezcla se agitó y se calentó a reflujo durante 1 hora. Después de completar la reacción, la mezcla de reacción se concentró al vacío. Una solución saturada acuosa de hidrógeno-carbonato de sodio se añadió al residuo y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 3-(2-clorofenil)-5-(2-fluoro-5-yodofenil)-1-metil-1H-1,2,4-triazol (1,8 g, 4,4 mmol).

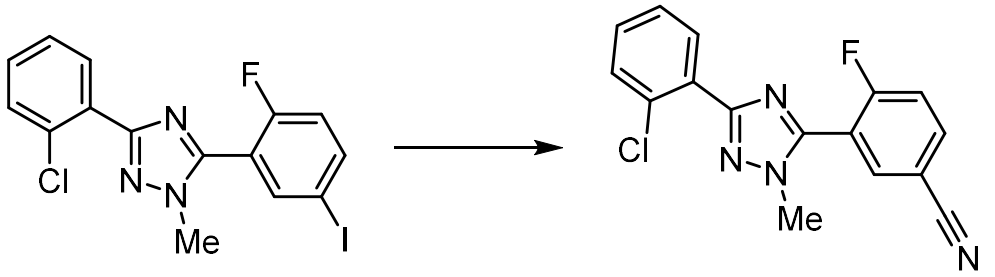
Rendimiento: 23 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 8,03 (dd, 1H), 7,91 (dd, 1H), 7,83 (ddd, 1H), 7,51 (dd, 1H), 7,38-7,33 (m, 2H), 7,03 (dd, 1H), 3,96 (s, 3H)

[0528] Ejemplo de producción de referencia 7-2

Producción de 3-(3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-1,2,4-triazol-5-il)-4-fluorobenzonitrilo

[Quím. 105]



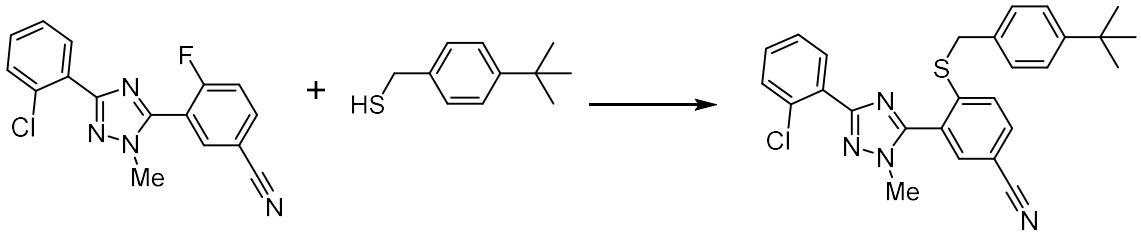
A una solución de 3-(2-clorofenil)-5-(2-fluoro-5-yodofenil)-1-metil-1H-1,2,4-triazol (1,6 g, 3,9 mmol) en N,N-dimetilacetamida (45 mL), trietilamina (0,81 mL, 5,9 mmol), tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0) (0,45 g, 0,39 mmol) y cianuro de zinc (0,70 g, 5,9 mmol) se añadieron a temperatura ambiente y la mezcla se agitó a 110 °C durante 2 horas. Después de completar la reacción, la mezcla de reacción se filtró a través de Celite, seguido de lavado con acetato de etilo. El filtrado se concentró al vacío y el residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 3-(3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-1,2,4-triazol-5-il)-4-fluorobenzonitrilo (1,1 g, 3,5 mmol).

Rendimiento: 90 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 8,09 (dd, 1H), 7,92 (dd, 1H), 7,87 (ddd, 1H), 7,52 (dd, 1H), 7,41 (dd, 1H), 7,39-7,34 (m, 2H), 3,97 (s, 3H)

[0529] Ejemplo de producción de referencia 7-3

Producción de 4-((4-(ter-butil)bencil)tio)-3-(3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-1,2,4-triazol-5-il)benzonitrilo [Quím. 106]



A una solución de 3-(3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-1,2,4-triazol-5-il)-4-fluorobenzonitrilo (0,50 g, 1,6 mmol) en N,N-

dimetilacetamida (5,5 mL), carbonato de cesio (0,78 g, 2,4 mmol) y (4-(ter-butil)fenil)metanotiol (0,35 mL, 1,9 mmol) se añadieron a temperatura ambiente y la mezcla se agitó a la misma temperatura durante 2 horas. Después de completar la reacción, una solución saturada acuosa de cloruro de amonio se añadió a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 4-((4-(ter-butil)bencil)tio)-3-(3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-1,2,4-triazol-5-il)benzonitrilo (0,78 g, 1,6 mmol).

