



(19)



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

(11) Número de publicación: **2 333 977**

(51) Int. Cl.:
C07D 261/04 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)
A01N 43/80 (2006.01)

(12)

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

(96) Número de solicitud europea: **05782898 .0**
(96) Fecha de presentación : **15.09.2005**
(97) Número de publicación de la solicitud: **1799657**
(97) Fecha de publicación de la solicitud: **27.06.2007**

(54) Título: **Derivados de isoxazolina y su uso como herbicidas.**

(30) Prioridad: **05.10.2004 GB 0422112**
07.02.2005 GB 0502487

(45) Fecha de publicación de la mención BOPI:
03.03.2010

(45) Fecha de la publicación del folleto de la patente:
03.03.2010

(73) Titular/es: **Syngenta Limited**
European Regional Centre Priestley
Road Surrey Research Park
Guildford Surrey GU2 7YH, GB

(72) Inventor/es: **Plant, Andrew;**
Boehmer, Jutta Elisabeth y
Peace, Alison Lindsey

(74) Agente: **Elzaburu Márquez, Alberto**

ES 2 333 977 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

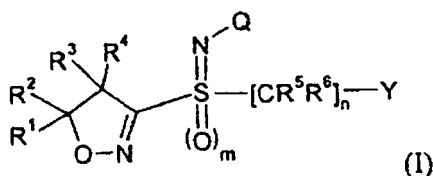
Derivados de isoxazolina y su uso como herbicidas.

La presente invención se refiere a nuevos compuestos herbicidas de isoxazolina, a procedimientos para su preparación, a composiciones que comprenden esos compuestos y a su uso para controlar malas hierbas, especialmente en cultivos de plantas útiles, o para inhibir el crecimiento de plantas.

Compuestos de isoxazolina que presentan una acción herbicida se describen, por ejemplo, en los documentos JP 08 225 548, EP 1.203.768, EP 1.364.946, EP 1.405.853, US 2005/256004 y JP 2005/035924. La preparación de estos compuestos también se describe en el documento EP 1.541.561. Ciertas sulfoximinas que presentan una acción herbicida se divulgan en los documentos WO 04/052849 y US 4.556.413.

Se han encontrado ahora nuevos compuestos de sulfoximina que presentan propiedades herbicidas e inhibidoras del crecimiento.

De acuerdo con esto, la presente invención se refiere a un compuesto de fórmula (I)



en la que

R¹ y R² son ambos alquilo C₁-C₁₀;

R³ y R⁴ son ambos hidrógeno;

R⁵ y R⁶ son cada uno independientemente del otro hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo o halógeno;

m es 0 ó 1;

n es 1;

Q es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, haloalcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, alquil(C₁-C₆)-carbonilo, haloalquil(C₁-C₆)-carbonilo, fenilcarbonilo o fenilcarbonilo sustituido con uno a tres R⁹, o

Q es piridilcarbonilo o piridilcarbonilo sustituido con uno a tres R⁹, o

Q es nitro, formilo, alquil(C₁-C₆)-sulfonilo o haloalquil(C₁-C₆)-sulfonilo, o

Q es fenilsulfonilo o fenilsulfonilo sustituido con uno a tres R⁹, o

Q es un heterociclo de 3 a 10 miembros que contiene uno a tres átomos de nitrógeno, oxígeno o azufre, heterociclo que puede estar benzocondensado, y heterociclo que puede estar sustituido con alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o ciano; e

Y es fenilo, que está opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, ciano, halógeno, alquil(C₁-C₆)-tio, haloalquil(C₁-C₆)-tio, alquil(C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquil(C₁-C₆)-sulfonilo, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ o fenilo, o

Y es un heterociclo de 5 a 10 miembros que contiene uno a tres átomos de nitrógeno, oxígeno o azufre, que está opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o halógeno;

R⁹ son independientemente unos de otros nitro o halógeno;

y a N-óxidos, sales e isómeros ópticos de compuestos de fórmula I.

5

Los compuestos de la invención pueden contener uno o más átomos de carbono asimétricos, por ejemplo, en el grupo -CR⁵R⁶- y el grupo -S(O)_mNQ y pueden existir como enantiómeros (o como pares de diastereoisómeros) o como mezclas de estos. Además, cuando m es 0, los compuestos de la invención son sulfilminas, que pueden existir en dos formas enantiómeras, y el carbono adyacente también puede existir en dos formas enantiómeras. Por lo tanto, los compuestos de fórmula general I pueden existir como racematos, diastereoisómeros, o enantiómeros simples, y la invención incluye todos los posibles isómeros o mezclas de isómeros en todas las proporciones. Ha de esperarse que para cualquier compuesto dado, un isómero puede ser más herbicida que otro.

