



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 329 906**

51 Int. Cl.:
A01N 43/56 (2006.01)
C07D 231/14 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **04803892 .1**
96 Fecha de presentación : **15.12.2004**
97 Número de publicación de la solicitud: **1699291**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **13.09.2006**

54 Título: **Regulación del crecimiento de las plantas.**

30 Prioridad: **24.12.2003 EP 03029847**
12.05.2004 EP 04011252

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
02.12.2009

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
02.12.2009

73 Titular/es: **Bayer CropScience AG.**
Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim, DE

72 Inventor/es: **Bastiaans, Henricus, M., M.;**
Donn, Günter;
Knittel, Nathalie;
Martelletti, Arianna;
Rees, Richard y
Schwall, Michael

74 Agente: **Lehmann Novo, María Isabel**

ES 2 329 906 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

Regulación del crecimiento de las plantas.

5 El presente invento se refiere al sector técnico de los productos agroquímicos y a métodos usados en la agricultura para la regulación del crecimiento de las plantas. En particular, el presente invento se refiere a una nueva clase de agentes reguladores del crecimiento de las plantas para el tratamiento de plantas con el fin de inducir respuestas reguladoras del crecimiento, que dan como resultado un superior crecimiento de plantas tratadas, de ciertas partes de las plantas o, más generalmente, un superior rendimiento de las cosechas.

10 El término “método para la regulación del crecimiento de las plantas” o el término “procedimiento de regulación del crecimiento” o el uso de las palabras “regulación del crecimiento de las plantas” u otros términos que usan la palabra “regular”, tal como se usan en la presente memoria descriptiva, se refieren a una diversidad de respuestas de plantas que mejoran alguna característica de la planta. Los “agentes reguladores del crecimiento de las plantas” son
15 unos compuestos que poseen una actividad en uno o más procedimiento(s) para la regulación del crecimiento de una planta.

Este tipo de regulación del crecimiento de las plantas se distingue de una acción plaguicida o de una reducción del crecimiento, que algunas veces se define también como regulación del crecimiento de las plantas, cuya intención, sin embargo, es la de destruir o impedir el crecimiento de una planta. Por esta razón, los compuestos usados en la práctica de este invento se usan en unas cantidades que no son fitotóxicas con respecto a la planta que se está tratando, pero que estimulan el crecimiento de la planta o de ciertas partes de la misma. Por lo tanto, dichos compuestos se pueden denominar también “estimulantes de plantas”, y su acción se puede denominar como “estimulación del crecimiento de las plantas”.

25 La regulación del crecimiento de las plantas es una manera deseable de mejorar plantas y su cosecha de manera tal que se obtengan un mejorado crecimiento de las plantas y mejores condiciones de práctica agrícola en comparación con plantas no tratadas. Esta clase de moléculas puede o bien inhibir o favorecer actividades celulares, frecuentemente con una menor especificidad, comparada con la de las hormonas animales. Esto significa que los agentes reguladores del crecimiento de las plantas identificados en plantas regulan con la máxima frecuencia la división, la elongación y la diferenciación de células de plantas de una manera tal que, con la máxima frecuencia, ellos tienen múltiples efectos en plantas.

30 Sobre la base molecular, los agentes reguladores del crecimiento de las plantas pueden trabajar afectando a propiedades de membranas, controlando la expresión de genes o afectando a la actividad de enzimas, o siendo activos en una combinación de al menos dos de los tipos de interacciones que antes se han mencionado. Los agentes reguladores del crecimiento de las plantas son productos químicos o bien de origen natural, también denominados hormonas vegetales (tales como hormonas no peptídicas, p.ej. auxinas, giberelinas, citocininas, etileno, brasinoesteroides o ácido abscísico, y ácido salicílico), lipooligosacáridos (p.ej. factores Nod), péptidos (p.ej. sistemina), derivados de ácidos grasos (p.ej. jasmonatos), y oligosacarinas (para su recopilación véase la obra: *Biochemistry & Molecular Biology of the Plant* (2000) [Bioquímica & Biología Molecular de la Planta] (2000); coordinadores de edición Buchanan, Grisseem, Jones, páginas 558-562; y 850-929), o pueden ser unos compuestos producidos por síntesis (tales como derivados de hormonas del crecimiento de plantas que se presentan en la naturaleza, etefón).

45 Agentes reguladores del crecimiento de las plantas, que trabajan en muy pequeñas concentraciones, se pueden encontrar en un gran número de células y tejidos, pero parece ser que se concentran en meristemas y pimpollos. Junto a la selección del compuesto correcto, es relevante también buscar las condiciones ambientales óptimas, puesto que se conocen varios factores que pueden afectar a la acción de las hormonas del crecimiento, tales como (a) la concentración del agente regulador del crecimiento de las plantas, propiamente dicho, (b) la cantidad aplicada a la planta, (c) el momento de aplicación en relación con la fecha del florecimiento, (d) la temperatura y la humedad antes y después del tratamiento, (e) el contenido de humedad de las plantas, y varios otros.

50 Los agentes reguladores del crecimiento de las plantas o bien pueden ser beneficiosos para las plantas, pero algunas veces se pueden usar para la represión de malezas o para inducir una defoliación (tal como lo hacen las auxinas sintéticas 2,4-D y 2,4,5-T).

55 El modo de acción de los existentes agentes reguladores del crecimiento de las plantas no se conoce con frecuencia. Se discuten diversas metas y, entre éstas, la mayor parte de las moléculas afectadas están implicadas en la regulación de la división celular, tal como la detención del ciclo celular en la etapa G1 o G2, respectivamente, otras lo están para señalar las respuestas a tensiones de estrés de sequía (*Biochemistry & Molecular Biology of the Plant* (2000); coordinadores de edición Buchanan, Grisseem, Jones, páginas 558-560). En cualquier caso, el control hormonal se puede identificar como una cascada extremadamente compleja de regulaciones en sentidos ascendentes y descendentes que, por ejemplo, pueden conducir a una estimulación del crecimiento de un órgano o de un tipo de célula de una planta, pero también pueden conducir a una represión en otros órganos o tipos de células de la misma planta.

65 En muchos casos, ciertas cinasas están implicadas ya sea directa o indirectamente en el control de las hormonas vegetales, y entre las cinasas, las cinasas proteínicas son moléculas de control primordiales y muy específicas con respecto al control del ciclo celular. Dichas cinasas se discuten como dianas para diversas hormonas vegetales, tal

ES 2 329 906 T3

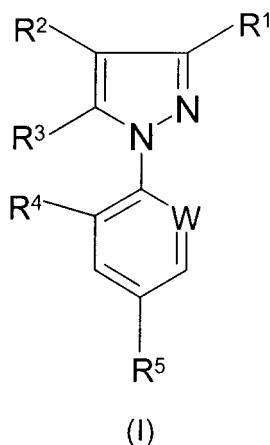
como se da el caso para una auxina y el ácido abscísico (Biochemistry & Molecular Biology of the Plant (2000); coordinadores de edición Buchanan, Grissem, Jones, páginas 542-565 y páginas 980-985; Morgan (1997), Annu. Rev. Cell. Dev. Biol., 13, 261-291; Amon y colaboradores (1993), Cell, 74, páginas 993-1.007; Dynlacht y colaboradores (1997), Nature, 389, páginas 149-152; Hunt y Nasmyth (1997), Curr. Opin. Cell. Biol., 9, páginas 765-767; Thomas y Hall (1997), Curr. Opin. Cell. Biol., 9, páginas 782-787).

La publicación de solicitud de patente internacional WO 96/33614 ya describe el uso de un compuesto de N-aril-pirazol o N-heteroaril-pirazol para regular el crecimiento de las plantas. Además, la patente de los EE.UU. con el número de publicación US 4.810.283 describe el uso de N-aril-pirazoles como herbicidas.

Los números de publicaciones de patentes, internacional WO 87/03781, europea EP 0295117, de los EE.UU. US 5556873, US 4771066 e internacional WO 02/066423 describen la represión de insectos, arácnidos y helmintos con compuestos 1-aril-pirazoles.

A la vista de lo que antecede, se ha comprobado ahora, sorprendentemente, que ciertos derivados de ácidos 1-aril-pirazol-3-carboxílicos sustituidos en posición 5, y especialmente ciertos derivados de ácidos 5-amino-1-aril-pirazol-3-carboxílicos no actúan principalmente como herbicidas, sino que muestran un comportamiento superior con respecto a su uso para la regulación del crecimiento de las plantas.

El presente invento se refiere al uso de un compuesto para la regulación del crecimiento de las plantas, preferiblemente por aplicación del compuesto a plantas, a las semillas a partir de las que éstas crecen, o al locus en el que éstas crecen, en una cantidad efectiva para regular el crecimiento de las plantas, preferiblemente no fitotóxica, cuyo compuesto es un derivado de ácido 1-aril-pirazol-3-carboxílico sustituido en posición 5 de la fórmula (I) o una sal aceptable en agricultura del mismo:



en el que:

R¹ es CONR⁶R⁷ o CO₂R⁸;

W es C-halógeno o N;

R² es H o S(O)_mR⁹;

R³ es NR¹⁰R¹¹, halógeno, OH, alcoxi (C₁-C₆), alquénil (C₂-C₆)-oxi o alquínil (C₂-C₆)-oxi;

R⁴ es H o halógeno, preferiblemente H, Cl ó Br;

R⁵ es halo-alquilo (C₁-C₄) o halo-alcoxi (C₁-C₄), preferiblemente CF₃ ó OCF₃;

R⁶ es H, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquénilo (C₂-C₆), halo-alquénilo (C₂-C₆), alquínilo (C₂-C₆), halo-alquínilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), cicloalquil (C₃-C₇)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)-tio, (CH₂)_nR¹², (CH₂)_pR¹³, alquil (C₁-C₆)-CN, alquil (C₁-C₆)-NR¹⁰R¹¹ o alquil (C₁-C₆)-S(O)_rR⁹;

R⁷ es H, alquilo (C₁-C₆), alquénilo (C₃-C₆) o alquínilo (C₃-C₆); o

R⁶ y R⁷ junto con el átomo de N unido a ellos, forman un anillo saturado de cinco o seis miembros, que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo, que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₆) y halo-alquilo (C₁-C₆);

ES 2 329 906 T3

R⁸ es H, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆) o (CH₂)_nR¹², preferiblemente H o alquilo (C₁-C₄) o halo-alquilo (C₁-C₄), particularmente metilo o etilo;

R⁹ es alquilo (C₁-C₆) o halo-alquilo (C₁-C₆);

R¹⁰ y R¹¹ son, cada uno de ellos independientemente, H, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹⁴ ó CO₂R¹⁵;

R¹⁰ y R¹¹ en común con el átomo de N unido a ellos, forman un anillo saturado de cinco o seis miembros, que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo, que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₆) y halo-alquilo (C₁-C₆);

R¹² es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), halo-alcoxi (C₁-C₆), CO₂R¹⁶, CN, NO₂, S(O)_qR⁹, COR¹⁶, CONR¹⁶R¹⁷ y OH;

R¹³ es heterociclilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₄), halo-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), halo-alcoxi (C₁-C₄), NO₂, CN, CO₂R¹⁶, S(O)_qR⁹, OH y oxo;

R¹⁴ y R¹⁵ son, cada uno de ellos independientemente, H, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆) o alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄);

R¹⁶ y R¹⁷ son, cada uno de ellos independientemente, H, alquilo (C₁-C₆) o halo-alquilo (C₁-C₆);

m, q y r son, cada uno de ellos independientemente, 0, 1 ó 2;

n y p son, cada uno de ellos independientemente, 0, 1, 2, 3 ó 4; y

cada heterociclilo en los radicales antes mencionados es independientemente un radical heterocíclico que tiene de 3 a 7 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo, seleccionados entre el conjunto que consiste en N, O y S.

El invento abarca también cualquier estereoisómero, enantiómero, isómero geométrico o tautómero, y mezclas de los compuestos de la fórmula (I) y las respectivas sales de los mismos aceptables en agricultura.

Por el término de “sales aceptables en agricultura” se entienden sales de los aniones o cationes que se conocen y aceptan en la especialidad para la formación de sales para uso agrícola.

Apropiadas sales con bases, p.ej. las formadas por compuestos de la fórmula (I) que contienen un grupo de ácido carboxílico, incluyen sales de metales alcalinos (p.ej. de sodio y potasio), de metales alcalino-térreos (p.ej. de calcio y magnesio) y de amonio. Las sales de amonio incluyen sales de amonio (NH₄⁺) y sales de amonio de aminas orgánicas, (p.ej. las sales de dietanol-amina, trietanol-amina, octil-amina, morfolina y dioctil-metil-amina), y sales cuaternarias de amonio (NR⁴⁺), por ejemplo de tetrametil-amonio. Apropiadas sales por adición de ácidos, p.ej. las formadas por compuestos de la fórmula (I) que contienen un grupo amino, incluyen sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo hidroccloruros, sulfatos, fosfatos y nitratos, y sales con ácidos orgánicos, por ejemplo ácido acético.

En la presente memoria descriptiva de patente, incluyendo las reivindicaciones adjuntas, los sustituyentes antes mencionados tienen los siguientes significados:

Halógeno significa flúor, cloro, bromo o yodo.

El término “halo”, delante del nombre de un radical, significa que este radical está halogenado parcial o completamente, es decir, sustituido con F, Cl, Br o I, en cualquier combinación.

La expresión “alquilo (C₁-C₆)” significa un radical hidrocarbilo saturado, no cíclico, sin ramificar o ramificado, que tiene 1, 2, 3, 4, 5 ó 6 átomos de carbono (indicados por un intervalo de átomos de C dentro del paréntesis), tal como, por ejemplo, un radical metilo, etilo, propilo, isopropilo, 1-butilo, 2-butilo, 2-metil-propilo o terc.-butilo. Lo mismo se aplica a grupos alquilo en radicales compuestos tales como “alcoxi-alquilo”.

Los radicales alquilo, y también en grupos compuestos, a menos que se defina otra cosa distinta, tienen preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono.

“Halo-alquilo (C₁-C₆)” significa un grupo alquilo mencionado dentro de la expresión “alquilo (C₁-C₆)” en que uno o más átomos de hidrógeno son reemplazados por el mismo número de átomos de halógeno, idénticos o diferentes, tales como monohalo-alquilo, perhalo-alquilo, CF₃, CHF₂, CH₂F, CHFCH₃, CF₃CH₂, CF₃CF₂, CHF₂CF₂, CH₂FCHCl, CH₂Cl, CCl₃, CHCl₂ ó CH₂CH₂Cl.

ES 2 329 906 T3

“Alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆)” significa un alquilo (C₁-C₆) que está sustituido con un alcoxi (C₁-C₆).

“Alcoxi (C₁-C₆)” significa un grupo alcoxi, cuya cadena de carbonos tiene el significado dado dentro de la expresión “alquilo (C₁-C₆)”. “Halo-alcoxi” es, por ejemplo, OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, CF₃CF₂O, OCH₂CF₃ ó OCH₂CH₂Cl.

“Alqueno (C₂-C₆)” significa una cadena de carbonos no cíclica, sin ramificar o ramificada, que tiene un número de átomos de carbono que corresponde a este intervalo señalado y que contiene por lo menos un doble enlace que puede estar situado en cualquier posición del respectivo radical insaturado. “Alqueno (C₂-C₆)” designa correspondientemente, por ejemplo, al grupo vinilo, alilo, 2-metil-2-propenilo, 2-butenilo, pentenilo, 2-metil-pentenilo o hexenilo.

“Alquino (C₂-C₆)” significa una cadena de carbonos no cíclica, sin ramificar o ramificada, que tiene un número de átomos de carbono que corresponde a este intervalo señalado y que contiene un triple enlace que puede estar situado en cualquier posición del respectivo radical insaturado. “Alquino (C₂-C₆)” designa correspondientemente, por ejemplo, al grupo propargilo, 1-metil-2-propinilo, 2-butenilo o 3-butenilo.

“Cicloalquilo (C₃-C₆)” designa a radicales alquilo monocíclicos, tales como el radical ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo.

“Cicloalquil (C₃-C₇)-alquilo (C₁-C₆)” significa un grupo alquilo (C₁-C₆) que está sustituido con un grupo cicloalquilo (C₃-C₇), por ejemplo ciclopropilmetilo.

“Alquil (C₁-C₆)-CN” significa un grupo alquilo (C₁-C₆) que está sustituido con un grupo CN, por ejemplo cianoetilo.

“Alquil (C₁-C₆)-S(O)_rR⁹” significa un grupo alquilo (C₁-C₆) que está sustituido con un grupo S(O)_rR⁹, por ejemplo metiltiometo.

Un grupo “heterociclilo” puede ser saturado, insaturado o heteroaromático; contiene preferiblemente uno o más, en particular 1, 2 ó 3, heteroátomos en el anillo heterocíclico, seleccionados preferiblemente entre el conjunto que consiste en N, O y S; es preferiblemente un radical heterociclilo alifático que tiene de 3 a 7 átomos de anillo o un radical heteroaromático que tiene de 5 a 7 átomos de anillo. El radical heterocíclico puede ser, por ejemplo, un radical o anillo heteroaromático (heteroarilo) tal como, por ejemplo, un sistema aromático mono-, bi- o poli-cíclico, en el que por lo menos 1 anillo contiene uno o más heteroátomos, por ejemplo piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo, o es un radical parcial o totalmente hidrogenado tal como oxiranilo, oxetanilo, oxolanilo (= tetrahidrofurilo), oxanilo, pirrolidilo, piperidilo, piperazinilo, dioxolanilo, oxazolinilo, isoxazolinilo, oxazolidinilo, isoxazolidinilo y morfolinilo.

La expresión “uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en” en la definición se ha de entender como que significa en cada caso uno o más radicales idénticos o diferentes, seleccionados entre el conjunto señalado de radicales, a menos que se definan expresamente limitaciones específicas.

Los compuestos de la fórmula (I) señalada, de acuerdo con el invento, o sus sales, en que radicales individuales tienen uno de los significados preferidos que ya se han señalado o que se señalan a continuación y particularmente los que se muestran en los ejemplos de las Tablas, o en particular aquellos en los que se combinan dos o más de los significados preferidos que ya se han señalado o que se señalan a continuación, presentan un interés particular, principalmente a causa de la acción herbicida más potente, la mejor selectividad y(o) la mayor facilidad para la preparación.

Presentan un interés particular los compuestos de la fórmula (I), en los que un radical seleccionado entre el conjunto de radicales R¹, R², R³, R⁴, R⁵ y W se define preferiblemente como se expone seguidamente, en que la definición del radical es independiente de las definiciones de los otros radicales de dicho conjunto. Compuestos preferidos de la fórmula (I) contienen una combinación de radicales de dicho conjunto, que comprenden dos o más significados preferidos expuestos seguidamente.

En las siguientes definiciones preferidas se ha de entender generalmente que, cuando no se definen específicamente ciertos símbolos, éstos han de ser como se han definido anteriormente en la memoria descriptiva.

Preferiblemente R¹ es CONR⁶R⁷.

Preferiblemente W es C-Cl ó C-Br (más preferiblemente W es C-Cl).

Preferiblemente R² es S(O)_mR⁹, en que R⁹ es alquilo (C₁-C₃) o halo-alquilo (C₁-C₃) (más preferiblemente R⁹ es CF₃).

Preferiblemente R³ es NR¹⁰R¹¹, halógeno, OH o alcoxi (C₁-C₃).

Preferiblemente R⁴ es Cl ó Br (más preferiblemente R⁴ es Cl).

ES 2 329 906 T3

Preferiblemente R⁵ es CF₃ ó OCF₃.

Preferiblemente R⁶ es H, alquilo (C₁-C₄), halo-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₃)-alquilo (C₁-C₃), alqueno (C₃-C₄), halo-alqueno (C₃-C₄), alquino (C₃-C₄), halo-alquino (C₃-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), alquil (C₁-C₃)-tio, (CH₂)_nR¹², (CH₂)_pR¹³, alquil (C₁-C₆)-CN, alquil (C₁-C₆)-NR¹⁰R¹¹ o alquil (C₁-C₆)-S(O)_rR⁹.

Preferiblemente R⁷ es H, alquilo (C₁-C₄), alqueno (C₃-C₄) o alquino (C₃-C₄); o

preferiblemente R⁶ y R⁷ en común con el átomo de N unido a ellos, forman un anillo saturado de cinco o seis miembros, que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo, que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₃) y halo-alquilo (C₁-C₃).

Preferiblemente R¹⁰ y R¹¹ son, cada uno de ellos independientemente, H, alquilo (C₁-C₃), halo-alquilo (C₁-C₃), alqueno (C₃-C₄), halo-alqueno (C₃-C₄), alquino (C₃-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₃), COR¹⁴ ó CO₂R¹⁵; o

preferiblemente R¹⁰ y R¹¹ en común con el átomo de N unido a ellos, forman un anillo saturado de cinco o seis miembros, que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo, que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₃) y halo-alquilo (C₁-C₃).