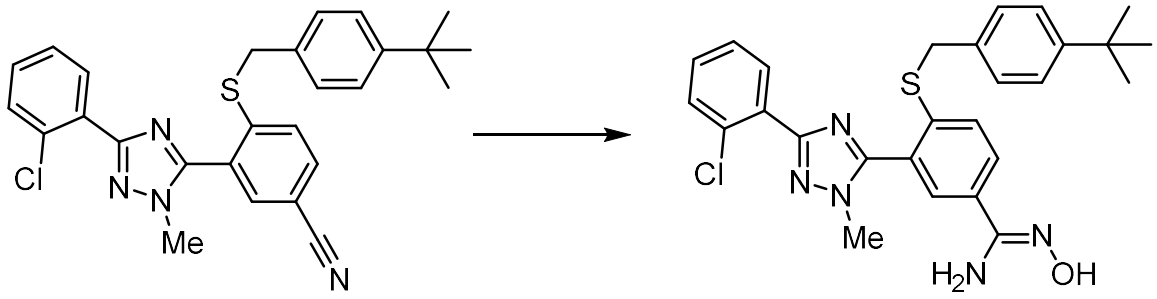
Rendimiento: 100 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 7,95 (dd, 1H), 7,71-7,67 (m, 2H), 7,52-7,48 (m, 2H), 7,36-7,31 (m, 4H), 7,24 (d, 2H), 4,15 (s, 2H), 3,80 (s, 3H), 1,29 (s, 9H)

[0530] Ejemplo de producción de referencia 7-4

Producción de (Z)-4-((4-(ter-butil)bencil)tio)-3-(3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-1,2,4-triazol-5-il)-N'-hidroxibencimidamida

[Quím. 107]



A una solución de 4-((4-(ter-butil)bencil)tio)-3-(3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-1,2,4-triazol-5-il)benzonitrilo (0,78 g, 1,6 mmol) en etanol (8,2 mL), acetato de sodio (0,21 g, 2,5 mmol) y clorhidrato de hidroxilamina (0,17 g, 2,5 mmol) se añadieron a temperatura ambiente y la mezcla se agitó a 80 °C durante 2 horas. Después de completar la reacción, se añadió agua a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción

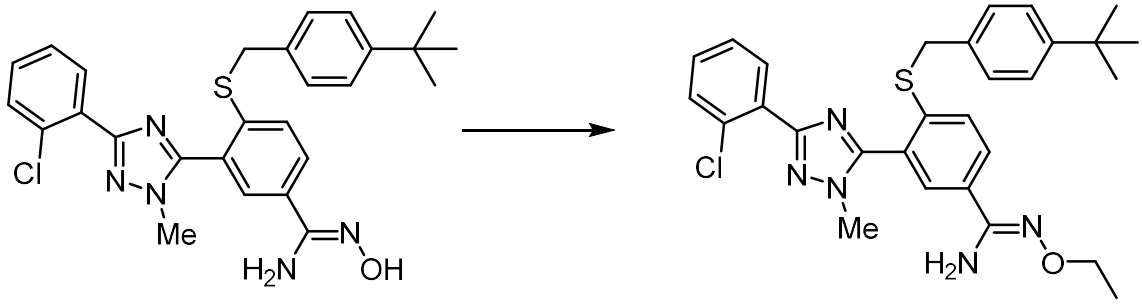
de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío para dar (Z)-4-((4-(ter-butil)bencil)tio)-3-(3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-1,2,4-triazol-5-il)-N'-hidroxibencimidamida (0,72 g, 1,4 mmol).

Rendimiento: 86 %

[0531] Ejemplo de producción de referencia 7-5

Producción de (Z)-4-((4-(ter-butil)bencil)tio)-3-(3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-1,2,4-triazol-5-il)-N'-etoxibencimidamida

[Quím. 108]



A una solución de (Z)-4-((4-(ter-butil)bencil)tio)-3-(3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-1,2,4-triazol-5-il)-N'-hidroxibencimidamida (0,28 g, 0,54 mmol) en N,N-dimetilformamida (3,0 mL), carbonato de cesio (0,27 g, 0,82 mmol) y yoduro de etilo (55 μL, 0,66 mmol) se añadieron a temperatura ambiente y la mezcla se agitó a la misma temperatura durante 2 horas. Después de completar la reacción, una solución saturada acuosa de cloruro de amonio se añadió a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-4-((4-(ter-butil)bencil)tio)-3-(3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-1,2,4-triazol-5-il)-N'-etoxibencimidamida (0,23 g, 0,43 mmol).

Rendimiento: 78 %

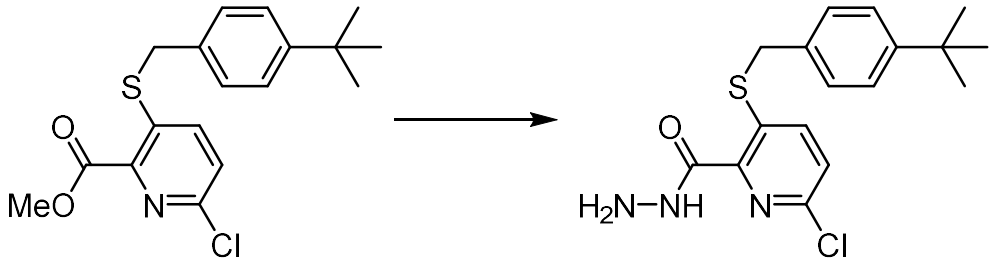
[0532] Ejemplo de referencia 8

Producción de 6-ciano-N-metil-2-(4-metil-1-(2-nitrofenil)-5-oxo-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-sulfonamida (compuesto de partida para el Ejemplo de producción 10-1)