15 El enlace S=N mostrado en la Fórmula I también puede representarse como S⁺-N⁻ y todavía existe algún debate en la bibliografía acerca de si el verdadero carácter de este enlace es un enlace sencillo o doble. Cualquiera que sea la representación que se use, los compuestos reales siguen siendo los mismos.

Excepto cuando se indique otra cosa, los grupos alquilo y los restos alquilo de alcoxi, alquiltio, etc., contienen adecuadamente de 1 a 10, típicamente de 1 a 6, átomos de carbono en forma de cadenas lineales o ramificadas. Ejemplos son metilo, etilo, *n*- e *iso*-propilo y *n*-, *sec*-, *iso*- y *terc*-butilo.

Excepto cuando se indique otra cosa, los grupos haloalquilo y los restos haloalquilo de haloalcoxi, haloalquiltio, etc., también contienen adecuadamente de 1 a 6, típicamente de 1 a 4, átomos de carbono en forma de cadenas lineales o ramificadas. Ejemplos son difluorometilo y 2,2,2-trifluoroetilo.

25 Halo incluye fluoro, cloro, bromo y yodo. Lo más comúnmente, es fluoro, cloro o bromo y habitualmente fluoro o cloro.

Excepto cuando se indique otra cosa, los grupos heterocíclicos son adecuadamente anillos de 5 a 10 miembros que contienen uno a tres átomos de nitrógeno, oxígeno o azufre, que pueden estar opcionalmente benzocondensados. Ejemplos son grupos furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, tetrazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, 1,2,3,4-tetrazinilo, 1,2,3,5-tetrazinilo, 1,2,4,5-tetrazinilo, benzofurilo, isobenzofurilo, benzotiofenilo, isobenzotiofenilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, bencimidazolilo, benzotriazolilo, benzoxazolilo, 1,2-bencisoxazolilo, 2,1-bencisoxazolilo, benzotiazolilo, 1,2-bencisotiazolilo, 2,1-bencisotiazolilo, 1,2,3-benzoxadiazolilo, 2,1,3-benzoxadiazolilo, 1,2,3-benzotiadiazolilo, 2,1,3-benzotiadiazolilo, quinolilo, isoquinolilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo, indolizini-
30 lo, benzo-1,3-dioxolilo, 4H-benzo-1,3-dioxinilo y 4H-benzo-1,4-dioxinilo y, cuando sea apropiado, sus N-óxidos y sales.

La invención también incluye N-óxidos de los compuestos de fórmula I.

Asimismo, la invención se refiere a las sales que los compuestos de fórmula I son capaces de formar con aminas, bases de metales alcalino y metales alcalinotérreos y bases de amonio cuaternario.

Entre los hidróxidos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos como formadores de sales, debe hacerse una mención especial a los hidróxidos de litio, sodio, potasio, magnesio y calcio, pero especialmente los hidróxidos de sodio y potasio. Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención también incluyen hidratos que pueden formarse durante la formación de sales.

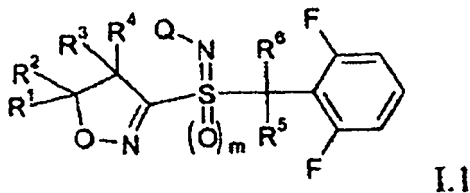
Ejemplos de aminas adecuadas para la formación de sales amónicas incluyen amoníaco así como alquil(C₁-C₁₈)-aminas, hidroxialquil(C₁-C₄)-aminas y alcoxialquil(C₂-C₄)-aminas primarias, secundarias y terciarias, por ejemplo metilamina, etilamina, *n*-propilamina, isopropilamina, los cuatro isómeros de butilamina, *n*-amilamina, isoamilamina, hexilamina, heptilamina, octilamina, nonilamina, decilamina, pentadecilamina, hexadecilamina, heptadecilamina, octadecilamina, metiletilamina, metilisopropilamina, metilhexilamina, metilnonilamina, metilpentadecilamina, metioctadecilamina, etilbutilamina, etilheptilamina, etiloctilamina, hexilheptilamina, hexiloctilamina, dimetilamina, dietilamina, di-*n*-propilamina, diisopropilamina, d-*n*-butilamina, di-*n*-amilamina, diisoamilamina, dihexilamina, diheptilamina, dioctilamina, etanolamina, *n*-propanolamina, isopropanolamina, N,N-dietanolamina, N-etilpropanolamina, N-butiletanolamina, alilamina, *n*-butil-2-amina, *n*-pentenil-2-amina, 2,3-dimetilbutil-2-amina, dibutil-2-amina, *n*-hexenil-2-amina, propilendiamina, trimetilamina, trietilamina, tri-*n*-propilamina, triisopropilamina, tri-*n*-butilamina, triisobutilamina, tri-*sec*-butilamina, tri-*n*-amilamina, metoxietilamina y etoxietilamina; aminas heterocíclicas tales como, por ejemplo, piridina, quinolina, isoquinolina, morfolina, piperidina, pirrolidina, indolina, quinuclidina y azepina; arilaminas primarias tales como, por ejemplo, anilinas, metoxianilinas, etoxianilinas, o-, m- y p-toluidinas, fenilendiaminas, bencidinas, naftilaminas y o-, m- y p-cloroanilinas; pero especialmente trietilamina, isopropilamina y diisopropilamina.