Preferiblemente R¹² es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₃), halo-alquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), halo-alcoxi (C₁-C₃), CO₂R¹⁶, CN, NO₂, S(O)_qR⁹, COR¹⁶, CONR¹⁶R¹⁷, NR¹⁶R¹⁷ y OH.

Preferiblemente R¹³ es heterociclilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₃), halo-alquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), halo-alcoxi (C₁-C₃), NO₂, CN, CO₂R¹⁶, S(O)_qR⁹, OH y oxo.

Preferiblemente R¹⁴ y R¹⁵ son, cada uno de ellos independientemente, H, alquilo (C₁-C₃), halo-alquilo (C₁-C₃), alqueno (C₂-C₃), halo-alqueno (C₂-C₃) o alquino (C₂-C₃), particularmente alquilo (C₁-C₄).

Preferiblemente R¹⁶ y R¹⁷ son, cada uno de ellos independientemente, H, alquilo (C₁-C₃) o halo-alquilo (C₁-C₃).

Preferiblemente, cada heterociclilo en los radicales antes mencionados es independientemente un radical heterocíclico que tiene de 3 a 6 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo, seleccionados en el conjunto que consiste en N, O y S.

Una clase preferida de compuestos de la fórmula (I) para su uso como agentes reguladores del crecimiento de las plantas en el invento, es la de aquellos en los que:

R¹ es CONR⁶R⁷;

W es C-Cl ó C-Br (más preferiblemente W es C-Cl);

R² es S(O)_mR⁹;

R³ es NR¹⁰R¹¹, halógeno, OH, alcoxi (C₁-C₃), alqueno (C₂-C₆)-oxi o alquino (C₂-C₆)-oxi;

R⁴ es Cl ó Br (más preferiblemente R⁴ es Cl);

R⁵ es CF₃ ó OCF₃;

R⁶ es H, alquilo (C₁-C₄), halo-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₃)-alquilo (C₁-C₃), alqueno (C₃-C₄), halo-alqueno (C₃-C₄), alquino (C₃-C₄), halo-alquino (C₃-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), alquil (C₁-C₃)-tio, (CH₂)_nR¹² ó (CH₂)_pR¹³;

R⁷ es H, alquilo (C₁-C₄), alqueno (C₃-C₄) o alquino (C₃-C₄); o

preferiblemente R⁶ y R⁷ en común con el átomo de N unido a ellos, forman un anillo saturado de cinco o seis miembros, que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo, que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₃) y halo-alquilo (C₁-C₃);

R⁹ es alquilo (C₁-C₃) o halo-alquilo (C₁-C₃) (más preferiblemente R⁹ es CF₃);

ES 2 329 906 T3

R¹⁰ y R¹¹ son, cada uno de ellos independientemente, H, alquilo (C₁-C₃), halo-alquilo (C₁-C₃), alquenilo (C₃-C₄), halo-alquenilo (C₃-C₄), alquinilo (C₃-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₃), COR¹⁴ ó CO₂R¹⁵;
o

5 R¹⁰ y R¹¹ en común con el átomo de N de unido a ellos, forman un anillo saturado de cinco o seis miembros, que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo, que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₃) y halo-alquilo (C₁-C₃);

10 R¹² es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₃), halo-alquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), halo-alcoxi (C₁-C₃), CO₂R¹⁶, CN, NO₂, S(O)_qR⁹, COR¹⁶, CONR¹⁶R¹⁷, NR¹⁶R¹⁷ y OH;

15 R¹³ es heterociclilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₃), halo-alquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), halo-alcoxi (C₁-C₃), NO₂, CN, CO₂R¹⁶, S(O)_qR⁹, OH y oxo;

20 R¹⁴ y R¹⁵ son, cada uno de ellos independientemente, H, alquilo (C₁-C₃), halo-alquilo (C₁-C₃), alquenilo (C₂-C₃), halo-alquenilo (C₂-C₃), alquinilo (C₂-C₃) o alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄);

R¹⁶ y R¹⁷ son, cada uno de ellos independientemente, H, alquilo (C₁-C₃) o halo-alquilo (C₁-C₃); y

25 cada heterociclilo en los radicales antes mencionados es independientemente un radical heterocíclico que tiene de 3 a 6 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo, seleccionados entre el conjunto que consiste en N, O y S.

Una clase preferida adicionalmente de compuestos de la fórmula (I) para su uso como agentes reguladores del crecimiento de las plantas en el invento, es la de aquellos en los que:

30 R¹ es CONR⁶R⁷;

W es C-Cl;

35 R² es H, o S(O)_mR⁹;

R³ es NR¹⁰R¹¹, halógeno, OH o alcoxi (C₁-C₃);

R⁴ es Cl;

40 R⁵ es CF₃;

R⁶ es H, alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₃)-alquilo (C₁-C₂), alquenilo (C₃-C₄), alquinilo (C₃-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₂), alcoxi (C₁-C₃), alquil (C₁-C₃)-tio; (CH₂)_nR¹² ó (CH₂)_pR¹³;

45 R⁷ es H, alquilo (C₁-C₃), alquenilo (C₃-C₄) o alquinilo (C₃-C₄);

R⁹ es metilo o CF₃;

50 R¹⁰ y R¹¹ son, cada uno de ellos independientemente, H, alquilo (C₁-C₃), halo-alquilo (C₁-C₃), alquenilo (C₃-C₄), halo-alquenilo (C₃-C₄), alquinilo (C₃-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₃), COR¹⁴ ó CO₂R¹⁵;
o

55 R¹² es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₃), halo-alquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), CO₂R¹⁶, CN y NO₂,

R¹³ es heterociclilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₃), halo-alquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), halo-alcoxi (C₁-C₃), NO₂, CN, CO₂R¹⁶, S(O)_qR⁹, OH y oxo;

60 R¹⁴ y R¹⁵ son, cada uno de ellos independientemente, alquilo (C₁-C₃);

R¹⁶ y R¹⁷ son, cada uno de ellos independientemente, H o alquilo (C₁-C₃); y

65 cada heterociclilo en los radicales antes mencionados es independientemente un radical heterocíclico que tiene de 3 a 6 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo, seleccionados entre el conjunto que consiste en N, O y S.

ES 2 329 906 T3

Una clase preferida adicionalmente de compuestos para su uso como agentes reguladores del crecimiento de las plantas en el invento es la de los de la fórmula (Ia), tal como se representa seguidamente, en que:

5 R^1 es $CONR^6R^7$;

W es C-Cl;

R^2 es H, o $S(O)_mR^9$;

10 R^3 es NHR^{10} ;

R^4 es Cl;

R^5 es CF_3 ;

15 R^6 es H, alquilo (C_1-C_5), alcoxi (C_1-C_2)-alquilo (C_1-C_2), alquenilo (C_3-C_4), alquinilo (C_3-C_4), cicloalquilo (C_3-C_6), cicloalquil (C_3-C_6)-alquilo (C_1-C_2), furfurilo o tetrahydrofurfurilo;

R^7 es H o alquilo (C_1-C_3),

20 R^9 es metilo, etilo o CF_3 ;

R^{10} es H, metilo o etilo.

25 Una clase preferida adicionalmente de compuestos para su uso como agentes reguladores del crecimiento de las plantas en el invento es la de los de la fórmula (Ib), tal como se representa seguidamente, en que:

R^1 es CO_2R^8 ;

30 W es C-Cl;

R^2 es H, o $S(O)_mR^9$;

R^3 es $NR^{10}R^{11}$;

35 R^4 es Cl;

R^5 es CF_3 ;

40 R^8 es H, metilo o etilo.

R^9 es metilo, etilo o CF_3 ;

R^{10} es H, metilo o etilo; y

45 R^{11} es H.

Una clase preferida adicionalmente de compuestos para su uso como agentes reguladores del crecimiento de las plantas en el invento es la de los de la fórmula (Ic), tal como se representa seguidamente, en que:

50 R^1 es $CONR^6R^7$;

W es C-Cl;

55 R^2 es $S(O)_mCF_3$;

R^3 es $NR^{10}R^{11}$, halógeno, OH o alquilo (C_1-C_2);

R^4 es Cl;

60 R^5 es CF_3 ;

R^6 es H o alquil (C_1-C_3)-tio;

65 R^7 es H;

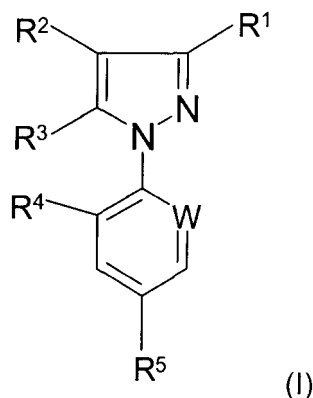
R^{10} es alquilo (C_1-C_3), COR^{14} ó CO_2R^{15} ;

ES 2 329 906 T3

R^{11} , R^{14} y R^{15} son, cada uno de ellos independientemente, alquilo (C_1 - C_3).

Algunos de los compuestos de la fórmula (I) no son conocidos en la técnica anterior. Por lo tanto, una característica adicional del invento se refiere a estos nuevos compuestos de la fórmula (I)

Por lo tanto, de acuerdo con una característica adicional del invento, se proporciona un derivado de ácido 1-aril-pirazol-3-carboxílico sustituido en posición 5 de la fórmula (I), o una sal del mismo tal como define en la fórmula (I),



en la que:

- i) R^1 es CO_2R^8 ;
 R^2 es H ó $S(O)_mR^9$;
 R^3 y m son como antes se han definido;
 R^8 es H;
 R^9 es alquilo (C_2 - C_6) o halo-alquilo (C_1 - C_6);
 R^4 es Cl;
 R^5 es CF_3 ; y
W es C-Cl;

o

- ii) R^1 es $CONR^6R^7$;
 R^6 es alquilo (C_1 - C_6), halo-alquilo (C_1 - C_6), alcoxi (C_1 - C_6)-alquilo (C_1 - C_6), alqueni-
lo (C_2 - C_6), halo-alqueni-
lo (C_2 - C_6), alquini-
lo (C_2 - C_6), halo-alquini-
lo (C_2 - C_6), cicloalquil (C_3 - C_7)-alquilo (C_1 -
 C_6), alcoxi (C_1 - C_6), alquil (C_1 - C_6)-tio, $(CH_2)_nR^{12}$, $(CH_2)_pR^{13}$, alquil (C_1 - C_6)-CN, alquil (C_1 - C_6)- $NR^{10}R^{11}$ o
alquil (C_1 - C_6)- $S(O)_rR^9$; o

R^6 y R^7 en común con el átomo de N unido a ellos, forman un anillo saturado de cinco o seis miembros, que
opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo, el cual se selecciona entre O, S y N, estando
el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en
halógeno, alquilo (C_1 - C_6) y halo-alquilo (C_1 - C_6);

R^2 , R^3 , R^7 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , n, p y r son como se definen en la fórmula (I);

R^4 es Cl; R^5 es CF_3 ; y W es C-Cl; con la exclusión del compuesto en el que:

R^1 es $CON(CH_3)_2$; R^2 es CF_3S ; R^3 es OH; R^4 es Cl, R^5 es CF_3 ; y W es C-Cl.

El anterior compuesto es excluido específicamente puesto que es conocido, sin embargo, todavía no se ha informa-
do de su uso como agente regulador del crecimiento de las plantas.

Los compuestos de la fórmula (I) anterior se pueden preparar mediante la aplicación o adaptación de métodos
conocidos (es decir métodos usados anteriormente o descritos en la bibliografía).

ES 2 329 906 T3

En la descripción siguiente, cuando no se definen específicamente símbolos que aparecen en las fórmulas, ha de entenderse que éstos son como “se ha definido anteriormente” de acuerdo con la primera definición de cada símbolo en la memoria descriptiva.

5 Ha de entenderse que en las descripciones de los siguientes procedimientos, las secuencias se pueden realizar en diferentes órdenes, y que se pueden requerir apropiados grupos protectores para conseguir los compuestos deseados.

Se pueden preparar compuestos de la fórmula (I) anterior mediante la aplicación o adaptación de métodos conocidos (es decir métodos utilizados con anterioridad o descritos en la bibliografía).

10

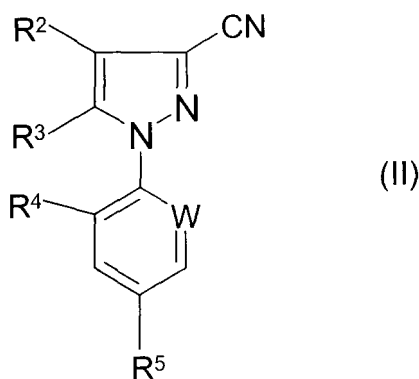
En la descripción siguiente, cuando no se definen específicamente símbolos que aparecen en las fórmulas, ha de entenderse que éstos son como “se han definido anteriormente” de acuerdo con la primera definición de cada símbolo en la memoria descriptiva.

15 Ha de entenderse que en las descripciones de los siguientes procedimientos, las secuencias se pueden realizar en diferentes órdenes, y que se pueden requerir apropiados grupos protectores para conseguir los compuestos deseados.

De acuerdo con una característica del invento, compuestos de la fórmula (I) en la que R^1 es CO_2H , R^2 es H ó S(O) $_mR^9$, R^9 es alquilo (C_2-C_6) o halo-alquilo (C_1-C_6), y los otros radicales son como se han definido anteriormente, se pueden preparar mediante la reacción de un correspondiente compuesto de la fórmula (II):

20

25



30

35

40 en la que R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y W son como se han definido anteriormente, usando un ácido sulfúrico acuoso, generalmente un ácido sulfúrico al 40% hasta 60%, a una temperatura situada entre 80°C y 170°C, preferiblemente de 120°C a 150°C.

De acuerdo con una característica adicional del invento, compuestos de la fórmula (I) en la que R^1 es CO_2H , R^2 es H, R^3 es NHR^{11} , y los otros radicales son como se han definido anteriormente, se pueden preparar mediante la reacción de un correspondiente compuesto de la fórmula (II) anterior, en la que R^2 es R^9SO ó R^9SO_2 (preferiblemente CF_3SO ó CF_3SO_2), usando un ácido sulfúrico acuoso, generalmente un ácido sulfúrico al 40% hasta 60%, a una temperatura situada entre 80°C y 170°C, preferiblemente de 120°C a 150°C.

45

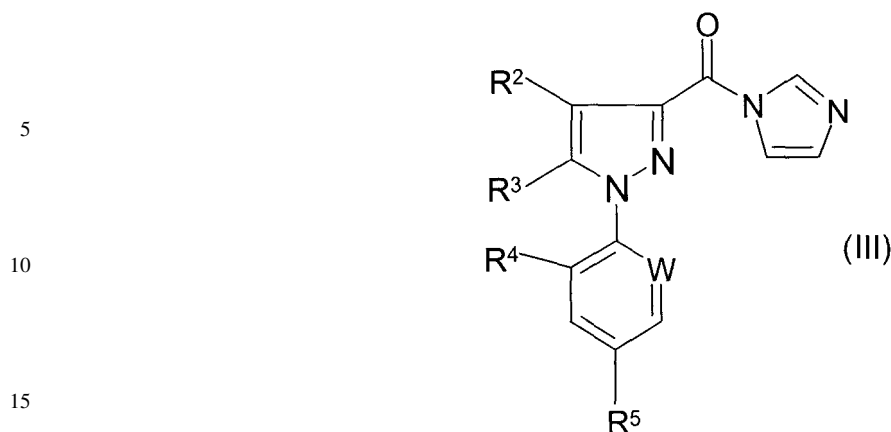
De acuerdo con una característica adicional del invento, compuestos de la fórmula (I) en la que R^1 es $CONR^6R^7$; R^6 es alquilo (C_1-C_6), halo-alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6), alqueno (C_2-C_6), halo-alqueno (C_2-C_6), alquino (C_2-C_6), halo-alquino (C_2-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7), cicloalquil (C_3-C_7)-alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), $(CH_2)_nR^{12}$, $(CH_2)_pR^{13}$, alquil (C_1-C_6)-CN, alquil (C_1-C_6)- $NR^{10}R^{11}$ o alquil (C_1-C_6)- $S(O)_rR^9$; R^7 es como antes se ha definido; o

50

R^6 y R^7 en común con el átomo de N unido a ellos, forman un anillo saturado de cinco o seis miembros, que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo, que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C_1-C_6) y halo-alquilo (C_1-C_6); y los otros radicales son como antes se han definido, se pueden preparar mediante la reacción de un correspondiente compuesto de la fórmula (I) en la que R^1 es CO_2H , con N,N'-carbonil-diimidazol para dar la correspondiente imidazolida de la fórmula III:

60

65



20 seguido por la reacción, preferiblemente *in situ*, con una amina de la fórmula (IV):



25 en la que R^6 y R^7 son como antes se han definido. La reacción se realiza generalmente en el seno de un disolvente tal como tetrahidrofurano o dioxano, a una temperatura comprendida entre 20°C y 100°C , preferiblemente entre 30°C y 70°C .

30 De acuerdo con una particularidad adicional del invento, compuestos de la fórmula (I) en la que R^3 es $\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$, en que por lo menos uno de los R^{10} y R^{11} no es H, y los otros radicales son como antes se han definido, se pueden preparar mediante la alquilación o acilación del correspondiente compuesto de la fórmula (I), en la que R^3 es NH_2 , usando un agente de alquilación o de acilación de la fórmula (V) o (VI):



35 en las que R^{10} y R^{11} son como antes se han definido, con la exclusión de H, y L y L^1 son, cada uno de ellos, un grupo lábil.

40 Las alquilaciones, cuando R^{10} y/o R^{11} son, cada uno, alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), halo-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), alqueno ($\text{C}_3\text{-C}_6$), halo-alqueno ($\text{C}_3\text{-C}_6$), alquino ($\text{C}_3\text{-C}_6$), cicloalquilo ($\text{C}_3\text{-C}_6$) o cicloalquil ($\text{C}_3\text{-C}_6$)-alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), y L y L^1 son, cada uno de ellos, preferiblemente halógeno, alquilsulfoniloxi o arilsulfoniloxi (más preferiblemente cloro, bromo, yodo, metilsulfoniloxi o p-toluenosulfoniloxi) se llevan a cabo generalmente en la presencia de una base, en el seno de un disolvente inerte tal como tetrahidrofurano, dioxano, acetonitrilo, tolueno, dietil-éter, diclorometano, dimetil-sulfóxido o N,N-dimetil-formamida, a una temperatura comprendida entre -30°C y 200°C , preferiblemente a 20°C hasta 100°C . La base es generalmente un hidróxido de un metal alcalino tal como hidróxido de potasio, un hidruro de un metal alcalino tal como hidruro de sodio, un carbonato de un metal alcalino tal como carbonato de potasio o carbonato de sodio, un alcóxido de un metal alcalino tal como metóxido de sodio, un carbonato de un metal alcalino-térreo tal como carbonato de calcio, o una base orgánica tal como una amina terciaria, por ejemplo trietil-amina o etil-diisopropil-amina, o piridina, o 1,8-diaza-biciclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU).

50 Las acilaciones, cuando R^{10} y/o R^{11} son, cada uno de ellos, COR^{14} ó CO_2R^{15} , y L y L^1 son, cada uno de ellos, preferiblemente cloro o bromo (más preferiblemente cloro), se realizan opcionalmente en la presencia de una base. Las bases, los disolventes y las temperaturas que se pueden usar son similares a las o los que se emplean para las alquilaciones.

55 Realizando reacciones secuenciales de alquilación o acilación, se pueden preparar compuestos de la fórmula (I) en la que R^3 es $\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$ en que R^{10} y R^{11} tienen diferentes significados.

60 De acuerdo con una característica adicional del invento, compuestos de la fórmula (I) en la que R^1 es CONR^6R^7 , R^2 es $\text{S(O)}_m\text{R}^9$, R^3 es alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), R^6 es alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-tio, y los otros radicales son como antes se ha definido, se pueden preparar mediante la reacción de un correspondiente compuesto de la fórmula (I) en la que R^1 es CONHR^7 , con un compuesto de la fórmula (VII):



65 en la que R^6 es alquil ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-tio y L^2 es un grupo lábil, generalmente halógeno y preferiblemente Cl.

ES 2 329 906 T3

De acuerdo con una particularidad adicional del presente invento, compuestos en los que m es 1 ó 2, y los otros radicales son como antes se han definido, se pueden preparar oxidando un correspondiente compuesto en el que m es 0 ó 1. La oxidación se realiza generalmente usando un agente oxidante tal como ácido *m*-cloro-perbenzoico o peryodato de sodio en el seno de un disolvente inerte, por ejemplo cloruro de metileno, a una temperatura de desde -40°C a la temperatura de reflujo del disolvente.

Compuestos de la fórmula (I) en la que R^1 es CONH_2 , se pueden preparar a partir de los correspondientes compuestos en que R^1 es CN, de acuerdo con métodos conocidos, por ejemplo mediante la reacción con un ácido sulfúrico concentrado a una temperatura de 50°C a 150°C .