Ejemplo de producción de referencia 8-1

Producción de 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloropicolinohidrazida

[Quím. 109]



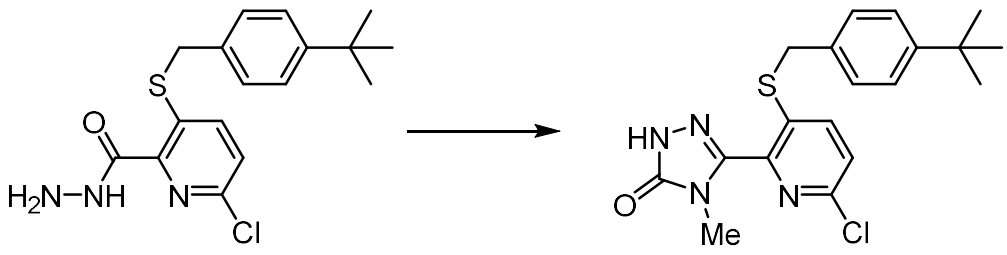
A una solución de metil 3-((4-(ter-butil)tio)-6-cloropicolinato (11 g, 30 mmol) en metanol (30 mL) y tetrahidrofurano (86 mL), monohidrato de hidrazina (2,2 mL, 45 mmol) se añadió a temperatura ambiente y la mezcla se agitó durante la noche. La mezcla de reacción se concentró al vacío. El sólido resultante se recolectó por filtración y se lavó con hexano para dar 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloropicolinohidrazida (11 g, 30 mmol).

Rendimiento: 100 %

[0533] Ejemplo de producción de referencia 8-2

Producción de 3-(3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloropiridin-2-il)-4-metil-1H-1,2,4-triazol-5(4H)-ona

[Quím. 110]



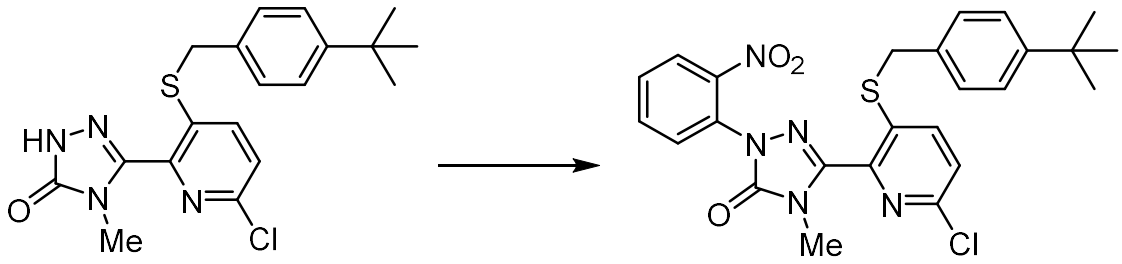
A una solución en piridina (30 mL) de 3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloropicolinohidrazida (11 g, 30 mmol), se añadió cloruro de metilcarbamoilo (3,4 g, 36 mmol) con enfriamiento en un baño de hielo y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. La mezcla de reacción se concentró al vacío y agua se añadió al residuo. El sólido resultante se recolectó por filtración. Esto se disolvió en a 1 N acuoso hidróxido de sodio solución (36 mL) y se calentó a reflujo durante 24 horas. Ácido clorhídrico 2 M se añadió a la mezcla de reacción y el sólido resultante se recolectó por filtración y se lavó con éter metil ter-butílico y hexano para dar 3-(3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloropiridin-2-il)-4-metil-1H-1,2,4-triazol-5(4H)-ona (12 g, 30 mmol).

Rendimiento: 100 %

[0534] Ejemplo de producción de referencia 8-3

Producción de 3-(3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloropiridin-2-il)-4-metil-1-(2-nitrofenol)-1H-1,2,4-triazol-5(4H)-ona

[Quím. 111]



A una solución de 3-(3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloropiridin-2-il)-4-metil-1H-1,2,4-triazol-5(4H)-ona (5,6 g, 14,6 mmol) en dimetilsulfóxido (70 mL), carbonato de potasio (6,0 g, 44 mmol) y 2-fluoronitrobenceno (3,1 g, 22 mmol) se añadieron y la mezcla se agitó a 80 °C durante 4 horas. Se añadió agua a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo, seguido de lavado con salmuera saturada. La capa orgánica se concentró al vacío y el residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 3-(3-

((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloropiridin-2-il)-4-metil-1-(2-nitrofenol)-1H-1,2,4-triazol-5(4H)-ona (2,8 g, 5,4 mmol).