ES 2 333 977 T3

Bases de amonio cuaternario preferidas adecuadas para la formación de sales corresponden, por ejemplo, a la fórmula $(N(R_a R_b R_c R_d))OH$ en la que R_a , R_b , R_c y R_d son cada uno independientemente de los otros alquilo C_1 - C_6 . Otras bases de tetraalquilamonio adecuadas con otros aniones pueden obtenerse, por ejemplo, mediante reacciones de intercambio aniónico.

TABLA 1

Compuestos de fórmula I.1



R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	m	Q
Me	Me	H	H	Br	CF_3	1	H
Me	Me	H	H	CO_2Me	F	0	H
Me	Me	H	H	CN	I	1	H
Me	Me	H	H	Br	I	0	H
Me	Me	H	H	Br	Cl	1	H
Me	Me	H	H	CN	Br	1	H
Me	Me	H	H	CO_2Me	I	0	H
Me	Me	H	H	H	Br	1	H
Me	Me	H	H	Br	Br	1	H
Me	Me	H	H	H	CF_3	1	H
Me	Me	H	H	Me	I	1	H
Me	Me	H	H	I	I	0	H
Me	Me	H	H	Me	Br	1	H
Me	Me	H	H	I	CF_3	0	H

ES 2 333 977 T3

R¹	R²	R³	R⁴	R⁵	R⁶	m	Q
Me	Me	H	H	H	Br	0	H
Me	Me	H	H	Br	F	0	H
Me	Me	H	H	F	I	1	H
Me	Me	H	H	Br	F	1	H
Me	Me	H	H	H	H	1	H
Me	Me	H	H	CO ₂ Me	I	1	H
Me	Me	H	H	H	H	0	H
Me	Me	H	H	Me	CF ₃	0	H
Me	Me	H	H	F	F	1	H
Me	Me	H	H	Me	I	0	H
Me	Me	H	H	CO ₂ Me	F	1	H
Me	Me	H	H	Me	CF ₃	1	H
Me	Me	H	H	H	Me	1	H
Me	Me	H	H	CN	CO ₂ Me	1	H
Me	Me	H	H	CN	CN	0	H
Me	Me	H	H	F	F	0	H
Me	Me	H	H	CO ₂ Me	Cl	1	H
Me	Me	H	H	Me	CO ₂ Me	0	H
Me	Me	H	H	H	Cl	1	H
Me	Me	H	H	Cl	F	1	H
Me	Me	H	H	H	CO ₂ Me	1	H
Me	Me	H	H	H	F	1	H
Me	Me	H	H	H	I	1	H
Me	Me	H	H	Me	F	1	H
Me	Me	H	H	Br	I	1	H
Me	Me	H	H	Cl	CF ₃	1	H
Me	Me	H	H	Me	Me	1	H
Me	Me	H	H	Me	F	0	H
Me	Me	H	H	CN	Br	0	H
Me	Me	H	H	F	I	0	H
Me	Me	H	H	CN	Cl	1	H
Me	Me	H	H	H	F	0	H
Me	Me	H	H	I	CF ₃	1	H
Me	Me	H	H	Me	Me	0	H
Me	Me	H	H	Me	CO ₂ Me	1	H