Compuestos intermedios de la fórmula (II) en la que R^3 es $\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$ o halógeno, se pueden preparar de acuerdo con métodos que se describen en los documentos de Publicación de Patentes números WO 87/03781, EP 295117 y US 5232940.

Compuestos intermedios de la fórmula (II) en la que R^3 es alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$), se pueden preparar de acuerdo con métodos descritos en los documentos de Publicación de Patentes números EP 035809 y US 5047550.

Compuestos intermedios de la fórmula (II) en la que R^3 es OH, se pueden preparar de acuerdo con métodos descritos en el documento de Publicación de Patente número WO 01/40195.

Los compuestos de la fórmula (III) son nuevos y como tales constituyen una característica adicional del invento, y se pueden preparar como antes se ha descrito.

Los compuestos de las fórmulas (II), (IV), (V), (VI) y (VII) son conocidos o se pueden preparar de acuerdo con métodos conocidos.

Una colección de compuestos de la fórmula (I), que se pueden sintetizar de acuerdo con los procedimientos antes mencionados, se puede preparar adicionalmente de una manera paralela, lo cual se puede efectuar de una manera manual, parcialmente automática o plenamente automática. En este contexto, es posible automatizar el proceso de la reacción, el tratamiento o la purificación de los productos o de los compuestos intermedios. En total, se ha de entender que esto significa un proceso tal como se describe, por ejemplo, por S.H. DeWitt en "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis" [Informes anuales acerca de la química combinatoria y diversidad molecular: Síntesis automáticas], volumen 1, publicado por Escom., 1997, páginas 69 a 77.

Para llevar a cabo la reacción y el tratamiento de una manera paralela, se pueden usar una serie de equipos disponibles comercialmente, tal como se están disponibles, por ejemplo, a partir de Stem Corporation, Woodrolfe Road, Tollesbury, Essex, CM9 8SE Inglaterra, o de Radleys Discovery Technologies, Saffron Walden, Essex, CB11 3AZ, Inglaterra. Para llevar a cabo la purificación paralela de compuestos (I), o de compuestos intermedios obtenidos durante la preparación, están disponibles, entre otros, unos equipos para cromatografía, por ejemplo los procedentes de ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, EE.UU. Los equipos mencionados hacen posible un proceso modular, en el que las etapas individuales del procedimiento son automáticas, pero entre las etapas se debe de llevar a cabo sin embargo alguna operación manual. Esto se puede evitar mediante el empleo de sistemas de automatización parcial o totalmente integrados, en los que los módulos de automatización en cuestión son manipulados, por ejemplo, mediante autómatas o robots. Tales sistemas de automatización se pueden adquirir por ejemplo de Zymark Corporation, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, EE.UU.

Además de los métodos antes descritos, los compuestos de la fórmula (I) se pueden preparar mediante métodos que se apoyan total o parcialmente en fases sólidas. Para esta finalidad, compuestos intermedios individuales, o todos los compuestos intermedios de la síntesis o de una síntesis adaptada para acomodarse al proceso en cuestión, se realizan de un modo fijado a una resina de síntesis. Métodos de síntesis que se apoyan en fases sólidas se han descrito extensamente en la bibliografía especializada, por ejemplo en la cita de: Barry A. Bunin en "The Combinatorial Index" [El índice combinatorio], publicado por Academic Press, 1998.

El uso de métodos de síntesis, que se apoyan en fases sólidas, permite una serie de protocolos que son conocidos a partir de la bibliografía que, a su vez, se pueden realizar de una manera manual o automática. Por ejemplo el "método de la bolsa de té" (de Houghten, véase el documento de patente de los EE.UU. US 4.631.211; y la cita de Houghten y colaboradores, Proc. Natl. Acad. Sci., 1985, 82, 5.131 - 5.135) puede ser parcialmente automatizado con productos de IRORI, 11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, EE.UU. Síntesis paralelas, que se apoyan en fases sólidas, se pueden automatizar satisfactoriamente, por ejemplo usando equipos de Argonaut Technologies, Inc., 887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070, EE.UU. o de MultiSynTech GmbH, Wullener Feld 4, 58454 Witten, Alemania.

La preparación de acuerdo con los procedimientos que aquí se describen, proporciona compuestos de la fórmula (I) en la forma de colecciones de sustancias o bibliotecas de sustancias. Son materia objetivo del presente invento, por lo tanto, también bibliotecas de los compuestos de la fórmula (I) que contienen por lo menos dos compuestos de la fórmula (I), y de sus precursores.

Los siguientes Ejemplos no limitativos ilustran la preparación de los compuestos de la fórmula (I).

ES 2 329 906 T3

A. Ejemplos químicos

En los Ejemplos que siguen, las cantidades (y también los porcentajes) se basan en el peso, a menos que se señale otra cosa distinta. Las relaciones entre disolventes se basan en los volúmenes.

5

Ejemplo 1

Ácido 5-amino-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometil-fenil)-4-trifluorometiltio-1H-pirazol-3-carboxílico (Compuesto 2.10)

10 Una mezcla agitada de 5-amino-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometil-fenil)-4-trifluorometiltio-1H-pirazol-3-carbonitrilo (35,5 g, 84,3 mmol) y de ácido sulfúrico (al 50%, 600 ml) se calentó a 135°C durante 7 horas. La mezcla enfriada se añadió a una mezcla de hielo y agua, y el precipitado se separó por filtración, se lavó con agua y se secó en aire. La trituración con tetraclorometano dio el compuesto del título en forma de cristales de color blancuzco (30,6 g, rendimiento 82%), p.f. 199°C, ¹H RMN (DMSO-d₆): 6,66 (s ancho, 2H, NH₂), 8,23 (s, 2H, Ar-H), y 13,03 (s ancho, 1H, COOH).

15

Ejemplo 2

Amida de ácido 5-amino-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometil-fenil)-4-trifluorometiltio-1H-pirazol-3-carboxílico (Compuesto 1.4)

20

Una mezcla de ácido 5-amino-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometil-fenil)-4-trifluorometiltio-1H-pirazol-3-carboxílico (1,00 g, 2,27 mmol) y de 1,1-dicarbonil-imidazol (0,45 g, 2,72 mmol) en dioxano se calentó a 50°C durante 2 horas. Luego se añadió una solución acuosa de amoníaco (al 33%, 80 ml) y se continuó la agitación a 50°C, durante 4 horas. La mezcla enfriada se diluyó con agua y se extrajo con una mezcla de acetato de etilo y heptano (1:1). La fase orgánica combinada se lavó con hidrógeno-sulfato de potasio acuoso (al 5%), se secó sobre sulfato de magnesio y se evaporó para dar el compuesto del título (0,980 g, rendimiento 98%) como una espuma de color blanco, ¹H RMN (CDCl₃): 4,36 (s ancho, 2H, NH₂), 5,60 y 6,69 (s ancho, 2H, C(O)NH₂), y 7,82 (s, 2H, Ar-H).

25

Ejemplo 3

Ciclopropil-amida de ácido 5-amino-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometil-fenil)-4-trifluorometiltio-1H-pirazol-3-carboxílico (Compuesto 1.1)

35 Una mezcla de ácido 5-amino-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometil-fenil)-4-trifluorometiltio-1H-pirazol-3-carboxílico (0,85 g, 1,83 mmol) y de 1,1-dicarbonil-imidazol (0,36 g, 2,20 mmol) en dioxano se calentó a 55°C durante 2 horas. Se añadió luego ciclopropil-amina (0,20 ml, 2,83 mmol) y se continuó la agitación a 55°C durante 6 horas. La mezcla enfriada se diluyó con agua, se extrajo con acetato de etilo, se lavó con una solución acuosa de hidrógeno-sulfato de potasio (al 5%), se secó sobre sulfato de magnesio y se evaporó para dar el compuesto del título (0,762 g, rendimiento 87%) como cristales de color blancuzco, p.f. 193°C ¹H RMN (CDCl₃): 0,64 (m, 2H, ciclopropilo), 0,83 (m, 2H, ciclopropilo), 2,87 (m, 1H, ciclopropilo), 4,31 (s ancho, 2H, NH₂), 6,82 (s ancho, 1H, C(O)NH), y 7,80 (s, 2H, Ar-H).

40

Ejemplo 4

Propargil-amida de ácido 5-amino-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometil-fenil)-4-trifluorometilsulfinil-1H-pirazol-3-carboxílico (Compuesto 1.134)

45

A una suspensión de propargil-amida de ácido 5-amino-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometil-fenil)-4-trifluorometiltio-1H-pirazol-3-carboxílico (0,71 g, 1,43 mmol) en diclorometano se le añadió lentamente una solución de ácido *m*-cloro-perbenzoico (al 70%, 0,41 g, 1,68 mmol) en diclorometano. Después de haber agitado durante 17 horas a 20°C, se añadió una solución acuosa de sulfito de sodio e hidrógeno-carbonato de sodio (5%: 5%, 25 ml) y se continuó la agitación durante 15 minutos. La fase acuosa se extrajo con diclorometano, se secó sobre sulfato de magnesio, se evaporó y se purificó por cromatografía con resolución súbita (en presencia de sílice, con una mezcla de heptano y acetato de etilo) para dar el compuesto del título (0,604 g, rendimiento 86%) en forma de cristales de color blanco, p.f. 207°C, ¹H RMN (CDCl₃): 2,28 (t, 1H, propargilo), 4,20 (m, 2H, propargilo), 5,17 (s ancho, 2H, NH₂), 6,88 (t ancho, 1H, C(O)NH), y 7,83 (s, 2H, Ar-H).

55

Ejemplo 5

Amida de ácido 5-amino-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometil-fenil)-4-trifluorometilsulfinil-1H-pirazol-3-carboxílico (Compuesto 1.268)

60

Una mezcla agitada de 5-amino-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometil-fenil)-4-trifluorometil-sulfinil-1H-pirazol-3-carbonitrilo (1,06 g, 2,21 mmol) y de ácido sulfúrico concentrado (1 ml) se calentó a 100°C durante 3 horas. La mezcla enfriada se añadió a una mezcla de hielo y agua y el precipitado se separó por filtración, se lavó con agua y se secó en aire. La purificación por cromatografía con resolución súbita (en presencia de sílice, con cloroformo) dio el compuesto del título (0,869 g, rendimiento 83%) como cristales de color blancuzco, p.f. 217°C, ¹H RMN (DMSO-d₆): 7,39 (s ancho, 2H, NH₂), 7,57 y 7,78 (s ancho, 2H, C(O)NH₂) y 8,25 s, 2H, Ar-H).

65

ES 2 329 906 T3

Ejemplo 6

Ácido 5-amino-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometil-fenil)-1H-pirazol-2-carboxílico (Compuesto 2.1)

5 Una mezcla agitada de 5-amino-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometil-fenil)-4-trifluorometil-sulfinil-1H-pirazol-3-carbonitrilo (5,00 g, 11,4 mmol) y de ácido sulfúrico (al 50%, 100 ml) se calentó a 135°C durante 3 horas. La mezcla enfriada se añadió a una mezcla de hielo y agua, y el pH se ajustó a 4 mediante la adición de hidróxido de sodio acuoso (6 N, aproximadamente 230 ml), y luego se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, se evaporó hasta sequedad y se purificó por cromatografía con resolución súbita (en presencia de sílice, con una mezcla de cloroformo y etanol) con subsiguiente trituración con tetraclorometano para dar el compuesto del título (3,00 g, rendimiento 77%) en forma de cristales de color blancuzco, p.f. 213°C, ¹H RMN (DMSO-d₆): 5,69 (s ancho, 2 H, NH₂), 5,76 (s, 1H, pirazol-H) y 8,20 (s, 2H, Ar-H).

Ejemplo 7

15 *Amida de ácido 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometil-fenil)-5-etoxi-4-trifluorometiltio-1H-pirazol-3-carboxílico (Compuesto 3.3)*

20 a) A una suspensión agitada de hidruro de sodio (0,41 g, al 60%, 10,3 mmol) en dioxano (150 ml) se le añadió una solución de 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometil-fenil)-5-hidroxi-4-trifluorometiltio-1H-pirazol-3-carbonitrilo (4,00 g, 8,53 mmol) en dioxano (50 ml). Después de que hubo cesado el desprendimiento de gases, la mezcla se calentó a reflujo y se añadió sulfato de dietilo (1,25 ml, 9,47 mmol), y luego se calentó a reflujo durante 6 horas. La mezcla enfriada se acidificó con una solución acuosa de hidrógeno-sulfato de potasio (al 5%), se extrajo con diclorometano, y la fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio y se evaporó. La goma resultante se trituró con pentano para dar 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometil-fenil)-5-etoxi-4-trifluorometiltio-1H-pirazol-carbonitrilo (2,68 g, rendimiento 70%) en forma de cristales de color blancuzco, p.f. 106°C, ¹H RMN (CDCl₃): 1,36 (t, 3H, CH₃), 4,71 (q, 2H, OCH₂) y 7,76 (s, 2H, Ar-H).

30 b) Una mezcla agitada de 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometil-fenil)-5-etoxi-4-trifluorometiltio-1H-pirazol-3-carbonitrilo (0,55 g, 1,22 mmol) y de ácido sulfúrico concentrado (0,55 ml) se calentó a 100°C durante 3 horas. La mezcla enfriada se añadió a una mezcla de hielo y agua y el precipitado se separó por filtración, se lavó con agua y se secó en aire. El producto bruto se disolvió en una mezcla de heptanos y acetato de etilo (1:1) y se filtró. El material filtrado se evaporó para dar el compuesto del título (0,42 g, rendimiento 73%) en forma de cristales de color amarillento, p.f. 161°C, ¹H RMN (CDCl₃): 1,32 (t, 3H, CH₃), 4,68 (q, 2H, OCH₂), 5,54 y 6,69 (s ancho, 2H, C(O)NH₂) y 7,77 (s, 2H, Ar-H).

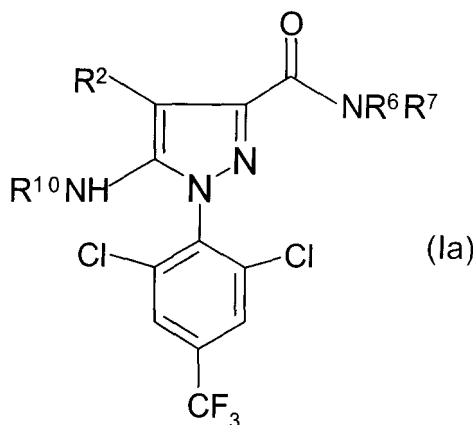
40 Los siguientes compuestos preferidos de las fórmulas (Ia), (Ib) y (Ic), mostrados en las Tablas 1 a 3, forman también parte del presente invento y se obtienen mediante, o de una manera análoga a, los anteriores Ejemplos 1 a 7, o los métodos generales antes descritos.

Las siguientes abreviaturas se usan en las Tablas 1 a 3.

45 “Cpd” significa Número de Compuesto. Los Números de Compuestos se dan solamente con finalidades de referencia. RF significa el tiempo de retención determinado a partir de una cromatografía de capa fina sobre gel de sílice, usando acetato de etilo como eluyente.

TABLA 1

Compuestos de la fórmula (Ia)



ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
1.1	SCF ₃	ciclopropilo	H	H	193	0,88
1.2	SCF ₃	CH ₂ CH=CH	H	H	espuma	0,90
1.3	SCF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	169	0,94
1.4	SCF ₃	H	H	H	espuma	0,90
1.5	SCF ₃	CH ₃	H	H	espuma	0,90
1.6	SCF ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	196	0,93
1.7	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	187	0,97
1.8	SCF ₃	CH(CH ₃) ₂	H	H	215	0,90
1.9	SCF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	150	0,92
1.10	SCF ₃	ciclohexilo	H	H	172	0,94
1.11	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H	espuma	0,88
1.12	SCF ₃	2-tetrahidrofurfurilo	H	H	espuma	0,89
1.13	SCF ₃	2-furfurilo	H	H	espuma	0,94
1.14	SCF ₃	CH ₂ CN	H	H		
1.15	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ CN	H	H		
1.16	SCF ₃	CH ₂ -ciclopropilo	H	H		
1.17	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H		
1.18	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	H	H		
1.19	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H		
1.20	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.21	SCF ₃	CH ₂ CF ₃	H	H		
1.22	SCF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	H		
10 1.23	SCF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	H	H		
1.24	SCF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	H	H		
15 1.25	SCF ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	H	H		
1.26	SCF ₃	CH ₂ -3-piridilo	H	H		
20 1.27	SCF ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	H	H		
1.28	SCF ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	H	H		
25 1.29	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	H	H		
1.30	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	H	H		
30 1.31	SCF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	H	H		
1.32	SCF ₃	ciclopropilo	CH ₃	H		
35 1.33	SCF ₃	CH ₂ CH=CH	CH ₃	H		
1.34	SCF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H	espuma	0,87
40 1.35	SCF ₃	CH ₃	CH ₃	H	183	0,87
1.36	SCF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	espuma	0,91
45 1.37	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	espuma	0,88
1.38	SCF ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H		
50 1.39	SCF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	H		
1.40	SCF ₃	ciclohexilo	CH ₃	H		
55 1.41	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H		
1.42	SCF ₃	2-tetrahidrofurfurilo	CH ₃	H		
60 1.43	SCF ₃	2-furfurilo	CH ₃	H		
1.44	SCF ₃	CH ₂ CN	CH ₃	H		
65 1.45	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ CN	CH ₃	H		
1.46	SCF ₃	CH ₂ -ciclopropilo	CH ₃	H		
1.47	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.48	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	CH ₃	H		
1.49	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H		
10 1.50	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	H		
1.51	SCF ₃	CH ₂ CF ₃	CH ₃	H		
15 1.52	SCF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H		
1.53	SCF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	CH ₃	H		
20 1.54	SCF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	CH ₃	H		
1.55	SCF ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H		
25 1.56	SCF ₃	CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	H		
1.57	SCF ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	CH ₃	H		
30 1.58	SCF ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	CH ₃	H		
1.59	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H		
35 1.60	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	H		
1.61	SCF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	CH ₃	H		
40 1.62	SCF ₃	ciclopropilo	H	CH ₃		
1.63	SCF ₃	CH ₂ CH=CH	H	CH ₃		
45 1.64	SCF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃		
1.65	SCF ₃	H	H	CH ₃	espuma	0,90
50 1.66	SCF ₃	CH ₃	H	CH ₃		
1.67	SCF ₃	CH ₂ CH ₃	H	CH ₃		
55 1.68	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CH ₃		
1.69	SCF ₃	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃		
60 1.70	SCF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	CH ₃		
1.71	SCF ₃	ciclohexilo	H	CH ₃		
65 1.72	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃		
1.73	SCF ₃	2-tetrahidrofurfurilo	H	CH ₃		
1.74	SCF ₃	2-furfurilo	H	CH ₃		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.75	SCF ₃	CH ₂ CN	H	CH ₃		
1.76	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ CN	H	CH ₃		
10 1.77	SCF ₃	CH ₂ -ciclopropilo	H	CH ₃		
1.78	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃		
15 1.79	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	H	CH ₃		
1.80	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃		
20 1.81	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃		
1.82	SCF ₃	CH ₂ CF ₃	H	CH ₃		
25 1.83	SCF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃		
1.84	SCF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	H	CH ₃		
30 1.85	SCF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	H	CH ₃		
1.86	SCF ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	H	CH ₃		
35 1.87	SCF ₃	CH ₂ -3-piridilo	H	CH ₃		
1.88	SCF ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	H	CH ₃		
40 1.89	SCF ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	H	CH ₃		
1.90	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	H	CH ₃		
45 1.91	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	H	CH ₃		
1.92	SCF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	H	CH ₃		
50 1.93	SCF ₃	ciclopropilo	CH ₃	CH ₃		
1.94	SCF ₃	CH ₂ CH=CH	CH ₃	CH ₃		
55 1.95	SCF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃		
1.96	SCF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	espuma	0,90
60 1.97	SCF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.98	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
65 1.99	SCF ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
1.100	SCF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.101	SCF ₃	ciclohexilo	CH ₃	CH ₃		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
1.102	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.103	SCF ₃	2-tetrahidrofurfurilo	CH ₃	CH ₃		
1.104	SCF ₃	2-furfurilo	CH ₃	CH ₃		
1.105	SCF ₃	CH ₂ CN	CH ₃	CH ₃		
1.106	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ CN	CH ₃	CH ₃		
1.107	SCF ₃	CH ₂ -ciclopropilo	CH ₃	CH ₃		
1.108	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
1.109	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
1.110	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.111	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.112	SCF ₃	CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃		
1.113	SCF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃		
1.114	SCF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.115	SCF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.116	SCF ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃		
1.117	SCF ₃	CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	CH ₃		
1.118	SCF ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	CH ₃	CH ₃		
1.119	SCF ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	CH ₃	CH ₃		
1.120	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃		
1.121	SCF ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	CH ₃		
1.122	SCF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	CH ₃	CH ₃		
1.123	SCF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	espuma	0,92
1.124	SCF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃		
1.125	SCF ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -		H		
1.126	SCF ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -		H		
1.127	SCF ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		H		
1.128	SCF ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
1.129	SCF ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -		CH ₃		
1.130	SCF ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -		CH ₃		
1.131	SCF ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CH ₃		
1.132	SCF ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		CH ₃		
1.133	S(O)CF ₃	ciclopropilo	H	H	180	0,93
1.134	S(O)CF ₃	CH ₂ CH=CH	H	H	207	0,93
1.135	S(O)CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	aceite	0,94
1.136	S(O)CF ₃	H	H	H	224	0,91
1.137	S(O)CF ₃	CH ₃	H	H	205	0,90
1.138	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	211	0,91
1.139	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	206	0,96
1.140	S(O)CF ₃	CH(CH ₃) ₂	H	H	191	0,89
1.141	S(O)CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	171	0,91
1.142	S(O)CF ₃	ciclohexilo	H	H	espuma	0,91
1.143	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H	164	0,90
1.144	S(O)CF ₃	2-tetrahidrofurfurilo	H	H	141	0,91
1.145	S(O)CF ₃	2-furfurilo	H	H	espuma	0,93
1.146	S(O)CF ₃	CH ₂ CN	H	H		
1.147	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ CN	H	H		
1.148	S(O)CF ₃	CH ₂ -ciclopropilo	H	H		
1.149	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H		
1.150	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	H	H		
1.151	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H		
1.152	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H		
1.153	S(O)CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	H		
1.154	S(O)CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	H		
1.155	S(O)CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	H	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
1.156	S(O)CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	H	H		
1.157	S(O)CF ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	H	H		
1.158	S(O)CF ₃	CH ₂ -3-piridilo	H	H		
1.159	S(O)CF ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	H	H		
1.160	S(O)CF ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	H	H		
1.161	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	H	H		
1.162	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	H	H		
1.163	S(O)CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	H	H		
1.164	S(O)CF ₃	ciclopropilo	CH ₃	H		
1.165	S(O)CF ₃	CH ₂ CH=CH	CH ₃	H		
1.166	S(O)CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H	espuma	0,92
1.167	S(O)CF ₃	CH ₃	CH ₃	H	196	0,90
1.168	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	185	0,91
1.169	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	156	0,89
1.170	S(O)CF ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H		
1.171	S(O)CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	H		
1.172	S(O)CF ₃	ciclohexilo	CH ₃	H		
1.173	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H		
1.174	S(O)CF ₃	2-tetrahidrofurfurilo	CH ₃	H		
1.175	S(O)CF ₃	2-furfurilo	CH ₃	H		
1.176	S(O)CF ₃	CH ₂ CN	CH ₃	H		
1.177	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ CN	CH ₃	H		
1.178	S(O)CF ₃	CH ₂ -ciclopropilo	CH ₃	H		
1.179	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H		
1.180	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	CH ₃	H		
1.181	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H		
1.182	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.183	S(O)CF ₃	CH ₂ CF ₃	CH ₃	H		
1.184	S(O)CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H		
10 1.185	S(O)CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	CH ₃	H		
1.186	S(O)CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	CH ₃	H		
15 1.187	S(O)CF ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H		
1.188	S(O)CF ₃	CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	H		
20 1.189	S(O)CF ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	CH ₃	H		
1.190	S(O)CF ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	CH ₃	H		
25 1.191	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H		
1.192	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	H		
30 1.193	S(O)CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	CH ₃	H		
1.194	S(O)CF ₃	ciclopropilo	H	CH ₃		
35 1.195	S(O)CF ₃	CH ₂ CH=CH	H	CH ₃		
1.196	S(O)CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃		
40 1.197	S(O)CF ₃	H	H	CH ₃	192	0,87
1.198	S(O)CF ₃	CH ₃	H	CH ₃		
45 1.199	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	CH ₃		
1.200	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CH ₃		
50 1.201	S(O)CF ₃	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃		
1.202	S(O)CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	CH ₃		
55 1.203	S(O)CF ₃	ciclohexilo	H	CH ₃		
1.204	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃		
60 1.205	S(O)CF ₃	2-tetrahidrofurfurilo	H	CH ₃		
1.206	S(O)CF ₃	2-furfurilo	H	CH ₃		
65 1.207	S(O)CF ₃	CH ₂ CN	H	CH ₃		
1.208	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ CN	H	CH ₃		
1.209	S(O)CF ₃	CH ₂ -ciclopropilo	H	CH ₃		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
1.210	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃		
1.211	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	H	CH ₃		
1.212	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃		
1.213	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃		
1.214	S(O)CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	CH ₃		
1.215	S(O)CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃		
1.216	S(O)CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	H	CH ₃		
1.217	S(O)CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	H	CH ₃		
1.218	S(O)CF ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	H	CH ₃		
1.219	S(O)CF ₃	CH ₂ -3-piridilo	H	CH ₃		
1.220	S(O)CF ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	H	CH ₃		
1.221	S(O)CF ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	H	CH ₃		
1.222	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	H	CH ₃		
1.223	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	H	CH ₃		
1.224	S(O)CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	H	CH ₃		
1.225	S(O)CF ₃	ciclopropilo	CH ₃	CH ₃		
1.226	S(O)CF ₃	CH ₂ CH=CH	CH ₃	CH ₃		
1.227	S(O)CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃		
1.228	S(O)CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	139	0,86
1.229	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.230	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.231	S(O)CF ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
1.232	S(O)CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.233	S(O)CF ₃	ciclohexilo	CH ₃	CH ₃		
1.234	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.235	S(O)CF ₃	2-tetrahidrofurfurilo	CH ₃	CH ₃		
1.236	S(O)CF ₃	2-furfurilo	CH ₃	CH ₃		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.237	S(O)CF ₃	CH ₂ CN	CH ₃	CH ₃		
1.238	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ CN	CH ₃	CH ₃		
10 1.239	S(O)CF ₃	CH ₂ -ciclopropilo	CH ₃	CH ₃		
1.240	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
15 1.241	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
1.242	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃		
20 1.243	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.244	S(O)CF ₃	CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃		
25 1.245	S(O)CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃		
1.246	S(O)CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
30 1.247	S(O)CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.248	S(O)CF ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃		
35 1.249	S(O)CF ₃	CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	CH ₃		
1.250	S(O)CF ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	CH ₃	CH ₃		
40 1.251	S(O)CF ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	CH ₃	CH ₃		
1.252	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃		
45 1.253	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	CH ₃		
1.254	S(O)CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	CH ₃	CH ₃		
50 1.255	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	164	0,91
1.256	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃		
55 1.257	S(O)CF ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -		H		
1.258	S(O)CF ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -		H		
60 1.259	S(O)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		H		
1.260	S(O)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		H		
65 1.261	S(O)CF ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -		CH ₃		
1.262	S(O)CF ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -		CH ₃		
1.263	S(O)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CH ₃		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.264	S(O)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		CH ₃		
1.265	S(O) ₂ CF ₃	ciclopropilo	H	H		
10 1.266	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH=CH	H	H		
1.267	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H	H		
15 1.268	S(O) ₂ CF ₃	H	H	H	217	0,90
1.269	S(O) ₂ CF ₃	CH ₃	H	H		
20 1.270	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	H		
1.271	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H		
25 1.272	S(O) ₂ CF ₃	CH(CH ₃) ₂	H	H		
1.273	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	H		
30 1.274	S(O) ₂ CF ₃	ciclohexilo	H	H		
1.275	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H		
35 1.276	S(O) ₂ CF ₃	2-tetrahidrofurfurilo	H	H		
1.277	S(O) ₂ CF ₃	2-furfurilo	H	H		
40 1.278	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CN	H	H		
1.279	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ CN	H	H		
45 1.280	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ -ciclopropilo	H	H		
1.281	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H		
1.282	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	H	H		
50 1.283	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H		
1.284	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H		
55 1.285	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	H		
1.286	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	H		
60 1.287	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	H	H		
1.288	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	H	H		
65 1.289	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	H	H		
1.290	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ -3-piridilo	H	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
1.291	S(O) ₂ CF ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	H	H		
1.292	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	H	H		
1.293	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	H	H		
1.294	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	H	H		
1.295	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	H	H		
1.296	S(O) ₂ CF ₃	ciclopropilo	CH ₃	H		
1.297	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH=CH	CH ₃	H		
1.298	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H		
1.299	S(O) ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	H		
1.300	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
1.301	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
1.302	S(O) ₂ CF ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H		
1.303	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	H		
1.304	S(O) ₂ CF ₃	ciclohexilo	CH ₃	H		
1.305	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H		
1.306	S(O) ₂ CF ₃	2-tetrahidrofurfurilo	CH ₃	H		
1.307	S(O) ₂ CF ₃	2-furfurilo	CH ₃	H		
1.308	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CN	CH ₃	H		
1.309	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ CN	CH ₃	H		
1.310	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ -ciclopropilo	CH ₃	H		
1.311	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H		
1.312	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	CH ₃	H		
1.313	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H		
1.314	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	H		
1.315	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	CH ₃	H		
1.316	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H		
1.317	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	CH ₃	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
1.318	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	CH ₃	H		
1.319	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H		
1.320	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	H		
1.321	S(O) ₂ CF ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	CH ₃	H		
1.322	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	CH ₃	H		
1.323	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H		
1.324	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	H		
1.325	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	CH ₃	H		
1.326	S(O) ₂ CF ₃	ciclopropilo	H	CH ₃		
1.327	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH=CH	H	CH ₃		
1.328	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃		
1.329	S(O) ₂ CF ₃	H	H	CH ₃	219	0,90
1.330	S(O) ₂ CF ₃	CH ₃	H	CH ₃		
1.331	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	CH ₃		
1.332	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CH ₃		
1.333	S(O) ₂ CF ₃	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃		
1.334	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	CH ₃		
1.335	S(O) ₂ CF ₃	ciclohexilo	H	CH ₃		
1.336	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃		
1.337	S(O) ₂ CF ₃	2-tetrahidrofurfurilo	H	CH ₃		
1.338	S(O) ₂ CF ₃	2-furfurilo	H	CH ₃		
1.339	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CN	H	CH ₃		
1.340	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ CN	H	CH ₃		
1.341	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ -ciclopropilo	H	CH ₃		
1.342	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃		
1.343	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	H	CH ₃		
1.344	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
1.345	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃		
1.346	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	CH ₃		
1.347	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃		
1.348	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	H	CH ₃		
1.349	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	H	CH ₃		
1.350	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	H	CH ₃		
1.351	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ -3-piridilo	H	CH ₃		
1.352	S(O) ₂ CF ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	H	CH ₃		
1.353	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	H	CH ₃		
1.354	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	H	CH ₃		
1.355	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	H	CH ₃		
1.356	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	H	CH ₃		
1.357	S(O) ₂ CF ₃	ciclopropilo	CH ₃	CH ₃		
1.358	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH=CH	CH ₃	CH ₃		
1.359	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃		
1.360	S(O) ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.361	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.362	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.363	S(O) ₂ CF ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
1.364	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.365	S(O) ₂ CF ₃	ciclohexilo	CH ₃	CH ₃		
1.366	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.367	S(O) ₂ CF ₃	2-tetrahidrofurfurilo	CH ₃	CH ₃		
1.368	S(O) ₂ CF ₃	2-furfurilo	CH ₃	CH ₃		
1.369	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CN	CH ₃	CH ₃		
1.370	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ CN	CH ₃	CH ₃		
1.371	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ -ciclopropilo	CH ₃	CH ₃		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
1.372	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
1.373	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
1.374	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.375	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.376	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃		
1.377	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃		
1.378	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.379	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.380	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃		
1.381	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	CH ₃		
1.382	S(O) ₂ CF ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	CH ₃	CH ₃		
1.383	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	CH ₃	CH ₃		
1.384	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃		
1.385	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	CH ₃		
1.386	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	CH ₃	CH ₃		
1.387	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H		
1.388	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃		
1.389	S(O) ₂ CF ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -		H		
1.390	S(O) ₂ CF ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -		H		
1.391	S(O) ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		H		
1.392	S(O) ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		H		
1.393	S(O) ₂ CF ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -		CH ₃		
1.394	S(O) ₂ CF ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -		CH ₃		
1.395	S(O) ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CH ₃		
1.396	S(O) ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		CH ₃		
1.397	H	ciclopropilo	H	H		
1.398	H	CH ₂ CH=CH	H	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.399	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	aceite	0,84
1.400	H	H	H	H	espuma	0,81
10 1.401	H	CH ₃	H	H		
1.402	H	CH ₂ CH ₃	H	H		
15 1.403	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H		
1.404	H	CH(CH ₃) ₂	H	H		
20 1.405	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	H		
1.406	H	ciclohexilo	H	H		
25 1.407	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H		
1.408	H	2-tetrahidrofurfurilo	H	H		
30 1.409	H	2-furfurilo	H	H		
1.410	H	CH ₂ CN	H	H		
35 1.411	H	CH ₂ CH ₂ CN	H	H		
1.412	H	CH ₂ -ciclopropilo	H	H		
40 1.413	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H		
1.414	H	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	H	H		
45 1.415	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H		
1.416	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H		
50 1.417	H	CH ₂ CF ₃	H	H		
1.418	H	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	H		
55 1.419	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	H	H		
1.420	H	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	H	H		
60 1.421	H	CH ₂ C ₆ H ₅	H	H		
1.422	H	CH ₂ -3-piridilo	H	H		
65 1.423	H	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	H	H		
1.424	H	CH ₂ -tiofen-2-ilo	H	H		
1.425	H	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	H	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.426	H	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	H	H		
1.427	H	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	H	H		
10 1.428	H	ciclopropilo	CH ₃	H		
1.429	H	CH ₂ CH=CH	CH ₃	H		
15 1.430	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H		
1.431	H	CH ₃	CH ₃	H		
20 1.432	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
1.433	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
25 1.434	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H		
1.435	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	H		
30 1.436	H	ciclohexilo	CH ₃	H		
1.437	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H		
35 1.438	H	2-tetrahidrofurfurilo	CH ₃	H		
1.439	H	2-furfurilo	CH ₃	H		
40 1.440	H	CH ₂ CN	CH ₃	H		
1.441	H	CH ₂ CH ₂ CN	CH ₃	H		
45 1.442	H	CH ₂ -ciclopropilo	CH ₃	H		
1.443	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H		
50 1.444	H	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	CH ₃	H		
1.445	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H		
55 1.446	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	H		
1.447	H	CH ₂ CF ₃	CH ₃	H		
60 1.448	H	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H		
1.449	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	CH ₃	H		
65 1.450	H	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	CH ₃	H		
1.451	H	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H		
1.452	H	CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
1.453	H	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	CH ₃	H		
1.454	H	CH ₂ -tiofen-2-ilo	CH ₃	H		
1.455	H	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H		
1.456	H	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	H		
1.457	H	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	CH ₃	H		
1.458	H	ciclopropilo	H	CH ₃		
1.459	H	CH ₂ CH=CH	H	CH ₃		
1.460	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃		
1.461	H	H	H	CH ₃	80	0,68
1.462	H	CH ₃	H	CH ₃		
1.463	H	CH ₂ CH ₃	H	CH ₃		
1.464	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CH ₃		
1.465	H	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃		
1.466	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	CH ₃		
1.467	H	ciclohexilo	H	CH ₃		
1.468	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃		
1.469	H	2-tetrahidrofurfurilo	H	CH ₃		
1.470	H	2-furfurilo	H	CH ₃		
1.471	H	CH ₂ CN	H	CH ₃		
1.472	H	CH ₂ CH ₂ CN	H	CH ₃		
1.473	H	CH ₂ -ciclopropilo	H	CH ₃		
1.474	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃		
1.475	H	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	H	CH ₃		
1.476	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃		
1.477	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃		
1.478	H	CH ₂ CF ₃	H	CH ₃		
1.479	H	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.480	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	H	CH ₃		
1.481	H	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	H	CH ₃		
10 1.482	H	CH ₂ C ₆ H ₅	H	CH ₃	,	
1.483	H	CH ₂ -3-piridilo	H	CH ₃		
15 1.484	H	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	H	CH ₃		
1.485	H	CH ₂ -tiofen-2-ilo	H	CH ₃		
20 1.486	H	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	H	CH ₃		
1.487	H	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	H	CH ₃		
25 1.488	H	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	H	CH ₃		
1.489	H	ciclopropilo	CH ₃	CH ₃		
30 1.490	H	CH ₂ CH=CH	CH ₃	CH ₃		
1.491	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃		
35 1.492	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.493	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
40 1.494	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.495	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
45 1.496	H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.497	H	ciclohexilo	CH ₃	CH ₃		
50 1.498	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.499	H	2-tetrahidrofurfurilo	CH ₃	CH ₃		
55 1.500	H	2-furfurilo	CH ₃	CH ₃		
1.501	H	CH ₂ CN	CH ₃	CH ₃		
60 1.502	H	CH ₂ CH ₂ CN	CH ₃	CH ₃		
1.503	H	CH ₂ -ciclopropilo	CH ₃	CH ₃		
65 1.504	H	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
1.505	H	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
1.506	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.507	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.508	H	CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃		
10 1.509	H	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃		
1.510	H	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.511	H	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃		
15 1.512	H	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃		
1.513	H	CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	CH ₃		
20 1.514	H	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	CH ₃	CH ₃		
1.515	H	CH ₂ -tiofen-2-ilo	CH ₃	CH ₃		
25 1.516	H	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃		
1.517	H	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	CH ₃		
30 1.518	H	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	CH ₃	CH ₃		
1.519	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H		
35 1.520	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃		
1.521	H	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -		H		
40 1.522	H	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -		H		
1.523	H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		H		
45 1.524	H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		H		
1.525	H	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -		CH ₃		
50 1.526	H	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -		CH ₃		
1.527	H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CH ₃		
55 1.528	H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		CH ₃		
1.529	SCH ₂ CH ₃	ciclopropilo	H	H		
60 1.530	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH	H	H		
1.531	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H	H		
65 1.532	SCH ₂ CH ₃	H	H	H	189	0,81
1.533	SCH ₂ CH ₃	CH ₃	H	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.534	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H		
1.535	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H		
10 1.536	SCH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	H		
1.537	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	H		
15 1.538	SCH ₂ CH ₃	ciclohexilo	H	H		
1.539	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H		
20 1.540	SCH ₂ CH ₃	2-tetrahidrofurfurilo	H	H		
1.541	SCH ₂ CH ₃	2-furfurilo	H	H		
25 1.542	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CN	H	H		
1.543	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN	H	H		
30 1.544	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ -ciclopropilo	H	H		
1.545	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H		
35 1.546	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	H	H		
1.547	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H		
40 1.548	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H		
1.549	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CF ₃	H	H		
45 1.550	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	H		
1.551	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	H	H		
50 1.552	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	H	H		
1.553	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	H	H		
55 1.554	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ -3-piridilo	H	H		
1.555	SCH ₂ CH ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	H	H		
60 1.556	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	H	H		
1.557	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	H	H		
65 1.558	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	H	H		
1.559	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	H	H		
1.560	SCH ₂ CH ₃	ciclopropilo	CH ₃	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.561	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH	CH ₃	H		
1.562	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H		
10 1.563	SCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		
1.564	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
15 1.565	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
1.566	SCH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H		
20 1.567	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	H		
1.568	SCH ₂ CH ₃	ciclohexilo	CH ₃	H		
25 1.569	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H		
1.570	SCH ₂ CH ₃	2-tetrahidrofurfurilo	CH ₃	H		
30 1.571	SCH ₂ CH ₃	2-furfurilo	CH ₃	H		
1.572	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃	H		
35 1.573	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN	CH ₃	H		
1.574	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ -ciclopropilo	CH ₃	H		
40 1.575	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H		
1.576	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	CH ₃	H		
45 1.577	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H		
1.578	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	H		
50 1.579	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CF ₃	CH ₃	H		
1.580	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H		
55 1.581	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	CH ₃	H		
1.582	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	CH ₃	H		
60 1.583	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H		
1.584	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	H		
65 1.585	SCH ₂ CH ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	CH ₃	H		
1.586	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	CH ₃	H		
1.587	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.588	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	H		
1.589	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	CH ₃	H		
10 1.590	SCH ₂ CH ₃	ciclopropilo	H	CH ₃		
1.591	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH	H	CH ₃		
15 1.592	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃		
1.593	SCH ₂ CH ₃	H	H	CH ₃		
20 1.594	SCH ₂ CH ₃	CH ₃	H	CH ₃		
1.595	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	CH ₃		
25 1.596	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CH ₃		
1.597	SCH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃		
30 1.598	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	CH ₃		
1.599	SCH ₂ CH ₃	ciclohexilo	H	CH ₃		
35 1.600	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃		
1.601	SCH ₂ CH ₃	2-tetrahidrofurfurilo	H	CH ₃		
40 1.602	SCH ₂ CH ₃	2-furfurilo	H	CH ₃		
1.603	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CN	H	CH ₃		
45 1.604	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN	H	CH ₃		
1.605	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ -ciclopropilo	H	CH ₃		
50 1.606	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃		
1.607	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	H	CH ₃		
55 1.608	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃		
1.609	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃		
60 1.610	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CF ₃	H	CH ₃		
1.611	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃		
65 1.612	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	H	CH ₃		
1.613	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	H	CH ₃		
1.614	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	H	CH ₃		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.615	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ -3-piridilo	H	CH ₃		
1.616	SCH ₂ CH ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	H	CH ₃		
10 1.617	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	H	CH ₃		
1.618	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	H	CH ₃		
15 1.619	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	H	CH ₃		
1.620	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	H	CH ₃		
20 1.621	SCH ₂ CH ₃	ciclopropilo	CH ₃	CH ₃		
1.622	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH	CH ₃	CH ₃		
25 1.623	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃		
1.624	SCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃		
30 1.625	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.626	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
35 1.627	SCH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
1.628	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
40 1.629	SCH ₂ CH ₃	ciclohexilo	CH ₃	CH ₃		
1.630	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃		
45 1.631	SCH ₂ CH ₃	2-tetrahidrofurfurilo	CH ₃	CH ₃		
1.632	SCH ₂ CH ₃	2-furfurilo	CH ₃	CH ₃		
50 1.633	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃	CH ₃		
1.634	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN	CH ₃	CH ₃		
55 1.635	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ -ciclopropilo	CH ₃	CH ₃		
1.636	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
60 1.637	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
1.638	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃		
65 1.639	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.640	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃		
1.641	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.642	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.643	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃		
10 1.644	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃		
1.645	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	CH ₃		
15 1.646	SCH ₂ CH ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	CH ₃	CH ₃		
1.647	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	CH ₃	CH ₃		
20 1.648	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃		
1.649	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	CH ₃		
25 1.650	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	CH ₃	CH ₃		
1.651	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H		
30 1.652	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃		
1.653	SCH ₂ CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -		H		
35 1.654	SCH ₂ CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -		H		
1.655	SCH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		H		
40 1.656	SCH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		H		
1.657	SCH ₂ CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -		CH ₃		
45 1.658	SCH ₂ CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -		CH ₃		
1.659	SCH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CH ₃		
50 1.660	SCH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		CH ₃		
1.661	S(O)CH ₂ CH ₃	ciclopropilo	H	H		
55 1.662	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH	H	H		
1.663	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H	H		
60 1.664	S(O)CH ₂ CH ₃	H	H	H	176	0,52
1.665	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	H		
65 1.666	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H		
1.667	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H		
1.668	S(O)CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.669	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	H		
1.670	S(O)CH ₂ CH ₃	ciclohexilo	H	H		
10 1.671	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H		
1.672	S(O)CH ₂ CH ₃	2-tetrahidrofurfurilo	H	H		
15 1.673	S(O)CH ₂ CH ₃	2-furfurilo	H	H		
1.674	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CN	H	H		
1.675	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN	H	H		
20 1.676	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ -ciclopropilo	H	H		
1.677	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H		
25 1.678	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	H	H		
1.679	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H		
30 1.680	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H		
1.681	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CF ₃	H	H		
35 1.682	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	H		
1.683	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	H	H		
40 1.684	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	H	H		
1.685	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	H	H		
45 1.686	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ -3-piridilo	H	H		
1.687	S(O)CH ₂ CH ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	H	H		
50 1.688	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	H	H		
1.689	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	H	H		
55 1.690	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	H	H		
1.691	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	H	H		
60 1.692	S(O)CH ₂ CH ₃	ciclopropilo	CH ₃	H		
1.693	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH	CH ₃	H		
1.694	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H		
65 1.695	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.696	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
1.697	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
10 1.698	S(O)CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H		
1.699	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	H		
15 1.700	S(O)CH ₂ CH ₃	ciclohexilo	CH ₃	H		
1.701	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H		
20 1.702	S(O)CH ₂ CH ₃	2-tetrahidrofurfurilo	CH ₃	H		
1.703	S(O)CH ₂ CH ₃	2-furfurilo	CH ₃	H		
25 1.704	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃	H		
1.705	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN	CH ₃	H		
30 1.706	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ -ciclopropilo	CH ₃	H		
1.707	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H		
35 1.708	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	CH ₃	H		
1.709	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H		
40 1.710	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	H		
1.711	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CF ₃	CH ₃	H		
45 1.712	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H		
1.713	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	CH ₃	H		
50 1.714	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	CH ₃	H		
1.715	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H		
55 1.716	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	H		
1.717	S(O)CH ₂ CH ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	CH ₃	H		
60 1.718	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	CH ₃	H		
1.719	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H		
65 1.720	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	H		
1.721	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	CH ₃	H		
1.722	S(O)CH ₂ CH ₃	ciclopropilo	H	CH ₃		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.723	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH	H	CH ₃		
1.724	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃		
10 1.725	S(O)CH ₂ CH ₃	H	H	CH ₃		
1.726	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	CH ₃		
15 1.727	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	CH ₃		
1.728	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CH ₃		
20 1.729	S(O)CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃		
1.730	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	CH ₃		
25 1.731	S(O)CH ₂ CH ₃	ciclohexilo	H	CH ₃		
1.732	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃		
30 1.733	S(O)CH ₂ CH ₃	2-tetrahidrofurfurilo	H	CH ₃		
1.734	S(O)CH ₂ CH ₃	2-furfurilo	H	CH ₃		
35 1.735	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CN	H	CH ₃		
1.736	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN	H	CH ₃		
40 1.737	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ -ciclopropilo	H	CH ₃		
1.738	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃		
45 1.739	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	H	CH ₃		
1.740	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃		
50 1.741	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃		
1.742	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CF ₃	H	CH ₃		
55 1.743	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃		
1.744	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	H	CH ₃		
60 1.745	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	H	CH ₃		
1.746	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	H	CH ₃		
65 1.747	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ -3-piridilo	H	CH ₃		
1.748	S(O)CH ₂ CH ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	H	CH ₃		
1.749	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	H	CH ₃		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.750	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	H	CH ₃		
1.751	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	H	CH ₃		
10 1.752	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	H	CH ₃		
1.753	S(O)CH ₂ CH ₃	ciclopropilo	CH ₃	CH ₃		
15 1.754	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH	CH ₃	CH ₃		
1.755	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃		
20 1.756	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.757	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
25 1.758	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.759	S(O)CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
30 1.760	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.761	S(O)CH ₂ CH ₃	ciclohexilo	CH ₃	CH ₃		
35 1.762	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.763	S(O)CH ₂ CH ₃	2-tetrahidrofurfurilo	CH ₃	CH ₃		
40 1.764	S(O)CH ₂ CH ₃	2-furfurilo	CH ₃	CH ₃		
1.765	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃	CH ₃		
45 1.766	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN	CH ₃	CH ₃		
1.767	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ -ciclopropilo	CH ₃	CH ₃		
50 1.768	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
1.769	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
55 1.770	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.771	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃		
60 1.772	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃		
1.773	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃		
65 1.774	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.775	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.776	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.777	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	CH ₃		
1.778	S(O)CH ₂ CH ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	CH ₃	CH ₃		
10 1.779	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	CH ₃	CH ₃		
1.780	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃		
1.781	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	CH ₃		
15 1.782	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	CH ₃	CH ₃		
1.783	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H		
20 1.784	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃		
1.785	S(O)CH ₂ CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -		H		
25 1.786	S(O)CH ₂ CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -		H		
1.787	S(O)CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		H		
30 1.788	S(O)CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		H		
1.789	S(O)CH ₂ CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -		CH ₃		
35 1.790	S(O)CH ₂ CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -		CH ₃		
1.791	S(O)CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CH ₃		
40 1.792	S(O)CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		CH ₃		
1.793	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	ciclopropilo	H	H		
45 1.794	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH	H	H		
1.795	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H	H		
50 1.796	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	224	0,75
1.797	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	H		
55 1.798	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H		
1.799	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H		
60 1.800	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	H		
1.801	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	H		
65 1.802	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	ciclohexilo	H	H		
1.803	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.804	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	2-tetrahidrofurfurilo	H	H		
1.805	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	2-furfurilo	H	H		
10 1.806	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CN	H	H		
1.807	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN	H	H		
15 1.808	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ -ciclopropilo	H	H		
1.809	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H		
20 1.810	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	H	H		
1.811	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H		
25 1.812	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H		
1.813	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CF ₃	H	H		
30 1.814	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	H		
1.815	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	H	H		
35 1.816	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	H	H		
1.817	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	H	H		
40 1.818	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ -3-piridilo	H	H		
1.819	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	H	H		
45 1.820	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	H	H		
1.821	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	H	H		
50 1.822	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	H	H		
1.823	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	H	H		
55 1.824	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	ciclopropilo	CH ₃	H		
1.825	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH	CH ₃	H		
60 1.826	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H		
1.827	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		
65 1.828	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
1.829	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
1.830	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.831	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	H		
1.832	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	ciclohexilo	CH ₃	H		
10 1.833	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H		
1.834	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	2-tetrahidrofurfurilo	CH ₃	H		
15 1.835	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	2-furfurilo	CH ₃	H		
1.836	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃	H		
20 1.837	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN	CH ₃	H		
1.838	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ -ciclopropilo	CH ₃	H		
25 1.839	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H		
1.840	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	CH ₃	H		
30 1.841	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H		
1.842	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	H		
35 1.843	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CF ₃	CH ₃	H		
1.844	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H		
40 1.845	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	CH ₃	H		
1.846	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	CH ₃	H		
45 1.847	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H		
1.848	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	H		
50 1.849	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	CH ₃	H		
1.850	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	CH ₃	H		
55 1.851	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H		
1.852	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	H		
60 1.853	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	CH ₃	H		
1.854	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	ciclopropilo	H	CH ₃		
65 1.855	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH	H	CH ₃		
1.856	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃		
1.857	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	CH ₃		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.858	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	CH ₃		
1.859	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	CH ₃		
10 1.860	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CH ₃		
1.861	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃		
15 1.862	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	CH ₃		
1.863	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	ciclohexilo	H	CH ₃		
20 1.864	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃		
1.865	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	2-tetrahidrofurfurilo	H	CH ₃		
25 1.866	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	2-furfurilo	H	CH ₃		
1.867	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CN	H	CH ₃		
30 1.868	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN	H	CH ₃		
1.869	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ -ciclopropilo	H	CH ₃		
35 1.870	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃		
1.871	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	H	CH ₃		
40 1.872	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃		
1.873	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃		
45 1.874	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CF ₃	H	CH ₃		
1.875	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	CH ₃		
50 1.876	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	H	CH ₃		
1.877	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	H	CH ₃		
55 1.878	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	H	CH ₃		
1.879	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ -3-piridilo	H	CH ₃		
60 1.880	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	H	CH ₃		
1.881	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	H	CH ₃		
65 1.882	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	H	CH ₃		
1.883	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	H	CH ₃		
1.884	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	H	CH ₃		