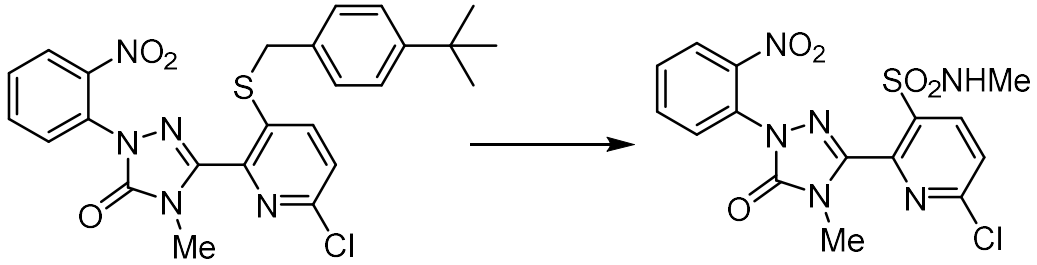
Rendimiento: 37 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 7,99-7,94 (m, 1H), 7,83-7,79 (m, 1H), 7,72-7,66 (m, 2H), 7,51-7,45 (m, 1H), 7,36-7,25 (m, 5H), 4,13 (s, 2H), 3,47 (s, 3H), 1,30 (s, 9H)

[0535] Ejemplo de producción de referencia 8-4

Producción de 6-cloro-N-metil-2-(4-metil-1-(2-nitrofenil)-5-oxo-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-sulfonamida

[Quím. 112]



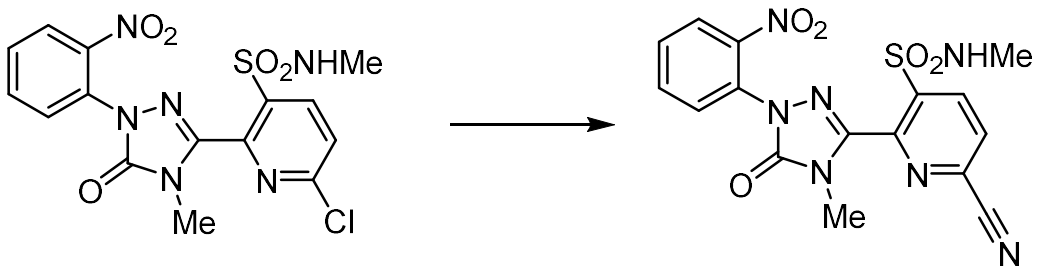
A una solución de 3-(3-((4-(ter-butil)bencil)tio)-6-cloropiridin-2-il)-4-metil-1-(2-nitrofenol)-1H-1,2,4-triazol-5(4H)-ona (2,8 g, 5,4 mmol) en cloroformo (20 mL), agua (0,60 mL, 33 mmol) y ácido acético (1,0 mL, 16 mmol) se añadieron y 1,3-dicloro-5,5-dimetilhidantoína (3,2 g, 16 mmol) se añadió con enfriamiento en baño de hielo. Después de confirmar la desaparición del compuesto de partida, la mezcla de reacción se añadió gota a gota a una solución metanólica de metilamina (9,8 mol/L, 20 mL) con enfriamiento en un baño de hielo y la mezcla se agitó durante 30 minutos. Una solución saturada acuosa de cloruro de amonio se añadió y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se concentró y el residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 6-cloro-N-metil-2-(4-metil-1-(2-nitrofenil)-5-oxo-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-sulfonamida (1,2 g, 2,8 mmol).

Rendimiento: 53 %

[0536] Ejemplo de producción de referencia 8-5

Producción de 6-ciano-N-metil-2-(4-metil-1-(2-nitrofenil)-5-oxo-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-sulfonamida

[Quím. 113]



A una solución de 6-cloro-N-metil-2-(4-metil-1-(2-nitrofenil)-5-oxo-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-sulfonamida (1,2 g, 2,8 mmol) en dimetilsulfóxido (10 mL), cianuro de sodio (0,17 g, 3,5 mmol) y 1,4-diazabiciclo[2,2,2]octano (0,16 g, 1,4 mmol) se añadieron y la mezcla se agitó a 40 °C durante 2 horas. Después de completar la reacción, salmuera saturada se añadió a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se concentró al vacío y el residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 6-ciano-N-metil-2-(4-metil-1-(2-nitrofenil)-5-oxo-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)piridin-3-sulfonamida (1,0 g, 2,5 mmol). Rendimiento: 86 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 8,66 (d, 1H), 8,00 (d, 1H), 7,94-7,90 (m, 2H), 7,79-7,73 (m, 1H), 6,06 (q, 1H), 3,51 (s, 3H), 2,75 (d, 3H)

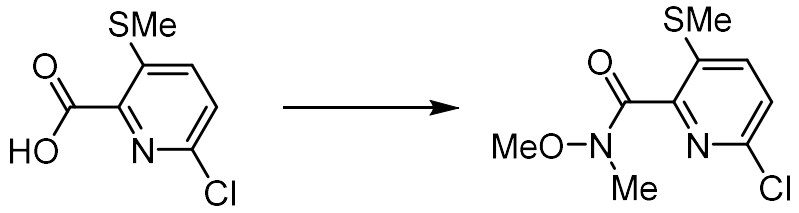
[0537] Ejemplo de referencia 9

Producción de (Z)-N'-etoxi-6-(4-metil-1H-pirazol-3-il)-5-(metilsulfonil)picolinimidamida (compuesto de partida para el Ejemplo de producción 13-1)

Ejemplo de producción de referencia 9-1

Producción de 6-cloro-N-metoxi-N-metil-3-(metiltio)picolinamida

[Quím. 114]