ES 2 333 977 T3

R¹	R²	R³	R⁴	R⁵	R⁶	m	Q
Me	Me	H	H	CN	CF ₃	1	H
Me	Me	H	H	CO ₂ Me	CF ₃	0	H
Me	Me	H	H	CN	Cl	0	H
Me	Me	H	H	Me	CN	1	H
Me	Me	H	H	CN	CO ₂ Me	0	H
Me	Me	H	H	Me	Cl	0	H
Me	Me	H	H	CO ₂ Me	Br	0	H
Me	Me	H	H	I	I	1	H
Me	Me	H	H	CN	CF ₃	0	H
Me	Me	H	H	H	I	0	H
Me	Me	H	H	CO ₂ Me	CF ₃	1	H
Me	Me	H	H	CN	I	0	H
Me	Me	H	H	CO ₂ Me	Cl	0	H
Me	Me	H	H	Cl	Cl	1	H
Me	Me	H	H	Cl	I	0	H
Me	Me	H	H	CF ₃	CF ₃	0	H
Me	Me	H	H	CN	CN	1	H
Me	Me	H	H	Br	Cl	0	H
Me	Me	H	H	CN	F	0	H
Me	Me	H	H	Br	CF ₃	0	H
Me	Me	H	H	CN	F	1	H
Me	Me	H	H	H	Cl	0	H
Me	Me	H	H	H	Me	0	H
Me	Me	H	H	Cl	Cl	0	H
Me	Me	H	H	F	CF ₃	1	H
Me	Me	H	H	Br	Br	0	H
Me	Me	H	H	H	CN	1	H
Me	Me	H	H	Me	Br	0	H
Me	Me	H	H	Me	Cl	1	H
Me	Me	H	H	Cl	I	1	H
Me	Me	H	H	H	CF ₃	0	H
Me	Me	H	H	Me	CN	0	H
Me	Me	H	H	CO ₂ Me	Br	1	H
Me	Me	H	H	CF ₃	CF ₃	1	H
Me	Me	H	H	Cl	CF ₃	0	H

ES 2 333 977 T3

R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	m	Q
Me	Me	H	H	Cl	F	0	H
Me	Me	H	H	F	CF ₃	0	H
Me	Me	H	H	H	CN	0	H
Me	Me	H	H	H	CO ₂ Me	0	H

Tabla 2

La Tabla 2 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.1, en la que Q es -COCH₃ y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 2 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 2 Q es -COCH₃ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 2 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 2 Q es -COCH₃ en lugar de hidrógeno.

Tabla 3

La Tabla 3 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.1, en la que Q es -CHO y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 3 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 3 Q es -CHO en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 3 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 3 Q es -CHO en lugar de hidrógeno.

Tabla 4

La Tabla 4 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.1, en la que Q es -CO₂CH₃ y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 4 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 4 Q es -CO₂CH₃ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 4 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 4 Q es -CO₂CH₃ en lugar de hidrógeno.

Tabla 5

La Tabla 5 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.1, en la que Q es -CH₃ y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 5 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 5 Q es -CH₃ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 5 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 5 Q es -CH₃ en lugar de hidrógeno.

Tabla 7

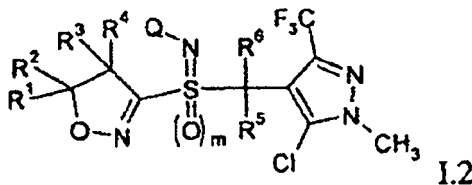
La Tabla 7 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.1, en la que Q es -NO₂ y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 7 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 7 Q es -NO₂ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 7 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 7 Q es -NO₂ en lugar de hidrógeno.

Tabla 8

La Tabla 8 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.1, en la que Q es -CO₂^tBu y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 8 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 8 Q es -CO₂^tBu en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 8 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 8 Q es -CO₂^tBu en lugar de hidrógeno.

Tabla 9

La Tabla 9 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.2, en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , m y Q tienen los valores listados en la Tabla 1.



Así, el compuesto 1 de la Tabla 9 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 9 Y es 5-cloro-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilo en lugar de 2,6-difluorofenilo. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 9 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 9 Y es 5-cloro-1-metil-3-trifluorometil-1 H-pirazol-4-ilo en lugar de 2,6-difluorofenilo.

Tabla 16

La Tabla 16 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.2, en la que Q es $-\text{COCH}_3$ y R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 16 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 9, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 16 Q es $-\text{COCH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 16 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 9, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 16 Q es $-\text{COCH}_3$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 23

La Tabla 23 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.2, en la que Q es $-\text{CHO}$ y R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 23 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 9, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 23 Q es $-\text{CHO}$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 23 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 9, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 23 Q es $-\text{CHO}$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 30

La Tabla 30 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.2, en la que Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ y R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 30 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 9, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 30 Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 30 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 9, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 30 Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 37

La Tabla 37 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.2, en la que Q es $-\text{CH}_3$ y R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 37 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 9, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 37 Q es $-\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 37 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 9, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 37 Q es $-\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 51

La Tabla 51 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.2, en la que Q es $-\text{NO}_2$ y R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 51 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 9, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 51 Q es $-\text{NO}_2$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 51 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 9, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 51 Q es $-\text{NO}_2$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 58