ES 2 329 906 T3

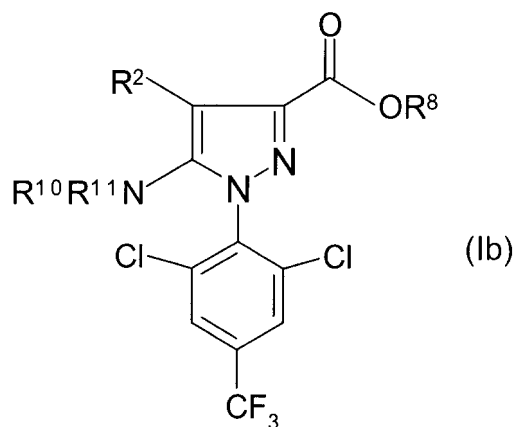
Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
5 1.885	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	ciclopropilo	CH ₃	CH ₃		
1.886	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH	CH ₃	CH ₃		
10 1.887	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃		
1.888	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.889	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
15 1.890	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.891	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
20 1.892	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.893	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	ciclohexilo	CH ₃	CH ₃		
25 1.894	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.895	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	2-tetrahidrofurfurilo	CH ₃	CH ₃		
30 1.896	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	2-furfurilo	CH ₃	CH ₃		
1.897	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃	CH ₃		
35 1.898	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN	CH ₃	CH ₃		
1.899	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ -ciclopropilo	CH ₃	CH ₃		
40 1.900	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
1.901	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
45 1.902	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.903	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃		
50 1.904	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃		
1.905	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃		
55 1.906	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
1.907	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃		
60 1.908	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃		
1.909	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	CH ₃		
65 1.910	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	CH ₃	CH ₃		
1.911	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ -tiofen-2-ilo	CH ₃	CH ₃		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	p.f. (°C)	RF
1.912	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃		
1.913	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	CH ₃	CH ₃		
1.914	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N-imidazolilo	CH ₃	CH ₃		
1.915	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H		
1.916	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃		
1.917	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -		H		
1.918	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -		H		
1.919	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		H		
1.920	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		H		
1.921	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -		CH ₃		
1.922	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -		CH ₃		
1.923	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CH ₃		
1.924	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		CH ₃		

TABLA 2

Compuestos de la fórmula (Ib)



ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁸	R ¹⁰	R ¹¹	p.f. (°C)	RF
2.1	H	H	H	H	213	0,03
2.2	H	H	CH ₃	H		
2.3	H	H	CH ₃	CH ₃		
2.4	H	CH ₃	H	H		
2.5	H	CH ₃	CH ₃	H		
2.6	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.7	H	CH ₂ CH ₃	H	H		
2.8	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
2.9	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.10	SCF ₃	H	H	H	199	0,59
2.11	SCF ₃	H	CH ₃	H	150	0,28
2.12	SCF ₃	H	CH ₃	CH ₃		
2.13	SCF ₃	CH ₃	H	H		
2.14	SCF ₃	CH ₃	CH ₃	H		
2.15	SCF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.16	SCF ₃	CH ₂ CH ₃	H	H		
2.17	SCF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
2.18	SCF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.19	S(O)CF ₃	H	H	H		
2.20	S(O)CF ₃	H	CH ₃	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁸	R ¹⁰	R ¹¹	p.f. (°C)	RF
2.21	S(O)CF ₃	H	CH ₃	CH ₃		
2.22	S(O)CF ₃	CH ₃	H	H		
2.23	S(O)CF ₃	CH ₃	CH ₃	H		
2.24	S(O)CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.25	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	H		
2.26	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
2.27	S(O)CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.28	S(O) ₂ CF ₃	H	H	H		
2.29	S(O) ₂ CF ₃	H	CH ₃	H		
2.30	S(O) ₂ CF ₃	H	CH ₃	CH ₃		
2.31	S(O) ₂ CF ₃	CH ₃	H	H		
2.32	S(O) ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	H		
2.33	S(O) ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.34	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	H		
2.35	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
2.36	S(O) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.37	SCH ₂ CH ₃	H	H	H		
2.38	SCH ₂ CH ₃	H	CH ₃	H		
2.39	SCH ₂ CH ₃	H	CH ₃	CH ₃		
2.40	SCH ₂ CH ₃	CH ₃	H	H		
2.41	SCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		
2.42	SCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.43	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H		
2.44	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
2.45	SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.46	S(O)CH ₂ CH ₃	H	H	H		
2.47	S(O)CH ₂ CH ₃	H	CH ₃	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁸	R ¹⁰	R ¹¹	p.f. (°C)	RF
2.48	S(O)CH ₂ CH ₃	H	CH ₃	CH ₃		
2.49	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	H		
2.50	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		
2.51	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.52	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H		
2.53	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
2.54	S(O)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.55	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H		
2.56	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	H	CH ₃	H		
2.57	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	H	CH ₃	CH ₃		
2.58	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	H		
2.59	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		
2.60	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.61	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H		
2.62	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
2.63	S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.64	SCH ₃	H	H	H		
2.65	SCH ₃	H	CH ₃	H		
2.66	SCH ₃	H	CH ₃	CH ₃		
2.67	SCH ₃	CH ₃	H	H		
2.68	SCH ₃	CH ₃	CH ₃	H		
2.69	SCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.70	SCH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H		
2.71	SCH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
2.72	SCH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.73	S(O)CH ₃	H	H	H		
2.74	S(O)CH ₃	H	CH ₃	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁸	R ¹⁰	R ¹¹	p.f. (°C)	RF
2.75	S(O)CH ₃	H	CH ₃	CH ₃		
2.76	S(O)CH ₃	CH ₃	H	H		
2.77	S(O)CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		
2.78	S(O)CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.79	S(O)CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H		
2.80	S(O)CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
2.81	S(O)CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.82	S(O) ₂ CH ₃	H	H	H		
2.83	S(O) ₂ CH ₃	H	CH ₃	H		
2.84	S(O) ₂ CH ₃	H	CH ₃	CH ₃		
2.85	S(O) ₂ CH ₃	CH ₃	H	H		
2.86	S(O) ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		
2.87	S(O) ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.89	S(O) ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H		
2.90	S(O) ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
2.91	S(O) ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.92	SCCIF ₂	H	H	H		
2.93	SCCIF ₂	H	CH ₃	H		
2.94	SCCIF ₂	H	CH ₃	CH ₃		
2.95	SCCIF ₂	CH ₃	H	H		
2.96	SCCIF ₂	CH ₃	CH ₃	H		
2.97	SCCIF ₂	CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.98	SCCIF ₂	CH ₂ CH ₃	H	H		
2.99	SCCIF ₂	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
2.100	SCCIF ₂	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.101	S(O)CCIF ₂	H	H	H		
2.102	S(O)CCIF ₂	H	CH ₃	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁸	R ¹⁰	R ¹¹	p.f. (°C)	RF
2.103	S(O)CCIF ₂	H	CH ₃	CH ₃		
2.104	S(O)CCIF ₂	CH ₃	H	H		
2.105	S(O)CCIF ₂	CH ₃	CH ₃	H		
2.106	S(O)CCIF ₂	CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.107	S(O)CCIF ₂	CH ₂ CH ₃	H	H		
2.108	S(O)CCIF ₂	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
2.109	S(O)CCIF ₂	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.110	S(O) ₂ CCIF ₂	H	H	H		
2.111	S(O) ₂ CCIF ₂	H	CH ₃	H		
2.112	S(O) ₂ CCIF ₂	H	CH ₃	CH ₃		
2.113	S(O) ₂ CCIF ₂	CH ₃	H	H		
2.114	S(O) ₂ CCIF ₂	CH ₃	CH ₃	H		
2.115	S(O) ₂ CCIF ₂	CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.116	S(O) ₂ CCIF ₂	CH ₂ CH ₃	H	H		
2.117	S(O) ₂ CCIF ₂	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
2.118	S(O) ₂ CCIF ₂	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.119	SCCl ₂ F	H	H	H		
2.120	SCCl ₂ F	H	CH ₃	H		
2.121	SCCl ₂ F	H	CH ₃	CH ₃		
2.122	SCCl ₂ F	CH ₃	H	H		
2.123	SCCl ₂ F	CH ₃	CH ₃	H		
2.124	SCCl ₂ F	CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.125	SCCl ₂ F	CH ₂ CH ₃	H	H		
2.126	SCCl ₂ F	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
2.127	SCCl ₂ F	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.128	S(O)CCl ₂ F	H	H	H		
2.129	S(O)CCl ₂ F	H	CH ₃	H		

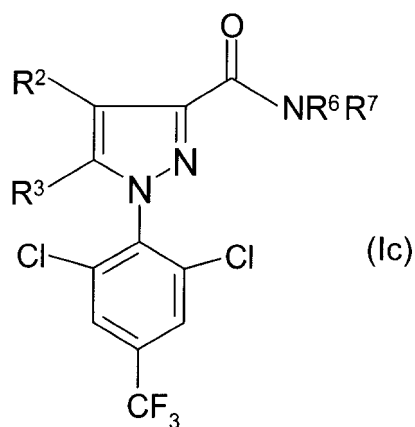
ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ⁸	R ¹⁰	R ¹¹	p.f. (°C)	RF
2.130	S(O)CCl ₂ F	H	CH ₃	CH ₃		
2.131	S(O)CCl ₂ F	CH ₃	H	H		
2.132	S(O)CCl ₂ F	CH ₃	CH ₃	H		
2.133	S(O)CCl ₂ F	CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.134	S(O)CCl ₂ F	CH ₂ CH ₃	H	H		
2.135	S(O)CCl ₂ F	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
2.136	S(O)CCl ₂ F	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.137	S(O) ₂ CCl ₂ F	H	H	H		
2.138	S(O) ₂ CCl ₂ F	H	CH ₃	H		
2.139	S(O) ₂ CCl ₂ F	H	CH ₃	CH ₃		
2.140	S(O) ₂ CCl ₂ F	CH ₃	H	H		
2.141	S(O) ₂ CCl ₂ F	CH ₃	CH ₃	H		
2.142	S(O) ₂ CCl ₂ F	CH ₃	CH ₃	CH ₃		
2.143	S(O) ₂ CCl ₂ F	CH ₂ CH ₃	H	H		
2.144	S(O) ₂ CCl ₂ F	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		
2.145	S(O) ₂ CCl ₂ F	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		