A una solución de ácido 6-cloro-3-(metiltio)picolínico (16 g, 79 mmol) en THF (80 mL), N,N-dimetilformamida (0,6 mL, 7,8 mmol) y cloruro de oxalilo (7,4 mL, 86 mmol) se añadieron a temperatura ambiente y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. Después de completar la reacción, la mezcla de reacción se concentró al vacío. Cloroformo (80 mL), trietilamina (44 mL, 0,31 mol) y N-metoxi-N-metilamina clorhidrato (9,2 g, 94 mmol) se añadieron al residuo a 0 °C y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Después de completar la reacción, se añadió agua a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío para dar 6-cloro-N-metoxi-N-metil-3-(metiltio)picolinamida (11 g, 44 mmol).

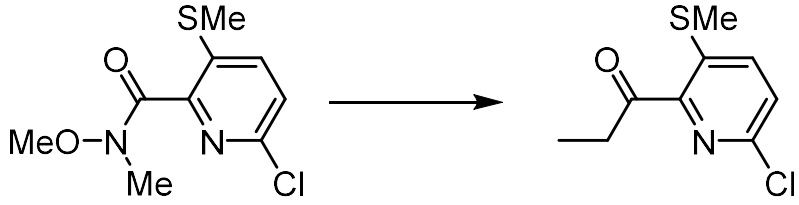
Rendimiento: 56 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 7,65 (d, 1H), 7,32 (d, 1H), 3,63 (s, 3H), 3,38 (s, 3H), 2,46 (s, 3H)

[0538] Ejemplo de producción de referencia 9-2

Producción de 1-(6-cloro-3-(metiltio)piridin-2-il)propan-1-ona

[Quím. 115]



A una solución de 6-cloro-N-metoxi-N-metil-3-(metiltio)picolinamida (10 g, 41 mmol) en THF (25 mL), bromuro

de etilmagnesio (solución en éter dietílico, 50 mL, 53 mmol) se añadió a 0 °C y la mezcla se agitó durante 2 horas. Después de completar la reacción, una solución saturada acuosa de cloruro de amonio se añadió a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 1-(6-cloro-3-(metiltio)piridin-2-il)propan-1-ona (3,7 g, 17 mmol).

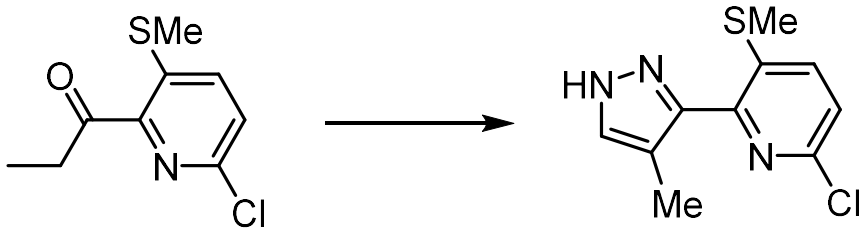
Rendimiento: 41 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 7,62 (d, 1H), 7,41 (d, 1H), 3,21 (q, 2H), 2,43 (s, 3H), 1,20 (t, 3H)

[0539] Ejemplo de producción de referencia 9-3

Producción de 6-cloro-2-(4-metil-1H-pirazol-3-il)-3-(metiltio)piridina

[Quím. 116]



N,N-dimetilformamida dimetil acetal (3,0 mL, 22 mmol) se añadió a 1-(6-cloro-3-(metiltio)piridin-2-il)propan-1-ona (2,3 g, 11 mmol) a temperatura ambiente y la mezcla se agitó a 60 °C durante 2 horas. Después de completar la reacción, la mezcla de reacción se concentró al vacío. N,N-dimetilacetamida (10 mL) y monohidrato de hidrazina (0,63 mL, 13 mmol) se añadieron al residuo a temperatura ambiente y la mezcla se agitó a 120 °C durante 2 horas. Después de completar la reacción, se añadió agua a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de

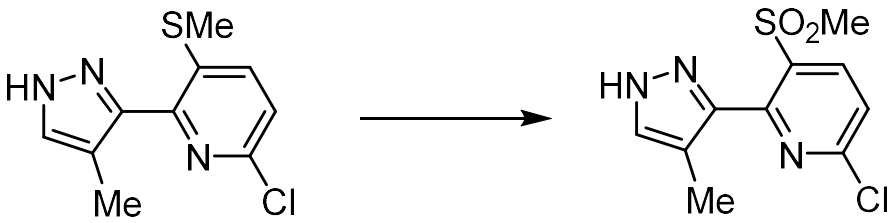
sílice para dar 6-cloro-2-(4-metil-1H-pirazol-3-il)-3-(metiltio)piridina (1,4 g, 5,6 mmol).