- La Tabla 58 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.2, en la que Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 58 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 9, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 58 Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 58 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 9, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 58 Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ en lugar de hidrógeno.
- Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R^1 y R^2 son ambos metilo.
- Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6, \text{m}, \text{n}$ e Y son como se definen anteriormente y Q es hidrógeno, formilo o acetilo, lo más preferiblemente hidrógeno.
- Un grupo adicional de compuestos muy especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que m es 1.
- Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R^5 y R^6 son cada uno independientemente del otro hidrógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o halógeno.
- Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R^5 y R^6 son cada uno independientemente del otro hidrógeno, fluoro, cloro, metilo, acetilo o metoxicarbonilo, preferiblemente hidrógeno, fluoro, cloro o metilo.
- Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^6, \text{Q}, \text{m}, \text{n}$ e Y son como se definen anteriormente y R^5 es hidrógeno.
- Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{Q}, \text{m}, \text{n}$ e Y son como se definen anteriormente y R^5 y R^6 son ambos hidrógeno.
- Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^6, \text{Q}, \text{m}, \text{n}$ e Y son como se definen anteriormente y R^5 es metoxicarbonilo.
- Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^6, \text{Q}, \text{m}, \text{n}$ e Y son como se definen anteriormente y R^5 es metilo.
- Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^6, \text{Q}, \text{m}, \text{n}$ e Y son como se definen anteriormente y R^5 es halógeno.
- Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{Q}, \text{m}, \text{n}$ e Y son como se definen anteriormente y R^5 y R^6 son ambos halógeno, preferiblemente seleccionados independientemente de cloro y flúor.
- Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^6, \text{Q}, \text{m}, \text{n}$ e Y son como se definen anteriormente y R^5 es flúor.
- Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{Q}, \text{m}, \text{n}$ e Y son como se definen anteriormente y R^5 y R^6 son ambos flúor.
- Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^6, \text{Q}, \text{m}, \text{n}$ e Y son como se definen anteriormente y R^5 es cloro.
- Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{Q}, \text{m}, \text{n}$ e Y son como se definen anteriormente y R^5 y R^6 son ambos cloro.
- Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{Q}, \text{m}, \text{n}$ e Y son como se definen anteriormente y R^5 es flúor y R^6 es cloro.
- Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es fenilo, que está opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alcoxi ($\text{C}_1\text{-C}_6$)-carbonilo, ciano, halógeno, alquil($\text{C}_1\text{-C}_6$)-tio, haloalquil($\text{C}_1\text{-C}_6$)-tio, alquil($\text{C}_1\text{-C}_6$)-sulfonilo, haloalquil($\text{C}_1\text{-C}_6$)-sulfonilo, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$ o fenilo.
- Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es fenilo opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de ciano, difluorometoxi, etoxicarbonilo, fluoro, metoxicarbonilo, metilo, metilsulfonilo fenilo, trifluorometoxi, trifluorometilo o trifluorometiltio.

ES 2 333 977 T3

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-bifenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-cloro-3-etoxicarbonil-6-metilsulfonilfenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-cianofenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-difluorometoxifenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2,3-difluorofenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2,4-difluorofenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2,5-difluorofenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2,6-difluorofenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 3,5-difluorofenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2,6-difluoro-3-tolilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 4-etoxicarbonil-2-fluorofenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 6-fluoro-4H-benzo[1,3]dioxin-8-ilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-fluoro-4-metoxicarbonilfenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-fluorofenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-fluoro-6-trifluorometilfenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es fenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-tolilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-trifluorometoxifenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-trifluorometilfenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-trifluorometiltio.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es un heterociclo de 5 a 10 miembros que contiene uno a tres átomos de nitrógeno, oxígeno o azufre, que está opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o halógeno.

Un grupo de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es pirazol-4-ilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 5-cloro-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 1-metil-3-difluorometil-1H-pirazol-4-ilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilo.

1.1) Los compuestos de fórmula I, en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, Q, n e Y son como se definen anteriormente y m es 0 ó 1, pueden prepararse mediante procedimientos conocidos de por sí, por ej. al hacer reaccionar un compuesto de fórmula Ia

en la que R⁵ y R⁶ son cada uno independientemente -CONR⁷R⁸, en donde R⁷ y R⁸ son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, fenilo o fenilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, nitro,

ciano o con halógeno, o R^7 y R^8 forman juntos un grupo alquileo C_3-C_8 que puede contener uno o más átomos de oxígeno o azufre o uno o más grupos amino o alquilamino, o