ES 2 329 906 T3

TABLA 3

Compuestos de la fórmula (Ic)



25
30
35
40
45
50
55
60
65

Cpd	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	p.f. (°C)	RF
3.1	SCF ₃	Br	H	H		
3.2	SCF ₃	OH	H	H	198	0,05
3.3	SCF ₃	OCH ₂ CH ₃	H	H	161	0,09
3.4	SCF ₃	OCH ₂ CH ₃	SCH(CH ₃) ₂	H	Cera	0,92
3.5	SCF ₃	OCH ₃	H	H		
3.6	SCF ₃	OCH ₂ CH=CH ₂	H	H		
3.7	SCF ₃	N(CH ₃) ₂	H	H		
3.8	SCF ₃	N(CH ₃)COCH ₃	H	H		
3.9	SCF ₃	N(CH ₃)CO ₂ CH ₃	H	H		
3.10	S(O)CF ₃	Br	H	H	179	0,92
3.11	S(O)CF ₃	OH	H	H		
3.12	S(O)CF ₃	OCH ₂ CH ₃	H	H		
3.13	S(O)CF ₃	OCH ₂ CH ₃	SCH(CH ₃) ₂	H		
3.14	S(O)CF ₃	OCH ₃	H	H		
3.15	S(O)CF ₃	OCH ₂ CH=CH ₂	H	H		
3.16	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	H	H		
3.17	S(O)CF ₃	N(CH ₃)COCH ₃	H	H		
3.18	S(O)CF ₃	N(CH ₃)CO ₂ CH ₃	H	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	p.f. (°C)	RF
5 3.19	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	ciclopropilo	H		
3.20	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH	H		
10 3.21	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	H		
3.22	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₃	H		
15 3.23	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	H		
3.24	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H		
20 3.25	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H		
3.26	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H		
25 3.27	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	ciclohexilo	H		
3.28	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H		
30 3.29	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	2-tetrahidrofurfurilo	H		
3.30	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	2-furfurilo	H		
35 3.31	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CN	H		
3.32	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CN	H		
40 3.33	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ -ciclopropilo	H		
3.34	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		
45 3.35	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	H		
3.36	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H		
50 3.37	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H		
3.38	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CF ₃	H		
55 3.39	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H		
3.40	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	H		
60 3.41	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	H		
3.42	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ C ₆ H ₅	H		
65 3.43	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ -3-piridilo	H		
3.44	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	H		
3.45	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ -tiofen-2-ilo	H		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	p.f. (°C)	RF
5 3.46	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	H		
3.47	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	H		
10 3.48	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N- imidazolilo	H		
15 3.49	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	ciclopropilo	CH ₃		
3.50	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH	CH ₃		
20 3.51	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃		
3.52	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃		
25 3.53	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	CH ₃		
3.54	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃		
3.55	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₃		
30 3.56	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃		
3.57	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	ciclohexilo	CH ₃		
35 3.58	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃		
3.59	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	2-tetrahidrofurfurilo	CH ₃		
40 3.60	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	2-furfurilo	CH ₃		
3.61	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CN	CH ₃		
45 3.62	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CN	CH ₃		
3.63	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ -ciclopropilo	CH ₃		
50 3.64	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃		
3.65	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	CH ₃		
55 3.66	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃		
3.67	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃		
60 3.68	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CF ₃	CH ₃		
3.69	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH=CH ₂	CH ₃		
3.70	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₃	CH ₃		
65 3.71	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ (CH ₂) ₂ SCH ₃	CH ₃		

ES 2 329 906 T3

Cpd	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	p.f. (°C)	RF
3.72	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃		
3.73	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ -3-piridilo	CH ₃		
3.74	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	5-CH ₃ -furfur-2-ilo	CH ₃		
3.75	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ -tiofen-2-ilo	CH ₃		
3.76	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃		
3.77	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₂ -3-piridilo	CH ₃		
3.78	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ (CH ₂) ₂ -N- imidazolilo	CH ₃		
3.79	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃		
3.80	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -			
3.81	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -			
3.82	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -			
3.83	S(O)CF ₃	N(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -			
3.84	S(O) ₂ CF ₃	Br	H	H		
3.85	S(O) ₂ CF ₃	OH	H	H		
3.86	S(O) ₂ CF ₃	OCH ₂ CH ₃	H	H		
3.87	S(O) ₂ CF ₃	OCH ₂ CH ₃	SCH(CH ₃) ₂	H		
3.88	S(O) ₂ CF ₃	OCH ₃	H	H		
3.89	S(O) ₂ CF ₃	OCH ₂ CH=CH ₂	H	H		
3.90	S(O) ₂ CF ₃	N(CH ₃) ₂	H	H		
3.91	S(O) ₂ CF ₃	N(CH ₃)COCH ₃	H	H		
3.92	S(O) ₂ CF ₃	N(CH ₃)CO ₂ CH ₃	H	H		

Otro aspecto del invento es un método para la regulación del crecimiento de plantas cuyas plantas son plantas cultivadas monocotiledóneas o dicotiledóneas, seleccionadas preferiblemente entre el conjunto de plantas cultivadas en el campo económicamente importantes tales como, por ejemplo, trigo, cebada, centeno, tritical, arroz, maíz, remolacha azucarera, algodón o soja, particularmente maíz, trigo y soja así como también hortalizas y plantas ornamentales, comprendiendo dicho método aplicar a dichas plantas, a las semillas a partir de las que éstas crecen o al locus en el que éstas crecen, una cantidad no fitotóxica, efectiva para regular el crecimiento de las plantas, de uno o más compuestos de la fórmula (I).

ES 2 329 906 T3

Un aspecto adicional del invento es un método para la regulación del crecimiento de las plantas, cuyas plantas son plantas cultivadas monocotiledóneas o dicotiledóneas, seleccionadas preferiblemente entre el conjunto de las plantas cultivadas en el campo económicamente importantes, por ejemplo, trigo, cebada, centeno, triticale, arroz, maíz, remolacha azucarera, algodón o soja, particularmente maíz, trigo y soja, así como hortalizas y plantas ornamentales, comprendiendo dicho método aplicar a dichas plantas, a las semillas a partir de las que éstas crecen o al locus en el que éstas crecen, una cantidad no fitotóxica, efectiva para regular el crecimiento de las plantas, de un compuesto que tiene la fórmula (I) en una mezcla con materiales de soporte y/o agentes tensioactivos.

Un aspecto adicional del invento es un método para la regulación del crecimiento de las plantas, cuyas plantas son plantas cultivadas monocotiledóneas o dicotiledóneas, preferiblemente seleccionadas entre el conjunto de las plantas cultivadas en el campo económicamente importantes, tales como, por ejemplo, trigo, cebada, centeno, triticale, arroz, maíz, remolacha azucarera, algodón o soja, particularmente maíz, trigo y soja, así como hortalizas y plantas ornamentales, comprendiendo dicho método aplicar a dichas plantas, a las semillas a partir de las que éstas crecen o al locus en el que éstas crecen, una cantidad no fitotóxica, efectiva para regular el crecimiento de las plantas, de un compuesto que tiene la fórmula (I) junto con un compuesto activo adicional, seleccionado entre el conjunto que consiste en acaricidas, fungicidas, herbicidas, insecticidas, nematicidas o sustancias reguladoras del crecimiento de las plantas, que no son idénticas a los compuestos definidos por la fórmula (I). En el caso de que se pretenda aplicar el compuesto que tiene la fórmula (I), o bien a solas o junto con otro compuesto activo adicional, directamente a las semillas, hay diversas maneras de cómo desarrollar dicho tratamiento de las semillas, tal como por "revestimiento con películas = en inglés filmcoating" que está caracterizado por la creación de una formulación líquida que contiene un polímero aplicable que será aplicado a las semillas, mejorando con esto la adherencia, el cubrimiento y la distribución de los compuestos sobre las semillas.

Entre los compuestos activos adicionales que se han de aplicar junto con un compuesto que tiene la fórmula (I), o bien aplicados como un compuesto activo adicional o aplicados en una combinación de varios compuestos activos adicionales, los siguientes compuestos se mencionan específicamente como ejemplos de dichos compuestos activos adicionales:

2-fenil-fenol, sulfato de 8-hidroxi-quinolina; acibenzolar-S-metilo; actinovato; aldimorf; amidoflumet; ampropilfos; ampropilfos-potasio; andoprima; anilazina; azaconazol; azoxiestrobina; benalaxilo; benodanilo; benomilo, benthiavalicarb-isopropilo; benzamacrilo, benzamacrilo-isobutilo; bilanafos; binapacrilo; bifenilo; bitertanol; blasticidina-S; boscalida; bromuconazol; bupirimato; butiobato; butilamina; polisulfuro de calcio; capsamicina; captafol; captan; carbendazima; carboxina; carpropamida; carvona; quinometionato; clobentiazona; clorfenazol; cloroneb; clorotalonilo; clozolinato; cis-1-(4-cloro-fenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol; clozilacona; ciazofamida; ciflufenamida; cimoxanilo; ciproconazol; ciprodinilo; ciprofuram; dagger G; debacarb; diclofluanida; diclona; diclorofeno; diclocimet; diclomezina; diclorano; dietofencarb; difenoconazol; diflumerorima; dimetirimol; dimetormorf; dimoxiestrobina; diniconazol; diniconazol-M; dinocap; difenilamina; dipiritiona; ditalimfos; ditianona; dodina; drazoxolona; edifenfos; epoxiconazol; etaboxam; etirimol; etridiazol; famoxadona; fenamidona; fenapanilo; fenarimol; fenbuconazol; fenfuram; fenhexamida; fenitropano; fenoxanilo; fempiclonilo; fenpropidina; fenpropimorf; ferbam; fluazinam; flubenzimidazol; fludioxonilo; flumetover; flumorf; fluoromida; fluoquinconazol; fluoquinconazol; flurprimidol; flusilazol; flusulfamida; flutolanilo; flutriafol; folpet; fosetil-Al; fosetil-sodio; fuberidazol; furalaxilo; furametpir; flurcarbanilo; furmeciclox; guazatina; hexaclorobenceno; hexaconazol; himexazol; imazalilo; imibenconazol; triacetato de iminocadina; tris(albésilato) de iminocadina; yodocarb, ipconazol; iprobenfos; iprodiona; iprovalicarb; irumamicina; isoprotiolano; isovallediona; kasugamicina; kresoxima-metilo; mancozeb; maneb; meferimzona; mepanipirima; mepronilo; metalaxilo; metalaxilo-M, metconazol; metasulfocarb; metafurexam; 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo; 2-[[[ciclopropil[(4-(metoxi-fenil)imino]metil]tio]metil]-alfa-(metoximetil)en]benzoacetato de metilo; 2-[2-[3-(4-cloro-fenil)-1-metil-alilidenaminoximetil]-fenil]-3-metoxi-acrilato de metilo; metiram; metominoestrobina; metrafenona; metsulfovax; mildiomicina; carbonato de monopotasio; miclobutanilo; miclozolona; N-(3-etil-3,5,5-trimetil-ciclohexil)-3-formilamino-2-hidroxi-benzamida; N-(6-metoxi-3-piridinil)-ciclopropano-carboxamida; N-butil-8-(1,1-dimetil-etil)-1-oxa-espiro[4.5]decan-3-amina; natamicina; nitrotral-isopropilo; noviflumurón; nuarimol; ofurace; orisaestrobina; oxadixilo; ácido oxolínico; oxpoconazol; oxicarboxina; oxifentifina; paclbutrazol; pefurazoato; penconazol; pencicurón; pentiopirad; fosdifeno; ftalida; picobenzamida; picoxiestrobina; piperalina; polioxinas, polioxorima; probenazol; procloraz; procimidona; propamocarb; propanosina-sodio; propiconazol; propineb; proquinazida; protioconazol; piraclorobenzamida; pirazofos; pirifenox; pirimetanilo; piroquilon; piroxifur; pirrolnitrina; quinconazol; quinoxifeno; quintozeno; siltiofam; simeconazol; tetratiocarbonato de sodio; espiroxamina; azufre; tebuconazol; teclotalamo; tecnazeno; tetciclacis; tetraconazol; tiabendazol, ticiofeno; tifuluzamida; tiofanato-metilo; tiram; tiadinilo; tioximida; tolclorfen-metilo; tolilfluanida; triadimefon; triadimenol; triazabutilo; triazóxido; triciclamida; triciclazol; tridemorf; trifloxiestrobina; triflumizol; triforina, triticonazol; uniconazol; validamicina A; vinclozolina; zineb; ziram; zoxamida; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-cloro-fenil)-2-propinil]oxi]-3-metoxi-fenil]etil]-3-metil-2-[[[metilsulfonil]amino]-butanamida; 1-(1-naftalenil)-1H-pirrol-2,5-diona; 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina; 2,4-dihidro-5-metoxi-2-metil-4-[[[1-[3-(trifluorometil)-fenil]-etiliden]-amino]-oxi]-metil]-fenil]-3H-1,2,3-triazol-3-ona; 2-amino-4-metil-N-fenil-5-tiazol-carboxamida; 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridina-carboxamida; 3,4,5-tricloro-2,6-piridina-dicarbonitrilo; 3-[[3-bromo-6-fluoro-2-metil-1H-indol-1-il]-sulfonil]-N,N-dimetil-1H-1,2,4-triazol-1-sulfonamida; sales de cobre y formulaciones de cobre, tales como la mezcla de Burdeos; hidróxido de cobre; naftenato de cobre; oxiclورو de cobre; sulfato de cobre; cufraneb; óxido cuproso; mancobre; oxina-cobre; alanicarb; aldixicarb; alixicarb, aminocarb, bendiocarb, benfuracarb, bufencarb, butacarb, butocarboxima, butoxicarboxima, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, cloetocarb, dimetilan, etiofencarb, fenobucarb, fenotiocarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metam-sodio, metiocarb, metomilo; metolcarb, oxa-

milo, pirimicarb, promecarb, propoxur; tiodicarb, tiofanox, trimetacarb, XMC, xililcarb, acefato, azametifos, azinfos (-metilo, -etilo), bromofos-etilo, bromofenvinfos (-metilo), butatiofos, cadusafos, carbofenotión, cloroetoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos (-metilo/-etilo), coumafos, cianofenfos, cianofos, clorfenvinfos, demeton-S-metilo, demeton-S-metilsulfona, dialifos, diazinona, diclofentiión, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, dio-
 5 xabenzofos, disulfoton, EPN, etiión, etoprofos, etrimfos, famfur, fenamifos, fenitrotión, fensulfotiión, fentiión, flupi-
 razofos, fonofos, formotiión, fosmetilano, fostiazato, heptenofos, yodofenfenfos, iprobenfos, isazofos, isofenfos, O-
 salicilato de isopropilo, isoxatiión, malatiión, mecarbam, metacrifos, metamidofos, metidatiión, mevinfos, monocro-
 10 tofos, naled, ometoato, oxidemetona-metilo; paratiión (-metilo/-etilo), fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidona,
 fosfocarb, foxima, pirimifos (-metilo/-etilo), profenofos, propafos, propetamfos, protiofos, protoato, piraclufos, pirida-
 15 fentiión, piridatiión, quinalfos, sebufos, sulfotep, sulprofos, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorovinfos, tiometona,
 triazofos, triclorfón, vamidotiión, acrinatrina, aletrina (d-cis-trans, d-trans), beta-ciflutrina, bifentrina, bioaletrina, isó-
 mero S-ciclopentflico de bioaletrina, bioetanometrina, biopermetrina, bioesmetrina, clovaportrina, cis-cipermetrina,
 cis-resmetrina, cis-permetrina, clocitrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cipermetrina (alfa-, beta-, theta, zeta-),
 cifenotrina, deltametrina, empentrina (isómero 1R), esfenvalerato, etofenprox, fenflutrina, fenpropatrina, fempirtrina,
 20 fenvalerato, flubrocitrinato, flucitrinato, flufenprox, flumetrina, fluvalinato, fubfenprox, gamma-cihalotrina, imipro-
 trina, kade-trina, lambda-cihalotrina, metoflutrina, permetrina (cis-, trans-), fenotrina (isómero 1R-trans), praletrina,
 proflutrina, protrifenbuta, piresmetrina, resmetrina, RU 15525, silafluofeno, tau-fluvalinato, treflutrina, teraletrina, te-
 trametrina (isómero 1R), tralometrina, transflutrina, ZXI 8901, piretrinas (piretro), DDT, indoxacarb, acetamiprida,
 clotianidina, dinotefurano, imidacloprida, nitenpiram, nitiazina, tiacloprida, tiametoxam, nicotina, bensultap, cartap,
 25 camfecloro, clordano, endosulfano, gamma-HCH, HCH, heptacloro, lindano, metoxicloro espinosad, acetoprol, eti-
 prol, fipronilo, vaniliprol, avermectina, emamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, milbemicina, diofenolano,
 epofenonano, fenoxicarb, hidropreno, kinopreno, metopreno, piriproxifeno, tripreno, cromafenozida, halofenozida,
 metoxifenozida, tebufenozida, bistriflurón, clofluzurón, diflubenzurón, fluazurón, fluciclozurón, flufenoxurón, hexa-
 flumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, penflurón, teflubenzurón, triflumurón, buprofezina, ciromazina, dia-
 30 fentiurón, azociclotina, cihexatin, fenbutatin-óxido, clorfenapir, binapacril, dinobutón, dinocap, DNOC, fenazaquin,
 fenpiroximato, pirimidifeno, piridabeno, tebufenpirad, tolfenpirad, hidrametilnona, dicofol, rotenona, acequinocilo,
 fluacripirima, cepas de *Bacillus thuringiensis*, espirodiclofeno, espiromesifeno, carbonato de 3-(2,5-dimetil-fenil)-8-
 metoxi-2-oxo-1-aza-espiro[4.5]dec-3-en-4-ilo y de etilo (alias: éster de 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1-aza-es-
 35 piro[4.5]dec-3-en-4-ilo y de etilo de ácido carbónico, CAS nº de Reg.: 382608-10-8) y éster de cis-3-(2,5-dimetil-
 fenil)-8-metoxi-2-oxo-1-aza-espiro[4.5]dec-3-en-4-ilo y de etilo de ácido carbónico (CAS nº de Reg.: 203313-25-
 1), flonicamida, amitraz, propargita, N2-[1,1-dimetil-2-(metilsulfonil)etil]-3-yodo-N1-[2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-
 1-(trifluorometil)etil]fenil]-1,2-benceno-dicarboxamida (CAS nº de Reg.: 272451-65-7), hidrógeno oxalato de tio-
 ciclam, tiosultap-sodio, azadiractina, *Bacillus spec.*, *Beauveria spec.*, *codlemona*, *Metarrhizium spec.*, *Paecilomyces spec.*,
 40 *turingiensina*, *Verticillium spec.*, fosfuro de aluminio, bromuro de metilo, fluoruro de sulfurilo, criolita, flonica-
 mida, pimetrozina, clofentezina, etoxazol, hexitiazox, amidoflumet, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopro-
 pilato, buprofezina, quinometionato, clordimeform, clorobenzilato, cloropicrina, clotiazoben, ciclopreno, diciclanilo,
 fenoxacrima, fentrifanilo, flubenzimina, flufenerima, flutenzina, gosiplure, hidrametilnona, japonilure, metoxadiazona,
 45 petróleo, butóxido de piperonilo, oleato de potasio, piradailo, sulfluramida, tetradifon, tetrasul, tiaraten y verbutina.

Otro aspecto del invento es un método para la regulación del crecimiento en tejidos vegetales de plantas monocoti-
 ledóneas o dicotiledóneas, comprendiendo dicho método aplicar a cultivos de tejidos vegetales una cantidad apropiada
 de un compuesto que tiene la fórmula (I), o bien a solas o conjuntamente con por lo menos otro compuesto activo
 adicional seleccionado entre el conjunto de los agentes reguladores del crecimiento de las plantas o las hormonas
 vegetales.

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden emplear preferiblemente como agentes reguladores del crecimiento de
 plantas en plantas cultivadas monocotiledóneas o dicotiledóneas útiles, preferiblemente seleccionadas entre el conjunto
 de plantas cultivadas en el campo económicamente importantes, tales como, por ejemplo, trigo, cebada, centeno,
 50 tritical, arroz, maíz, remolacha azucarera, algodón, o soja, particularmente maíz, trigo y soja, así como hortalizas y
 plantas ornamentales, que han sido hechas de esta índole por medio de la ingeniería genética.