Rendimiento: 51 %

[0540] Ejemplo de producción de referencia 9-4

Producción de 6-cloro-2-(4-metil-1H-pirazol-3-il)-3-(metilsulfonil)piridina

[Quím. 117]



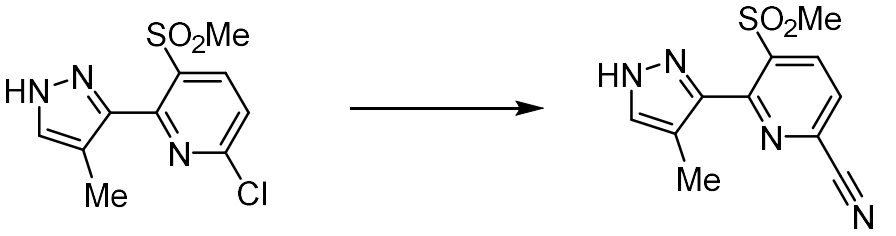
A una solución de 6-cloro-2-(4-metil-1H-pirazol-3-il)-3-(metiltio)piridina (1,1 g, 4,6 mmol) en acetato de etilo (4,0 mL), ácido m-cloroperbenzoico (0,44 g, 14 mmol) se añadió y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas. Después de completar la reacción, una solución saturada acuosa de hidrógeno-carbonato de sodio y a saturado acuoso sodio tiosulfato solución se añadieron a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 6-cloro-2-(4-metil-1H-pirazol-3-il)-3-(metilsulfonil)piridina (1,2 g, 4,4 mmol).

Rendimiento: 97 %

[0541] Ejemplo de producción de referencia 9-5

Producción de 6-(4-metil-1H-pirazol-3-il)-5-(metilsulfonil)picolinonitrilo

[Quím. 118]



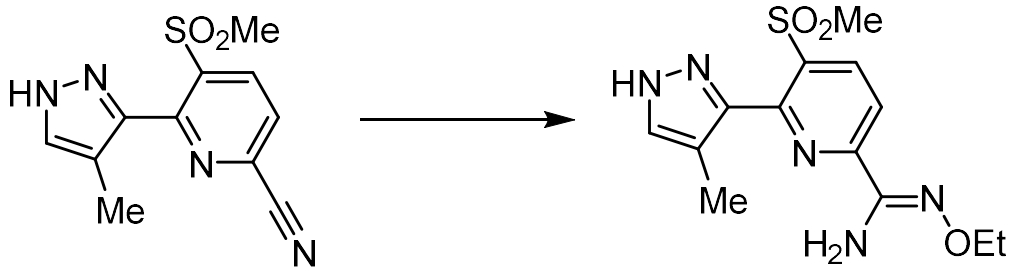
A una solución de 6-cloro-2-(4-metil-1H-pirazol-3-il)-3-(metilsulfonil)piridina (1,4 g, 5,0 mmol) en dimetilsulfóxido (25 mL), 1,4-diazabiciclo[2,2,2]octano (0,13 g, 1,1 mmol) se añadió a temperatura ambiente. Cianuro de sodio (0,30 g, 6,0 mmol) disuelto en agua (2,5 mL) se añadió gradualmente a temperatura ambiente y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Después de completar la reacción, se añadió agua y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar 6-(4-metil-1H-pirazol-3-il)-5-(metilsulfonil)picolinonitrilo (0,68 g, 2,6 mmol).
Rendimiento: 52 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 8,70 (d, 1H), 7,86 (d, 1H), 7,52 (s, 1H), 3,47 (s, 3H), 2,23 (s, 3H)

[0542] Ejemplo de producción de referencia 9-6

Producción de (Z)-N'-etoxi-6-(4-metil-1H-pirazol-3-il)-5-(metilsulfonil)picolinimidamida

[Quím. 119]



A una solución de 6-(4-metil-1H-pirazol-3-il)-5-(metilsulfonil)picolinonitrilo (0,30 g, 1,1 mmol) en metanol (6,0 mL), metóxido de sodio (40 % solución en metanol, 0,14 mL, 1,4 mmol) se añadió y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. El clorhidrato de O-etilhidroxilamina (0,14 g, 1,4 mmol) se añadió y la mezcla se agitó durante 1 hora. Después de completar la reacción, se añadió agua a la mezcla de reacción y se llevó a cabo una extracción de acetato de etilo.

La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice para dar (Z)-N'-etoxi-6-(4-metil-1H-pirazol-3-il)-5-(metilsulfonil)picolinimidamida (0,36 g, 1,1 mmol).

Rendimiento: 98 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 8,49 (d, 1H), 8,15 (d, 1H), 7,54 (s, 1H), 5,51 (s, 2H), 4,23 (q, 2H), 3,24 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,35 (t, 3H)

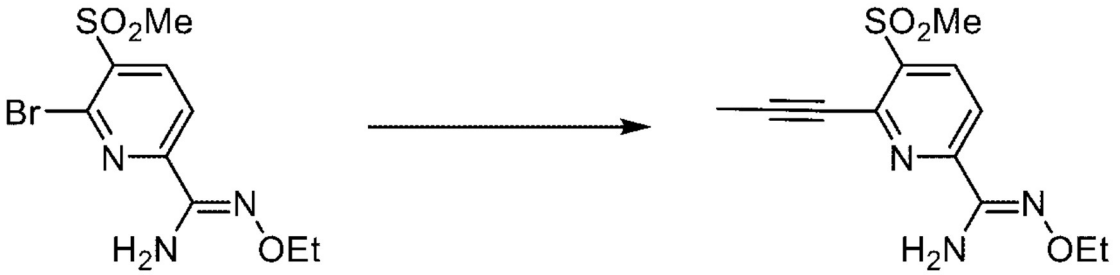
[0543] Ejemplo de producción de referencia 10