R^5 y R^6 son cada uno independientemente fenilo o naftilo, anillos que pueden estar sustituidos con alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , hidroxialquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , alquil(C_1-C_6)-carbonilo, alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, benciloxycarbonilo o benciloxycarbonilo sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, nitro, ciano, formilo, carboxilo, halógeno, azido, tiocianato, tri[alquil(C_1-C_6)]-sililo, mercapto, feniltio o feniltio sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, fenilsulfonilo o fenilsulfonilo sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, $-SF_5$, alquil(C_1-C_6)-tio, alquil(C_1-C_6)-sulfonilo, alquil(C_1-C_6)-sulfonilo, alquil(C_1-C_6)-SO(NH)-, alquil(C_1-C_6)-SO(NCH₃), haloalquil(C_1-C_6)-tio, haloalquil(C_1-C_6)-sulfonilo, haloalquil(C_1-C_6)-sulfonilo, bencilsulfonilo o bencilsulfonilo sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, fenilsulfonilo o fenilsulfonilo sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, hidroxilo, alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquil(C_1-C_6)-sulfonilo, haloalquil(C_1-C_6)-sulfonilo, fenoxi o fenoxi sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, benciloxi o benciloxi sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, $-CONH-SO_2$ -alquilo(C_1-C_6), $-CONH-SO_2$ -haloalquilo(C_1-C_6), $-NHCO$ -alquilo(C_1-C_6), $-NHCO$ -haloalquilo(C_1-C_6), $-NHCO_2$ -alquilo(C_1-C_6), $-NHCO_2$ -haloalquilo(C_1-C_6), $-OCO$ -alquilo(C_1-C_6), $-OCO$ -haloalquilo(C_1-C_6), $-OCO$ -fenilo o $-OCO$ -fenilo sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, $-OCONH$ -alquilo(C_1-C_6), $-OCONH$ -haloalquilo(C_1-C_6), $-OCONH$ -fenilo o $-OCONH$ -fenilo sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, carboxilo, nitro, ciano o con halógeno, o con $-CONR^7R^8$, en donde R^7 y R^8 son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , fenilo o fenilo sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , nitro, ciano o con halógeno, o R^7 y R^8 forman juntos un grupo alquileo C_3-C_8 que puede contener uno o más átomos de oxígeno o azufre o uno o más grupos amino o alquilamino, o

R^5 y R^6 son cada uno independientemente heterociclo de 5 a 10 miembros que contiene uno o más átomos de nitrógeno, oxígeno o azufre, heterociclo que puede estar benzocondensado, y heterociclo que puede estar sustituido con alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , hidroxialquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , alquil(C_1-C_6)-carbonilo, alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, benciloxycarbonilo, benciloxycarbonilo sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, feniltio, feniltio sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, fenilsulfonilo, fenilsulfonilo sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, nitro, ciano, formilo, carboxilo, halógeno, azido, tiocianato, tri(alquil(C_1-C_6))-sililo, mercapto, $-SF_5$, alquil(C_1-C_6)-tio, alquil(C_1-C_6)-sulfonilo, alquil(C_1-C_6)-sulfonilo, haloalquil(C_1-C_6)-tio, haloalquil(C_1-C_6)-sulfonilo, haloalquil(C_1-C_6)-sulfonilo, bencilsulfonilo o bencilsulfonilo sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, fenilsulfonilo o fenilsulfonilo sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, hidroxilo, alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquil(C_1-C_6)-sulfonilo, haloalquil(C_1-C_6)-sulfonilo, fenoxi o fenoxi sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, benciloxi o benciloxi sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, $-CONH-SO_2$ -alquilo(C_1-C_6), $-CONH-SO_2$ -haloalquilo(C_1-C_6), $-NHCO$ -alquilo(C_1-C_6), $-NHCO$ -haloalquilo(C_1-C_6), $-NHCO_2$ -alquilo(C_1-C_6), $-NHCO_2$ -haloalquilo(C_1-C_6), $-OCO$ -alquilo(C_1-C_6), $-OCO$ -haloalquilo(C_1-C_6), $-OCO$ -fenilo o $-OCO$ -fenilo sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, $-OCONH$ -alquilo(C_1-C_6), $-OCONH$ -haloalquilo(C_1-C_6), $-OCONH$ -fenilo o $-OCONH$ -fenilo sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, carboxilo, nitro, ciano o con halógeno o con $-CONR^7R^8$, en donde R^7 y R^8 son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , fenilo o fenilo sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , nitro, ciano o con halógeno, o R^7 y R^8 forman juntos un alquileo C_3-C_8 que puede contener uno o más átomos de oxígeno o azufre o uno o más grupos amino o alquilamino, o

R^5 y R^6 junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo de 3 a 10 miembros que puede contener uno o más átomos de nitrógeno, oxígeno y azufre y que puede estar sustituido con alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, alquil(C_1-C_6)-carbonilo, alquil(C_1-C_6)-sulfonilo, haloalquil(C_1-C_6)-sulfonilo, haloalquil(C_1-C_6)-carbonilo, alqueno C_1-C_6 , halógeno, ciano, nitro, fenilo o fenilo sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , nitro, ciano o con halógeno, fenilcarbonilo o fenilcarbonilo sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , nitro, ciano o con halógeno, o