Vías tradicionales de generar nuevas plantas que tienen características modificadas en comparación con plantas
 existentes, consisten, por ejemplo, en métodos tradicionales de cultivación y en la generación de mutantes. Sin em-
 bargo, también es posible generar nuevas plantas con características alteradas con la ayuda de métodos de ingeniería
 55 genética (véanse, por ejemplo, los documentos EP-A-0221044 y EP-A-0131624). Por ejemplo, se han descrito varios
 casos de

- modificaciones por ingeniería genética de plantas cultivadas con la finalidad de modificar el almidón sintetizado
 en las plantas (véanse por ejemplo los documentos WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806),

- plantas cultivadas transgénicas que son resistentes a ciertos herbicidas del tipo de glufosinato (Compárense, por
 ejemplo, los documentos EP-A-0242236, EP-A-242246) o del tipo de glifosato (documento WO 92/00377) o del tipo
 de sulfonilureas (documentos EP-A-0257993 y US-A-5013659),

- plantas cultivadas transgénicas, por ejemplo de algodón, que son capaces de producir toxinas de *Bacillus thurin-*
giensis (toxinas Bt) que hacen que las plantas sean resistentes a plagas específicas (documentos EP-A-0142924, EP-
 A-0193259),

ES 2 329 906 T3

- plantas cultivadas transgénicas cuyo espectro de ácidos grasos ha sido modificado (WO 91/13972).

5 Un gran número de técnicas en biología molecular, por medio de las cuales se pueden generar nuevas plantas transgénicas con características alteradas, se conocen en principio; véanse, por ejemplo, las citas de Sambrook y colaboradores, 1989, *Molecular Cloning, A Laboratory Manual* [Clonación molecular, un manual de laboratorio], 2ª edición, Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, N.Y.; o de Winnacker "Gene und Klone" [Genes y clones], VCH Weinheim, 2ª edición 1996, o de Christou, "Trends in Plant Science" [Tendencias en la ciencia de las plantas] 1 (1996), 423-431).

10 Con el fin de realizar tales manipulaciones por ingeniería genética, se pueden introducir moléculas de ácidos nucleicos dentro de plásmidos, que permiten una mutagénesis o un cambio de secuencias por medio de una recombinación de secuencias de ADN. Es posible, por ejemplo, con la ayuda de los métodos clásicos antes mencionados, realizar intercambios de bases, eliminar subsecuencias o añadir secuencias naturales o sintéticas. Para conectar los fragmentos de ADN unos con otros, se pueden adosar adaptadores o engarzadores a los fragmentos.

15 Por ejemplo, se pueden generar células vegetales con una actividad reducida de un producto génico, expresando por lo menos un correspondiente ARN antisentido, un ARN del mismo sentido para conseguir un efecto supresor concomitante, o expresando por lo menos una ribozima de construcción apropiada, que disocia específicamente transcritos del producto génico antes mencionado.

20 Con esta finalidad, es posible hacer uso, por una parte, de moléculas de ADN que abarcan la secuencia codificadora entera de un producto génico, inclusive cualesquiera secuencias flanqueadoras que puedan estar presentes, y, por la otra parte, de moléculas de ADN que solamente abarcan partes de la secuencia codificadora, pero estas partes deben ser suficientemente largas con el fin de producir, en las células, un efecto antisentido. Se puede también hacer uso de secuencias de ADN que muestran un alto grado de homología con las secuencias codificadoras de un producto génico, pero que no son completamente idénticas.

30 Cuando se expresan moléculas de ácidos nucleicos en plantas, la proteína que ha sido sintetizada puede estar localizada en cualquier deseado compartimiento de la célula vegetal. Sin embargo, con el fin de conseguir una localización en un compartimiento particular, es posible, por ejemplo, engarzar la región codificadora con secuencias de ADN que garantizan una localización en un compartimiento particular. Tales secuencias son conocidas para un profesional experto (véanse, por ejemplo, las citas de Braun y colaboradores, *EMBO J.* 11 (1992), 3.219-3.227; Wolter y colaboradores. *Proc. Nat. Acad. Sci. USA* 85 (1988), 846-850; Sonnewald y colaboradores, *Plant J.* 1 (1991), 95-106).

35 Las células de plantas transgénicas se pueden regenerar por técnicas conocidas para dar plantas completas. En principio, las plantas transgénicas pueden ser plantas de cualquier deseada especie vegetal, es decir plantas monocotiledóneas y también dicotiledóneas.

40 Esto permite que se obtengan plantas transgénicas que exhiban características alteradas por medio de una sobreexpresión, supresión o inhibición de genes o secuencias de genes homólogos (= naturales), o por medio de una expresión de genes o secuencias de genes heterólogos (= ajenos).

45 Los compuestos de la fórmula (I) se pueden emplear preferiblemente en cultivos de plantas transgénicas que son resistentes a herbicidas tomados del conjunto de las sulfonilureas, el glufosinato-amonio o el glifosato-isopropilamónio y sustancias activas análogas que muestran fenotipos alterados, tales como, pero sin limitarse a, características tales como una modificación del contenido, un tiempo de florecimiento alterado, plantas estériles masculinas o femeninas, plantas resistentes al medio ambiente debido a una expresión o represión de genes endógenos o exógenos en la planta cultivada transgénica.

50 El uso de acuerdo con el invento para la regulación del crecimiento de las plantas, incluye también el caso en el que los compuestos de la fórmula (I) se forman tan sólo en la planta o en el suelo a partir de un precursor ("prodroga") después de su aplicación a la planta.

55 Los compuestos de la fórmula (I) se pueden emplear en las formulaciones convencionales tales como polvos humectables, concentrados emulsionables, soluciones proyectables, polvos para espolvorear o granulados. El invento se refiere, por lo tanto, también a composiciones reguladoras del crecimiento de las plantas que comprenden compuestos de la fórmula (I).

60 Los compuestos de la fórmula (I) se pueden formular de diversas maneras, dependiendo de los parámetros biológicos y/o químico-físicos prevaicentes. Ejemplos de posibles formulaciones que son apropiadas son: polvos humectables (WP), polvos solubles en agua (SP), concentrados solubles en agua, concentrados emulsionables (EC), emulsiones (EW), tales como emulsiones del tipo de aceite en agua y de agua en aceite, soluciones proyectables, concentrados para suspensión (SC), dispersiones sobre una base de aceite o de agua, soluciones que son miscibles con un aceite, suspensiones para encapsular (CS), polvos para espolvorear (DP), productos desinfectantes de semillas, granulados para esparcir y para su aplicación sobre el suelo, granulados (GR) en la forma de microgranulados, granulados formados por proyección, granulados revestidos y granulados formados por adsorción, granulados dispersables en agua (WG), granulados solubles en agua (SG), formulaciones ULV (de volumen ultraalto), microcápsulas y ceras.

Estos tipos de formulaciones individuales son conocidos en principio y se describen, por ejemplo, en las obras de: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" [Tecnología química], tomo 7, editorial C. Hauser, Munich, 4ª edición de 1986; Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations" (Formulaciones de plaguicidas), Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying Handbook" (Manual del secado por atomización), 3ª edición, G. Goodwin Ltd, Londres, 1979.

Los necesarios agentes coadyuvantes de formulación, tales como materiales inertes, agentes tensioactivos, disolventes y otros aditivos, son asimismo conocidos, y se describen, por ejemplo, en las obras de: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers" [Manual de diluyentes y soportes de polvos finos insecticidas], 2ª edición, Darland Books, Caldwell N.J.; H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry" [Introducción a la química de los coloides de arcilla], 2ª edición, J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide" [Guía de disolventes], 2ª edición, Interscience, N.Y. 1963; "Detergents and Emulsifiers Annual" [Anual de detergentes y emulsionantes] de McCutcheon, MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley y Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents" [Enciclopedia de agentes activos superficialmente], Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte" [Aductos con óxido de etileno interfacialmente activos], Wiss. Verlagsgesellschaft, Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" [Tecnología química], volumen 7, editorial C. Hauser Munich, 4ª edición de 1986.

Basándose en estas formulaciones, también es posible preparar combinaciones con sustancias activas como plaguicidas, tales como, por ejemplo, insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, y con antidotos, fertilizantes y/o reguladores del crecimiento, por ejemplo en la forma de una mezcla preparada o de una mezcla en depósito.

Los polvos humectables son unas formulaciones que son dispersables uniformemente en agua y que, además de los compuestos de la fórmula (I), comprenden también agentes tensioactivos iónicos y/o no iónicos (humectantes, dispersantes), por ejemplo alquifenoles poli(oxietilados), alcoholes grasos poli(oxietilados), aminas grasas poli(oxietiladas), (alcohol graso)-poliglicol-éter-sulfatos, alcano-sulfonatos o alquil-benceno-sulfonatos, ligno-sulfonato de sodio, 2,2'-dinaftilmetano-6,6'-disulfonato de sodio, dibutil-naftaleno-sulfonato de sodio o bien oleoil-metil-taurato de sodio, además de una sustancia diluyente o inerte. Para preparar los polvos humectables, los compuestos de la fórmula (I) son, por ejemplo, triturados finamente en aparatos convencionales tales como molinos de martillos, molinos de soplanete y molinos de chorros de aire, y mezclados con los agentes coadyuvantes de formulación, ya sea concomitantemente o a continuación de esto.

Los concentrados emulsionables se preparan, por ejemplo, disolviendo los compuestos de la fórmula (I) en un disolvente orgánico, por ejemplo butanol, ciclohexanona, dimetil-formamida, xileno o bien compuestos aromáticos o hidrocarburos de elevado punto de ebullición o mezclas de éstos, con adición de una o mas sustancias tensioactivas iónicas y/o no iónicas (emulsionantes). Emulsionantes que se pueden usar son, por ejemplo: sales de calcio de ácidos alquil-aril-sulfónicos, tales como dodecil-benceno-sulfonato de calcio, o emulsionantes no iónicos, tales como poliglicol-ésteres de ácidos grasos, alquil-aril-poliglicol-éteres, (alcohol graso)-poliglicol-éteres, condensados de óxido de propileno y óxido de etileno, alquil-poliéteres, ésteres de sorbitán, tales como ésteres con ácidos grasos de sorbitán o poli(oxietileno) ésteres de sorbitán, tales como poli(oxietileno) ésteres con ácidos grasos de sorbitán.

Los polvos para espolvorear se obtienen triturando la sustancia activa con sustancias sólidas finamente divididas, por ejemplo talco o arcillas naturales, tales como caolín, bentonita o pirofilita, o tierra de diatomeas.

Los concentrados para suspensión pueden estar basados en agua o en un aceite. Ellos se pueden preparar, por ejemplo, triturando en húmedo por medio de molinos de perlas comercialmente disponibles, si fuese apropiado con la adición de agentes tensioactivos, tal como ya se han mencionado con anterioridad por ejemplo en el caso de los otros tipos de formulaciones.

Las emulsiones, por ejemplo emulsiones del tipo de aceite en agua (EW), se pueden preparar por ejemplo por medio de agitadores, molinos de coloides y/o mezcladores estáticos usando disolventes orgánicos acuosos y, si fuese apropiado, agentes tensioactivos, como los que ya se han mencionado anteriormente, por ejemplo, en el caso de los otros tipos de formulaciones.

Los granulados se pueden preparar o bien proyectando los compuestos de la fórmula (I) sobre un material inerte granulado adsorbente, o aplicando concentrados de sustancias activas sobre la superficie de soportes tales como arena, caolinitas o un material inerte granulado, por medio de agentes aglutinantes, por ejemplo, un poli(alcohol vinílico), un poli(acrilato de sodio), o alternativamente aceites minerales. Apropriadas sustancias activas se pueden granular también de la manera que es convencional para la producción de granallas de fertilizantes, si se desea en una mezcla con fertilizantes.

Los granulados dispersables en agua se preparan, por regla general, mediante los procedimientos corrientes, tales como desecación por atomización, granulación en lecho fluidizado, granulación con discos, mezclamiento en mezcladores de alta velocidad y extrusión sin ningún material inerte sólido. Para preparar granulados formados con discos, en lecho fluidizado, en extrusor y por proyección, véanse, por ejemplo, los procesos reseñados en las obras: "Spray Drying Handbook" (Manual del secado por atomización), 3ª edición de 1979, G. Goodwin Ltd, Londres; J.E. Browning, "Agglomeration" (Aglomeración), Chemical and Engineering 1967, páginas 147 y siguientes; "Perry's Chemical

ES 2 329 906 T3

Engineer's Handbook" (Manual del ingeniero químico de Perry), 5ª edición, McGraw-Hill, Nueva York 1973, páginas 8-57.

5 Para más detalles acerca de la formulación de agentes para la protección de plantas cultivadas, véanse, por ejemplo, las obras de G.C. Klingman, *Weed Control as a Science* (Represión de malezas como ciencia), John Wiley and Sons, Inc., Nueva York, 1961, páginas 81-96 y de J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook" (Manual de la represión de malezas), 5ª edición, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, páginas 101-103.

10 Por regla general, las formulaciones agroquímicas comprenden de 0,1 a 99% en peso, en particular de 0,1 a 95% en peso, de compuestos de la fórmula (I).

15 La concentración de compuestos de la fórmula (I) en polvos humectables es, por ejemplo, de aproximadamente 10 a 90% en peso, estando compuesto el resto hasta 100% en peso por componentes de formulación corrientes. En el caso de concentrados emulsionables, la concentración de compuestos de la fórmula (I) puede ser hasta de aproximadamente 1 a 90, preferiblemente de 5 a 80% en peso. Las formulaciones en la forma de los polvos para espolvorear comprenden usualmente de 1 a 30% en peso de compuestos de la fórmula (I), preferiblemente en la mayor parte de los casos de 5 a 20% en peso de compuestos de la fórmula (I), mientras que las soluciones proyectables comprenden aproximadamente de 0,05 a 80, preferiblemente de 2 a 50% en peso de compuestos de la fórmula (I). En el caso de granulados dispersables en agua, el contenido de compuestos de la fórmula (I) depende en parte de sí los compuestos de la fórmula (I) están en una forma líquida o sólida, y de cuales sean los agentes coadyuvantes de granulación, materiales de carga y relleno y similares que se estén usando. Los granulados dispersables en agua, por ejemplo, comprenden entre 1 y 95% en peso de una sustancia activa, preferiblemente entre 10 y 80% en peso.

25 Además, las formulaciones de compuestos de la fórmula (I) mencionada, comprenden, si fuese apropiado, los agentes adhesivos, humectantes, dispersantes, emulsionantes, penetrantes, conservantes, agentes contra las heladas y anticongelantes, disolventes, materiales de carga y relleno, soportes, colorantes, antiespumantes, inhibidores de la evaporación, reguladores del pH y reguladores de la viscosidad, que son convencionales en cada caso.

30 Se conocen formulaciones apropiadas para composiciones reguladoras del crecimiento de las plantas. Una descripción de formulaciones apropiadas que se pueden usar en el método del invento, se puede encontrar en las publicaciones de patentes internacionales WO 87/3781, WO 93/6089 y WO 94/21606 así como en la solicitud de patente europea EP 295117 y en la patente de los EE.UU 5.232.940, Formulaciones o composiciones destinadas a usos en la regulación del crecimiento de las plantas se pueden producir de una manera similar, adaptando los ingredientes, si fuese necesario, para hacerlos más apropiados para la planta o para el suelo en el que se ha de realizar la aplicación.

35 Los compuestos de la fórmula (I) o sus sales se pueden emplear como tales o en la forma de sus preparaciones (formulaciones) como combinaciones con otras sustancias activas como plaguicidas tales como, por ejemplo, insecticidas, acaricidas, nematocidas, herbicidas, fungicidas, antídotos, fertilizantes y/u otros agentes reguladores del crecimiento, por ejemplo como una mezcla previa o como una mezcla en depósito.

40 Se ha encontrado que, de manera sorprendente, los compuestos de la fórmula (I) y de un modo sumamente especial los compuestos 1.1; 1.2; 1.3; 1.4; 1.5; 1.6; 1.7; 1.8; 1.9; 1.10; 1.11; 1.12; 1.13; 1.34; 1.35; 1.36; 1.37; 1.65; 1.96; 1.123; 1.133; 1.134; 1.135; 1.136; 1.137; 1.138; 1.139; 1.140; 1.141; 1.142; 1.143; 1.144; 1.145; 1.166; 1.167; 1.168; 1.169; 1.197; 1.228; 1.255; 1.268; 1.329; 1.399; 1.400; 1.461; 1.532; 1.664; 1.796; 2.1; 2.10; 2.11; 3.2; 3.3; 3.4; y 45 3.10 desempeñan un cometido importante en lo que concierne a las propiedades de crecimiento de las plantas, que pueden ser diferentes debido a una aplicación a diversas plantas cultivadas. Por ejemplo, el compuesto 1.136 muestra significativos efectos de aproximadamente la misma magnitud al ser usado como agente regulador del crecimiento de las plantas en maíz y trigo, pero en diferente concentración. El compuesto 1.141 muestra un efecto notable como agente regulador del crecimiento de las plantas en maíz y un efecto superior en trigo.

50 En virtud de la práctica del presente invento se puede inducir una amplia variedad de respuestas de crecimiento de las plantas, inclusive las siguientes (enumeración sin orden de importancia):

- 55 a) un sistema más desarrollado de raíces
- b) aumento de la formación de retoños
- c) aumento en la altura de las plantas
- 60 d) lámina más grande de las hojas
- e) menos hojas basales muertas
- f) retoños más fuertes
- 65 g) color más verde de las hojas

ES 2 329 906 T3

- h) se necesitan menos fertilizantes
- i) se necesitan menos semillas
- 5 j) retoños más productivos
- k) menos terceros retoños no productivos
- l) florecimiento más temprano
- 10 m) madurez temprana de los granos
- n) menos vuelco de las plantas (encamado)
- 15 o) panículas más largas
- p) crecimiento aumentado de los vástagos
- q) vigor mejorado de las plantas
- 20 r) germinación temprana
- s) más frutos y mejor rendimiento.

25 Se pretende que, tal como se usa en la presente memoria descriptiva, el término “método para la regulación del crecimiento de las plantas” o “regulación del crecimiento de las plantas” significa la consecución de cualesquiera de las diecinueve categorías de respuestas que antes se han mencionado o cualquier otra modificación de una planta, una semilla, un fruto o una legumbre (independientemente de que el fruto o la legumbre se coseche o no se coseche) siempre y cuando que el resultado neto sea el de aumentar el crecimiento o el beneficio para cualquier propiedad de la planta, la semilla, el fruto o la legumbre a distinción de cualquier acción plaguicida (a menos que el presente invento se practique en conjunción con, o en la presencia de, un plaguicida, por ejemplo un herbicida). El término “fruto” como
30 se usa en la presente memoria descriptiva, se ha de entender como que significa cualquier cosa de valor económico que se produzca por la planta. Preferiblemente, se obtiene por lo menos un aumento de 10% de una o más de las respectivas respuestas de crecimiento de las plantas.

35 El derivado de ácido 5-amino-1-aryl-pirazol-3-carboxílico de la fórmula (I) se puede aplicar para finalidades de regulación del crecimiento de plantas al follaje de plantas y/o al suelo en las que están creciendo dichas plantas. Las aplicaciones al suelo se efectúan frecuentemente en la forma de granulados, que se aplican usualmente en una cantidad suficiente para proporcionar un régimen de aproximadamente 0,00001 kg/ha a aproximadamente 0,5
40 kg/ha del ingrediente activo, preferiblemente entre 0,00001 y 0,1 kg/ha, más preferiblemente entre 0,00001 kg/ha y 0,01 kg/ha.

Una realización preferida del invento consiste en un método para la regulación del crecimiento de las plantas, que comprende aplicar a las semillas a partir de las que crecen dichas plantas, antes de dichas siembras, una cantidad no
45 fitotóxica efectiva para regular el crecimiento de las plantas, de un compuesto que tiene la fórmula (I). Las semillas se pueden tratar, especialmente mediante revestimiento o empotramiento o impregnación o empapamiento o inmersión en formulaciones líquidas o pastosas, que son conocidas de por sí, y subsiguientemente se pueden secar. Las semillas que comprenden de 0,1 a 1.000 gramos (g) por 100 kilogramos (kg) de un compuesto de la fórmula (I), preferiblemente de 0,1 a 800 g por 100 kg, lo más preferiblemente de 0,1 a 250 g por 100 kg, son particularmente apropiadas para esta
50 finalidad.

La cantidad exacta del derivado de ácido 5-amino-1-aryl-pirazol-3-carboxílico de la fórmula (I), que se ha de usar, dependerá, entre otras cosas, de la especie particular de planta que se esté tratando. Una dosis apropiada se puede determinar por una persona experta en la especialidad mediante una experimentación rutinaria. La respuesta de la
55 planta dependerá de la cantidad total de compuesto que se use, así como de la especie particular de planta que se esté tratando. Desde luego, la cantidad del derivado de ácido 5-amino-1-aryl-pirazol-3-carboxílico de la fórmula (I) no deberá ser fitotóxica con respecto a la planta que se esté tratando.

Aunque el método preferido de aplicación de los compuestos usados en el procedimiento de este invento se dirige
60 directamente al follaje y a los tallos de las plantas, los compuestos se pueden aplicar al suelo en el que están creciendo las plantas.