Producción de (Z)-N'-etoxi-6-(5-metil-2H-1,2,3-triazol-4-il)-5-(metilsulfonil)picolinimidamida (compuesto de partida para el Ejemplo de producción 15)

Ejemplo de producción de referencia 10-1

Producción de (Z)-N'-etoxi-5-(N-metilsulfonil)-6-(prop-1-in-1-il)picolinimidamida

[Quím. 120]



A una solución de (Z)-6-bromo-N'-etoxi-5-(N-metilsulfonil)picolinimidamida (0,40 g, 1,3 mmol) en trietilo (6,0 mL), una solución al 5 % de N,N-dimetilacetamida (5,0 mL) de propine, diclorobis(trifenilfosfina)paladio (44 mg, 0,063 mmol) y yoduro de cobre (9,5 mg, 0,025 mmol) se añadieron y la mezcla se agitó bajo una atmósfera de argón a 75 °C durante 7 horas. Después de confirmar la desaparición del compuesto de partida, la mezcla de reacción se enfrió hasta temperatura ambiente y acetato de etilo y agua se añadieron para extracción. La capa orgánica se concentró al vacío y el residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice para dar (Z)-N'-etoxi-5-

(N-metilsulfonil)-6-(prop-1-in-1-il)picolinimidamida (0,35 g, 1,2 mmol).

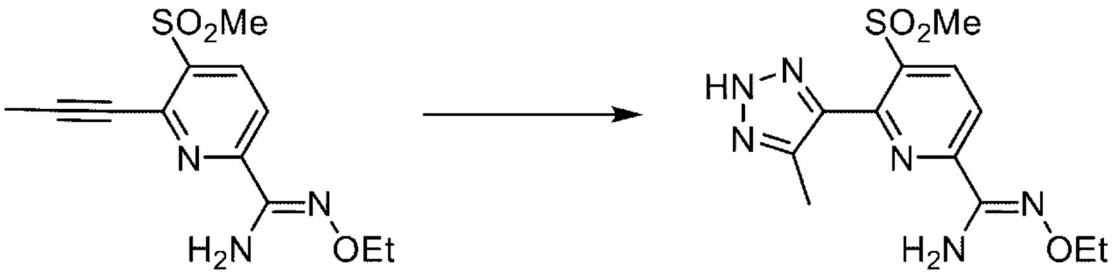
Rendimiento: 99 %

Propiedad física: ^{1}H-RMN ($CDCl_3$): δ 8,30 (d, 1H), 8,07 (d, 1H), 5,53 (brs, 2H), 4,20 (q, 2H), 3,32 (s, 3H), 2,24 (s, 3H), 1,34 (t, 3H)

[0544] Ejemplo de producción de referencia 10-2

Producción de (Z)-N'-etoxi-6-(5-metil-2H-1,2,3-triazol-4-il)-5-(metilsulfonil)picolinimidamida

[Quím. 121]



A una solución de (Z)-N'-etoxi-5-(N-metilsulfonil)-6-(prop-1-in-1-il)picolinimidamida (1,9 g, 6,6 mmol) en N,N-dimetilacetamida (67 mL), azida de sodio (0,48 g, 7,4 mmol) y diacetoxi yodobenceno (2,6 g, 8,1 mmol) se añadieron y la mezcla se agitó a 75 °C durante 5 horas. La mezcla de reacción se concentró al vacío y el residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice para dar (Z)-N'-etoxi-6-(5-metil-2H-1,2,3-triazol-4-il)-5-(metilsulfonil)picolinimidamida (0,87 g, 2,7 mmol).

Rendimiento: 40 %

Propiedad física: punto de fusión: 126 a 130 °C

[0545] De ahora en más en la presente, se muestran los ejemplos de formulaciones que contienen el compuesto de la presente invención, pero la presente invención no se limita a ellos. En los ejemplos de formulación, "parte" significa parte en peso.

[0546] Ejemplo de formulación 1

Compuesto de la presente invención	10 partes
Xileno	70 partes

N-metilpirrolidona	10 partes
Mezcla de éter polioxietilenononilfenílico y sulfonato de alquilbenceno de calcio	10 partes

Los ingredientes anteriores se mezclan de modo uniforme para disolución para dar una formulación emulsionable concentrada.

[0547] Ejemplo de formulación 2

Compuesto de la presente invención	3 partes
Arcilla en polvo	82 partes
Diatomita en polvo	15 partes

Los ingredientes anteriores se mezclan de modo uniforme y luego se pulverizaron para dar una formulación pulverulenta.

[0548] Ejemplo de formulación 3

Compuesto de la presente invención	5 partes
Mezcla de bentonita en polvo y arcilla en polvo	90 partes
Lignosulfonato de calcio	5 partes

Los ingredientes anteriores se mezclan de modo uniforme. Después de la adición de un volumen apropiado de agua, la mezcla se amasa, se granula y se seca para dar una formulación granular.