R^5 y R^6 junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un grupo de la fórmula $C=CH_2$, $C=CH$ -alquilo (C_1-C_6), $C=C$ (halógeno)₂, $C=CH-N$ [alquilo(C_1-C_6)]₂, $C=CH-NH$ [alquilo(C_1-C_6)] o $C=CH$ -alcoxi(C_1-C_6);

m es 0 ó 1;

n es 0, 1 ó 2;

Q es hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, tri[alquil(C_1-C_6)]-siletiloxycarbonilo, haloalcoxi(C_1-C_6)-carbonilo, ciano, haloalquilo C_1-C_6 , hidroxialquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , alquil(C_1-C_6)-carbonilo, haloalquil(C_1-C_6)-carbonilo, cicloalquil(C_3-C_6)-carbonilo, fenilcarbonilo

ES 2 333 977 T3

o fenilcarbonilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, o

Q es bencilcarbonilo o bencilcarbonilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, o

Q es piridilcarbonilo o piridilcarbonilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, o

10 Q es fenoxicarbonilo o fenoxicarbonilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, o

Q es benciloxycarbonilo o benciloxycarbonilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, o

Q es nitro, formilo, tri[alquil(C₁-C₆)]-sililo, alquil(C₁-C₆)-carbonil-alquilo(C₁-C₂), alcoxi(C₁-C₆)-carbonil-alquilo(C₁-C₂), ciano-alquilo(C₁-C₂), alquil(C₁-C₆)-aminocarbonil-alquilo(C₁-C₂), di-alquil(C₁-C₆)-aminocarbonil-alquilo(C₁-C₂), alcoxi(C₁-C₆)-alquilo(C₁-C₂), alquil(C₁-C₂)-P(O)[O-alquilo(C₁-C₆)]₂, alquil(C₁-C₂)-NO₂, alquil(C₁-C₆)-tioalquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquil(C₁-C₆)-sulfínilo, alquil(C₁-C₆)-sulfínil-alquilo(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquil(C₁-C₆)-sulfonilo, alquil(C₁-C₆)-sulfonil-alquilo(C₁-C₆), bencilsulfonilo o bencilsulfonilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, o

Q es fenilsulfonilo o fenilsulfonilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, o

Q es fenilsulfonilo o fenilsulfonilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, o

30 Q es bencilo o bencilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, o

Q es -CONH-SO₂-alquilo(C₁-C₆) o -CONH-SO₂-haloalquilo(C₁-C₆), o Q es -CONR⁷R⁸, en donde R⁷ y R⁸ son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, fenilo o fenilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, nitro, ciano o con halógeno, o R⁷ y R⁸ forman juntos un grupo alquilenos C₃-C₈ que puede contener uno o más átomos de oxígeno o azufre o uno o más grupos amino o alquilamino, o

Q es fenilo o naftilo, anillos que pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, hidroxialquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquil(C₁-C₆)-carbonilo, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, benciloxicarbonilo o benciloxicarbonilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, nitro, ciano, formilo, carboxilo, halógeno, azido, tiocianato, tri[alquil(C₁-C₆)]-sililo, mercapto, feniltio o feniltio sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, fenilsulfino o fenilsulfino sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, -SF₅, alquil(C₁-C₆)-tio, alquil(C₁-C₆)-sulfino, alquil(C₁-C₆)-sulfo-
nilo, alquil(C₁-C₆)-SO(NH)-, alquil(C₁-C₆)-SO(NCH₃), haloalquil(C₁-C₆)-tio, haloalquil(C₁-C₆)-sulfino, haloalquil
(C₁-C₆)-sulfonilo, bencilsulfonilo o bencilsulfonilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, fenilsulfonilo o fenilsulfonilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, hidroxilo, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil(C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquil(C₁-C₆)-sulfonilo, fenoxi o fenoxi sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbo-
nilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, benciloxi o benciloxi sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, -CONH-SO₂-alquilo(C₁-C₆), -CONH-SO₂-haloalquilo
(C₁-C₆), -NHCO-alquilo(C₁-C₆), -NHCO-haloalquilo(C₁-C₆), -NHCO₂-alquilo(C₁-C₆), -NHCO₂-haloalquilo(C₁-C₆),
-OCO-alquilo(C₁-C₆), -OCO-haloalquilo(C₁-C₆), -OCO-fenilo o -OCO-fenilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alco-
xi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, -OCONH-alquilo(C₁-C₆), -OCONH-haloalquilo
(C₁-C₆), -OCONH-fenilo o -OCONH-fenilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, carboxilo, ni-
tro, ciano o con halógeno, o con -CONR⁷R⁸, en donde R⁷ y R⁸ son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo
C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, fenilo o fenilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, nitro, ciano o con haló-
geno, o R⁷ y R⁸ forman juntos un grupo alqueno C₃-C₈ que puede contener uno o más átomos de oxígeno o azufre o
uno o más grupos amino o alquilamino, o