Los siguientes Ejemplos son ilustrativos de métodos para la regulación del crecimiento de las plantas de acuerdo con el invento, pero no deberán entenderse como que limiten al invento, puesto que ciertas modificaciones en materiales y en métodos resultarán evidentes para un profesional experto. Todas las mediciones de efectos reguladores del crecimiento de las plantas se determinaron o bien usando un ensayo de escrutinio de protoplastos y/o usando un ensayo de crecimiento de raíces y/o aplicando los compuestos previamente seleccionados al sistema de ensayo antes

definido en unas condiciones naturales de crecimiento en pruebas en el campo. En todos los casos, se tomaron como testigos protoplastos, plantas o partes de plantas o semillas sin tratar.

5 B. Ejemplos biológicos

Ejemplo 1

Sistema de protoplastos de plantas

10 El presente invento tiene como característica un ensayo denominado de alto caudal de realización para un escrutinio rápido de compuestos químicos que modulan el crecimiento de las células. El ensayo implica en general: a) a protoplastos de plantas que han crecido en un medio líquido, b) a una biblioteca de compuestos químicos, y c) escrutar los protoplastos para identificar los compuestos que afectan de una manera significativa al crecimiento y al desarrollo de las células.

Preparación de los protoplastos

20 Preferiblemente, los protoplastos se prepararon a partir de suspensiones de células que se derivan de tallos de maíz. Los protoplastos se obtuvieron por digestión enzimática de los agregados de células en la suspensión. Las células se digirieron durante 3-6 horas a la temperatura ambiente en una mezcla de celulasa y pectoliasa, los protoplastos fueron liberados por suave sacudimiento, filtrados a través de una malla de 45 μm y recogidos por centrifugación. Después de una digestión, los protoplastos se lavaron varias veces para eliminar los desechos celulares y los residuos de enzimas, y luego se volvieron a suspender en un medio de cultivo. Los protoplastos se colocaron en placas en partes alícuotas de 50 - 100 μl dentro de pocillos de microtitulación con una densidad que variaba entre 100.000 y 2.000.000 de protoplastos por ml, preferiblemente en una concentración de 800.000 protoplastos/ml.

Ensayo de escrutinio

30 Para identificar a los compuestos químicos que modulan el crecimiento de las células, se incubaron protoplastos de maíz con una biblioteca de compuestos químicos dentro de placas de microtitulación de 96 pocillos. Después de la incubación a 25°C durante 1-14 días, preferiblemente 7-10 días, el contenido de proteínas se midió mediante ensayos colorimétricos basados en el colorante de Coomassie. El crecimiento de las células tratadas con los compuestos químicos implicados en el ensayo, se detectó por comparación con protoplastos sin tratar.

40 El tratamiento con una sección de compuestos derivados de la fórmula (I) muestra un aumento de más de 50% con respecto a un testigo sin tratar.

Ejemplo 2

Ensayo de crecimiento de las raíces

45 Las raíces de las plantas son un tejido proliferativo en alto grado, que permite un método de escrutinio fácilmente accesible, barato y de corto plazo de duración, para agentes reguladores del crecimiento de las plantas. Los resultados obtenidos se pueden transferir con facilidad a los efectos globales sobre una planta de los agentes reguladores del crecimiento de las plantas identificados por dicho sistema. Usando este ensayo con raíces, se hace posible que una persona determine el efecto de un tratamiento de semillas para el crecimiento de las raíces y/o la germinación y/o los cambios en el hábitat de plantas germinadas con el fin de identificar el posible uso como un agente intensificador del rendimiento. Dos semillas de trigo (*Triticum aestivum*, variedad "TRISO") o 1 semilla de maíz (*Zea mays*, variedad "LORENZO") por orificio en una bandeja de material plástico que contiene una arquitectura de 8 x 13 orificios, se colocaron sobre una tierra con composte, cubierta con arena. Estas semillas se trataron 100 μl /orificio, lo que crea un volumen de aplicación de aproximadamente 1.200 l/ha, de una solución de un compuesto en unos regímenes de ingrediente activo equivalentes a 100, 10 y 1 g de i.a./ha de cada compuesto usando un sistema robótico de aplicación (de Lizzy Spray Robotics). Se realizaron seis réplicas en una fila de cada compuesto y de cada concentración. El borde exterior de la bandeja de material plástico, que antes se ha definido, se dejó sin tratar para evitar falsos efectos negativos y la fila central (n° 7) se usó como testigo sin tratar. Las semillas tratadas se dejaron secar durante aproximadamente 4 horas y subsiguientemente se cubrieron con arena y se regaron. Las bandejas se almacenaron en cámaras climatizadas con 14 horas de iluminación a una temperatura de 24°C (± 2) durante el día y 16°C (± 2) durante la noche y con una humedad relativa (h.r.) de 60%, y se regaron diariamente. Las determinaciones se efectuaron a los 16 (± 2) días después del tratamiento, recontando las plantas germinadas y comprobando los síntomas y el porcentaje de fitotoxicidad. Además, las raíces se lavaron y los vástagos se cortaron directamente por encima de las semillas y las raíces mojadas se colocaron sobre toallitas de papel seco durante aproximadamente 30 minutos y se pesaron posteriormente. Este procedimiento proporciona un grado similar de humedad a las raíces, de manera tal que es posible una comparación de los pesos.

ES 2 329 906 T3

La Tabla 4 muestra los resultados de algunos de los compuestos (Cpd) reivindicados como que son efectivos en la regulación del crecimiento de las plantas en lo concerniente al maíz. Los efectos observados en lo que concierne al Crecimiento de las Raíces reseñado en la columna 2 (un Crecimiento de las Raíces de "100" es establecido como el patrón) se dirigen a unas concentraciones que son equivalentes a 100, 10, 1 g de i.a./ha, de cada uno.

5

TABLA 4

10

15

20

Cpd	Maíz (concentración g de i.a./ha)		
	100	10	1
1.136	74	131	107
1.141	95	102	111
1.228	186	111	72

25

La Tabla 5 muestra los resultados de algunos de los compuestos (Cpd) reivindicados como que son efectivos en la regulación del crecimiento de las plantas en lo concerniente al trigo. Los efectos observados en lo que concierne al Crecimiento de las Raíces reseñado en la columna 2 (un Crecimiento de las Raíces de "100" se establece como el patrón) se dirigen a unas concentraciones que son equivalentes a 100, 10, 1 g de i.a./ha, de cada uno.

30

TABLA 5

35

40

45

Cpd	Trigo (concentración g de i.a./ha)		
	100	10	1
1.136	58	75	124
1.144	110	115	170
1.141	256	160	257
2.10	134	118	158

50

Ejemplo 3

Prueba en el campo

55

Semillas de maíz híbrido de Magister y Zamora se sembraron y trataron con el compuesto 1.136 a razón de 1 g/100 kg de semillas (0,0003 kg/ha).

60

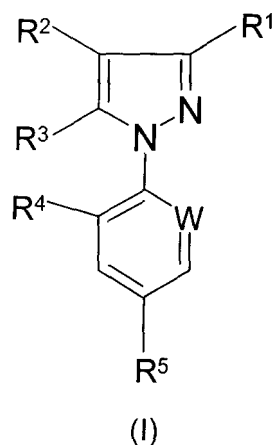
Las pruebas en el campo se establecieron en un diseño de parcela disociada, que representa a las plantas tratadas con compuestos de la fórmula (I) así como a las plantas testigos sin tratar.

65

Los resultados mostraron un aumento en el rendimiento de los granos de hasta 119% en el caso del híbrido Magister y de hasta 131% en el caso del híbrido Zamora, en comparación con el rendimiento obtenido con plantas testigo sin tratar en cada caso.

REIVINDICACIONES

1. Uso de un compuesto de la fórmula (I) o de una sal aceptable en agricultura del mismo para la regulación del crecimiento de las plantas



en el que:

R¹ es CONR⁶R⁷ o CO₂R⁸;

W es C-halógeno o N;

R² es H o S(O)_mR⁹;

R³ es NR¹⁰R¹¹, halógeno, OH, alcoxi (C₁-C₆), alquenil (C₂-C₆)-oxi o alquinil (C₂-C₆)-oxi;

R⁴ es H o halógeno;

R⁵ es halo-alquilo (C₁-C₄) o halo-alcoxi (C₁-C₄);

R⁶ es H, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), halo-alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), halo-alquinilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), cicloalquil (C₃-C₇)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)-tio, (CH₂)_nR¹², (CH₂)_pR¹³, alquil (C₁-C₆)-CN, alquil (C₁-C₆)-NR¹⁰R¹¹ o alquil (C₁-C₆)-S(O)_rR⁹;

R⁷ es H, alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₃-C₆) o alquinilo (C₃-C₆); o

R⁶ y R⁷ junto con el átomo de N unido a ellos, forman un anillo saturado de cinco o seis miembros, que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo, que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₆) y halo-alquilo (C₁-C₆);

R⁸ es H, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆) o (CH₂)_nR¹²;

R⁹ es alquilo (C₁-C₆) o halo-alquilo (C₁-C₆);

R¹⁰ y R¹¹ son, cada uno de ellos independientemente, H, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), halo-alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₆), COR¹⁴ ó CO₂R¹⁵;

R¹⁰ y R¹¹ en común con el átomo de N unido a ellos, forman un anillo saturado de cinco o seis miembros, que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo, que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₆) y halo-alquilo (C₁-C₆);

R¹² es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), halo-alcoxi (C₁-C₆), CO₂R¹⁶, CN, NO₂, S(O)_qR⁹, COR¹⁶, NR¹⁶R¹⁷ y OH;

ES 2 329 906 T3

R¹³ es heterociclilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₄), halo-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), halo-alcoxi (C₁-C₄), NO₂, CN, CO₂R¹⁶, S(O)₄R⁹, OH y oxo;

5 R¹⁴ y R¹⁵ son, cada uno de ellos independientemente, H, alquilo (C₁-C₆), halo-alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), halo-alqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆) o alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄);

R¹⁶ y R¹⁷ son, cada uno de ellos independientemente, H, alquilo (C₁-C₆) o halo-alquilo (C₁-C₆);

10 m, q y r son, cada uno de ellos independientemente, 0, 1 ó 2;

n y p son, cada uno de ellos independientemente, 0, 1, 2, 3 ó 4; y

15 cada heterociclilo en los radicales antes mencionados es independientemente un radical heterocíclico que tiene de 3 a 7 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo, seleccionados entre el conjunto que consiste en N, O y S.

2. El uso de un compuesto como se define en la reivindicación 1, en el que

20 R¹ es CONR⁶R⁷;

W es C-Cl ó C-Br;

R² es S(O)_mR⁹,

25 R³ es NR¹⁰R¹¹, halógeno, OH, alcoxi (C₁-C₃), alqueno (C₂-C₆)-oxi o alquino (C₂-C₆)-oxi;

R⁴ es Cl ó Br;

30 R⁵ es CF₃ ó OCF₃;

R⁶ es H, alquilo (C₁-C₄), halo-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₃)-alquilo (C₁-C₃), alqueno (C₃-C₄), halo-alqueno (C₃-C₄), alquino (C₃-C₄), halo-alquino (C₃-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), alquilo (C₁-C₃)-tio, (CH₂)_nR¹² ó (CH₂)_pR¹³;

35 R⁷ es H, alquilo (C₁-C₄), alqueno (C₃-C₄) o alquino (C₃-C₄); o

preferiblemente R⁶ y R⁷ en común con el átomo de N unido a ellos, forman un anillo saturado de cinco o seis miembros, que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo, que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₃) y halo-alquilo (C₁-C₃);

R⁹ es alquilo (C₁-C₃) o halo-alquilo (C₁-C₃) (más preferiblemente R⁹ es CF₃);

45 R¹⁰ y R¹¹ son, cada uno de ellos independientemente, H, alquilo (C₁-C₃), halo-alquilo (C₁-C₃), alqueno (C₃-C₄), halo-alqueno (C₃-C₄), alquino (C₃-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₃), COR¹⁴ ó CO₂R¹⁵;

50 R¹⁰ y R¹¹ en común con el átomo de N unido a ellos, forman un anillo saturado de cinco o seis miembros, que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo, que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₃) y halo-alquilo (C₁-C₃);

55 R¹² es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₃), halo-alquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), halo-alcoxi (C₁-C₃), CO₂R¹⁶, CN, NO₂, S(O)₄R⁹, COR¹⁶, CONR¹⁶R¹⁷, NR¹⁶R¹⁷ y OH;

R¹³ es heterociclilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₃), halo-alquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), halo-alcoxi (C₁-C₃), NO₂, CN, CO₂R¹⁶, S(O)₄R⁹, OH y oxo;

60 R¹⁴ y R¹⁵ son, cada uno de ellos independientemente, H, alquilo (C₁-C₃), halo-alquilo (C₁-C₃), alqueno (C₂-C₃), halo-alqueno (C₂-C₃), alquino (C₂-C₃) o alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₄);

R¹⁶ y R¹⁷ son, cada uno de ellos independientemente, H, alquilo (C₁-C₃) o halo-alquilo (C₁-C₃); y

65 cada heterociclilo en los radicales antes mencionados es independientemente un radical heterocíclico que tiene de 3 a 6 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo, seleccionados en el conjunto que consiste en N, O y S.

ES 2 329 906 T3

3. El uso de un compuesto como se define en la reivindicación 1, en el que

R¹ es CONR⁶R⁷;

5 W es C-Cl;

R² es H, ó S(O)_mR⁹,

R³ es NR¹⁰R¹¹, halógeno, OH o alcoxi (C₁-C₃);

10 R⁴ es Cl;

R⁵ es CF₃;

15 R⁶ es H, alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₃)-alquilo (C₁-C₂), alqueno (C₃-C₄), alquino (C₃-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₂), alcoxi (C₁-C₃), alquil (C₁-C₃)-tio, (CH₂)_nR¹² ó (CH₂)_pR¹³;

R⁷ es H, alquilo (C₁-C₃), alqueno (C₃-C₄) o alquino (C₃-C₄);

20 R⁹ es metilo, etilo o CF₃;

R¹⁰ y R¹¹ son, cada uno de ellos independientemente, H, alquilo (C₁-C₃), halo-alquilo (C₁-C₃), alqueno (C₃-C₄), halo-alqueno (C₃-C₄), alquino (C₃-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₃), COR¹⁴ ó CO₂R¹⁵;

25 R¹² es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₃), halo-alquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), CO₂R¹⁶, CN y NO₂;

30 R¹³ es heterociclilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₃), halo-alquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), halo-alcoxi (C₁-C₃), NO₂, CN, CO₂R¹⁶, S(O)_qR⁹, OH y oxo;

R¹⁴ y R¹⁵ son, cada uno de ellos independientemente, alquilo (C₁-C₃);

35 R¹⁶ y R¹⁷ son, cada uno de ellos independientemente, H o alquilo (C₁-C₃); y

cada heterociclilo en los radicales antes mencionados es independientemente un radical heterocíclico que tiene de 3 a 6 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo, seleccionados en el conjunto que consiste en N, O y S.

4. El uso de un compuesto como se define en la reivindicación 1, en el que

40 R¹ es CONR⁶R⁷;

W es C-Cl;

45 R² es H, o S(O)_mR⁹;

R³ es NHR¹⁰;

R⁴ es Cl;

50 R⁵ es CF₃;

55 R⁶ es H, alquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₂)-alquilo (C₁-C₂), alqueno (C₃-C₄), alquino (C₃-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₂), furfurilo o tetrahidrofurfurilo;

R⁷ es H o alquilo (C₁-C₃),

R⁹ es metilo, etilo o CF₃; y

60 R¹⁰ es H, metilo o etilo.

5. El uso de un compuesto como se define en la reivindicación 1, en el que

65 R¹ es CO₂R⁸;

W es C-Cl;

ES 2 329 906 T3

R² es H, o S(O)_mR⁹;

R³ es NR¹⁰R¹¹;

5 R⁴ es Cl;

R⁵ es CF₃;

R⁸ es H, metilo o etilo;

10 R⁹ es metilo, etilo o CF₃;

R¹⁰ es H, metilo o etilo; y

15 R¹¹ es H.

6. El uso de un compuesto como se define en la reivindicación 1, en el que

20 R¹ es CONR⁶R⁷;

W es C-Cl;

25 R² es S(O)_mCF₃;

R³ es NR¹⁰R¹¹, halógeno, OH o alquilo (C₁-C₂);

R⁴ es Cl;

30 R⁵ es CF₃;

R⁶ es H o alquil (C₁-C₃)-tio;

R⁷ es H;

35 R¹⁰ es alquilo (C₁-C₃), COR¹⁴ ó CO₂R¹⁵;

R¹¹, R¹⁴ y R¹⁵ son, cada uno de ellos independientemente, alquilo (C₁-C₃).

40

7. El uso de una composición para la regulación del crecimiento de las plantas, que comprende uno o más compuestos de la fórmula (I) como se han definido en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 o una sal aceptable en agricultura de los mismos, soportes y/o agentes tensioactivos útiles para formulaciones de protección de las plantas.

45

8. El uso de una composición que se reivindica en la reivindicación 7, en el que la composición usada comprende un compuesto activo adicional seleccionado entre el conjunto que consiste en acaricidas, fungicidas, herbicidas, insecticidas, nematocidas o sustancias reguladoras del crecimiento de las plantas, que no son idénticas a compuestos definidos por la fórmula (I) de la reivindicación 1.

50

9. El uso que se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 7 a 8 para la regulación del crecimiento de las plantas, en el que la planta es una planta cultivada monocotiledónea o dicotiledónea.

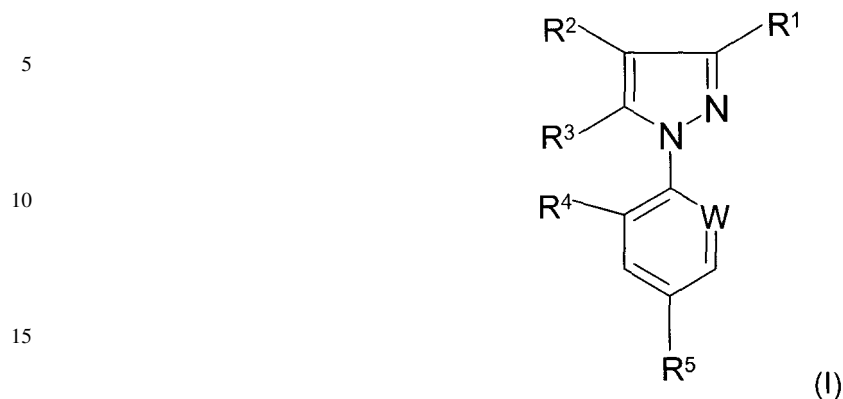
55 10. El uso que se reivindica en la reivindicación 9, en el que la planta se selecciona entre el conjunto que consiste en trigo, cebada, centeno, tritical, arroz, maíz, remolacha azucarera, algodón o soja.

60 11. Un método para la regulación del crecimiento en plantas cultivadas, que comprende aplicar una cantidad efectiva de un compuesto de la fórmula (I) como se ha definido en las reivindicaciones 1 a 6, al sitio en el que se desea la acción, comprendiendo dicho método aplicar a las plantas, a las semillas a partir de las que éstas crecen o al locus en el que éstas crecen, una cantidad no fitotóxica efectiva para regular el crecimiento de las plantas, de uno o más compuestos de la fórmula (I).

65 12. Un método que se reivindica en la reivindicación 11, que da como resultado un aumento del rendimiento de por lo menos 10% en lo que concierne a las plantas a las que éste se aplica.

ES 2 329 906 T3

13. Un compuesto que se define por la fórmula (I), o una sal del mismo,



20 en la que:

i) R^1 es CO_2R^8 ;

R^2 es H ó $S(O)_mR^9$;

25 R^3 y m son como antes se han definido;

R^8 es H;

30 R^9 es alquilo (C_2-C_6) o halo-alquilo (C_1-C_6);

R^4 es Cl;

R^5 es CF_3 ; y

35 W es C-Cl;

o

40 ii) R^1 es $CONR^6R^7$;

R^6 es alquilo (C_1-C_6), halo-alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6), alqueno (C_2-C_6), halo-alqueno (C_2-C_6), alquino (C_2-C_6), halo-alquino (C_2-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7), cicloalquil (C_3-C_7)-alquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), alquil (C_1-C_6)-tio, $(CH_2)_nR^{12}$, $(CH_2)_pR^{13}$, alquil (C_1-C_6)-CN, alquil (C_1-C_6)- $NR^{10}R^{11}$ o alquil (C_1-C_6)- $S(O)_rR^9$; o

45 R^6 y R^7 en común con el átomo de N unido a ellos, forman un anillo saturado de cinco o seis miembros, que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo, el cual se selecciona entre O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C_1-C_6) y halo-alquilo (C_1-C_6);

50 R^2 , R^3 , R^7 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , n, p y r son como se definen en la fórmula (I);

R^4 es Cl;

55 R^5 es CF_3 ; y

W es C-Cl;

con la exclusión del compuesto en el que:

60 R^1 es $CON(CH_3)_2$; R^2 es CF_3S ; R^3 es OH; R^4 es Cl, R^5 es CF_3 ; y W es C-Cl.

65