[0549] Ejemplo de formulación 4

Compuesto de la presente invención	20 partes
Caolín y ácido silícico sintético de alta dispersión	75 partes
Mezcla de éter polioxietilenononilfenílico y sulfonato de alquilbenceno de calcio	5 partes

Los ingredientes anteriores se mezclan de modo uniforme y luego se pulverizan para dar una formulación humectable en polvo.

[0550] Ejemplo de ensayo 1: ensayo para el efecto herbicida posemergencia contra arrozales

Se sembró pasto de corral (*Echinochloa crus-galli*) y se cultivó en tubos de ensayo que contenían medio hidropónico en una cámara de clima artificial o un fitotrón. Las formulaciones agroquímicas que contenían los compuestos de la presente invención como ingredientes activos preparados de acuerdo con

Ejemplo de formulación 1 se diluyeron por separado con agua de modo que la concentración del ingrediente activo podría ser una concentración predeterminada y usada para tratamiento por goteo del pasto de corral. El pasto de corral se cultivó en una cámara de clima artificial a 30 °C en condiciones de luz totales. Seis días después del tratamiento agroquímico, se evaluó el efecto herbicida en comparación con el grupo no tratado de acuerdo con los siguientes criterios.

Criterios para el efecto herbicida (grado de inhibición de crecimiento) y fitotoxicidad

Puntaje 4 90 % al 100 % de efecto herbicida

Puntaje 3 70 % al 89 % de efecto herbicida

Puntaje 2 40 % al 69 % de efecto herbicida

Puntaje 1 1 % al 39 % de efecto herbicida

Puntaje 0 0 % de efecto herbicida

[0551] Como resultado del Ejemplo de ensayo 1, entre los compuestos representados por la fórmula general (1) de la presente invención, los compuestos de números 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-11, 1-13, 1-14, 1-15, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-53, 1-142, 1-143, 1-144, 1-145, 1-154, 1-186, 1-188, 1-189, 1-192, 1-197, 1-198, 1-200, 1-201, 1-206, 1-207, 1-209, 1-210, 1-211, 1-212, 1-220, 1-224, 1-225, 1-226, 1-227, 1-228, 1-229, 1-230, 1-233, 1-234, 1-237, 1-248, 1-249, 1-269, 1-270, 1-284, 1-285, 1-287, 1-288, 1-289, 1-290, 1-292, 1-293, 1-294, 1-295, 1-296, 1-299, 1-358, 1-359, 2-1, 2-2, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-15, 2-18, 2-19, 2-21, 2-22, 2-23, 2-24, 2-26, 2-27, 2-28, 2-29, 2-31, 2-32, 2-33, 2-35, 2-38, 3-1, 3-2, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 3-7, 3-8, 3-9, 3-10, 3-11, 3-12, 3-14, 3-15, 3-16, 3-17, 3-18, 3-19, 3-20, 3-21, 3-114, 3-115, 3-116, 3-117, 3-118, 3-119, 3-120, 3-121, 3-123, 3-124, 3-125, 3-168, 3-171, 3-176, 3-177,

3-179, 3-180, 3-191, 3-192, 3-193, 3-195, 3-197, 3-198, 3-200, 3-201, 3-203, 3-204, 3-205, 3-206, 3-208, 3-209, 3-229, 3-230, 3-250, 3-251, 3-265, 3-267, 3-268, 3-269, 3-270, 3-271, 3-272, 3-273, 3-274, 3-278, 3-279, 3-324, 3-377, 3-378, 4-1, 4-2, 4-3, 4-5, 4-6, 4-8, 4-9, 4-10, 4-12, 4-13, 4-14, 4-15, 4-16, 4-17, 4-19, 4-24, 4-52, 4-77, 4-78, 4-115, 4-131, 4-132, 4-134, 4-135, 4-149, 4-151, 4-152, 4-157, 4-158, 4-159, 4-160, 4-161, 4-162, 4-165, 4-168, 4-169, 4-171, 4-180, 4-181, 4-182, 4-183, 4-185, 4-187, 4-188, 4-189, 4-237, 4-238, 4-239, 4-240, 4-241, 4-242, 4-243, 4-247, 4-248, 4-249, 4-250, 4-254, 4-282, 4-283, 4-303, 4-304, 4-305, 4-306, 4-307, 4-308, 4-309, 5-1, 5-3, 5-21, 6-1, 7-1, 7-18, 7-20, 7-21, 7-22, 8-2, 8-17, 10-2, 10-16, 10-17, 10-18, 10-20, 11-95, 11-214, 12-2, 17-1, 17-2, 17-3, 17-6, 19-29, 20-17, 20-20, 20-62, 20-66 y 21-2 mostraron un efecto herbicida contra pasto de corral en un puntaje de 3 o más de acuerdo con los criterios anteriores cuando se aplicó una concentración de ingrediente activo de 10 ppm.

APLICABILIDAD INDUSTRIAL

[0552] El compuesto heterocíclico que contiene nitrógeno de la presente invención o una de sus sales es un herbicida agrícola u hortícola muy eficaz.