Q es un heterociclo de 3 a 10 miembros que contiene uno o más átomos de nitrógeno, oxígeno o azufre, heterociclo que puede estar benzocondensado, y heterociclo que puede estar sustituido con alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, hidroxialquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquil(C₁-C₆)-carbonilo, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, benciloxycarbonilo, benciloxycarbonilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, feniltio, feniltio sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, fenilsulfínico, fenilsulfínico sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, nitro, ciano, formilo, carboxilo, halógeno, azido, tiocianato, tri[alquil(C₁-C₆)]-sililo, mercapto, -SF₅, alquil(C₁-C₆)-tio, alquil(C₁-C₆)-sulfínico, alquil(C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquil(C₁-C₆)-tio, haloalquil(C₁-C₆)-sulfínico, haloalquil(C₁-C₆)-sulfonilo, bencilsulfonilo o bencil-

sulfonilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, fenilsulfonilo o fenilsulfonilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, hidroxilo, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil(C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquil(C₁-C₆)-sulfonilo, fenoxi o fenoxi sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, benciloxi o benciloxi sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, -CONH-SO₂-alquilo(C₁-C₆), -CONH-SO₂-haloalquilo(C₁-C₆), -NHCO-alquilo(C₁-C₆), -NHCO-haloalquilo(C₁-C₆), -NHC(=O)-alquilo(C₁-C₆), -NHC(=O)-haloalquilo(C₁-C₆), -OCO-alquilo(C₁-C₆), -OCO-haloalquilo(C₁-C₆), -OCO-fenilo o -OCO-fenilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, -OCONH-alquilo(C₁-C₆), -OCONH-haloalquilo(C₁-C₆), -OCONH-fenilo o -OCONH-fenilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, carboxilo, nitro, ciano o con halógeno, o con -CONR⁷R⁸, en donde R⁷ y R⁸ son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, fenilo o fenilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, nitro, ciano o con halógeno, o R⁷ y R⁸ forman juntos un grupo alquilenilo C₃-C₈ que puede contener uno o más átomos de oxígeno o azufre o uno o más grupos amino o alquilamino; e

Y es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquilenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilenilo C₂-C₆, alquil(C₁-C₆)-carbonilo, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, hidroxilo, carboxilo, halógeno, azido, tiocianato, tri[alquil(C₁-C₆)]-sililo, alquil(C₁-C₆)-tio, alquil(C₁-C₆)-sulfinilo, alquil(C₁-C₆)-sulfonilo, bencil-sulfonilo o bencilsulfonilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, carboxilo, nitro, ciano o con halógeno, o

Y es fenilsulfonilo o fenilsulfonilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, carboxilo, nitro, ciano o con halógeno, o

Y es alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil(C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquil(C₁-C₆)-sulfonilo, fenoxi o fenoxi sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, carboxilo, nitro, ciano o con halógeno, o

Y es benciloxi o benciloxi sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, carboxilo, nitro, ciano o con halógeno, o

Y es -CONH-SO₂-alquilo(C₁-C₆) o -CONH-SO₂-haloalquilo(C₁-C₆), o

Y es fenilo, naftilo o tetrahidronaftilo, anillos que pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, hidroxialquilo C₁-C₆, alquilenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilenilo C₂-C₆, alquil(C₁-C₆)-carbonilo, haloalquil(C₁-C₆)-carbonilo, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, benciloxicarbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo, halógeno, azido, tiocianato, tri[alquil(C₁-C₆)]-sililo, mercapto, feniltio, fenilsulfinilo, -SF₅, alquil(C₁-C₆)-tio, haloalquil(C₁-C₆)-tio, haloalquil(C₁-C₆)-sulfinilo, haloalquil(C₁-C₆)-sulfonilo, alquil(C₁-C₆)-sulfinilo, alquil(C₁-C₆)-sulfonilo, bencilsulfonilo o bencilsulfonilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, fenilsulfonilo o fenilsulfonilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, hidroxilo, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil(C₁-C₆)-sulfonilo, alquil(C₁-C₆)-sulfonilo, fenoxi o fenoxi sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, benciloxi o benciloxi sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, -CONH-SO₂-alquilo(C₁-C₆), -CONH-SO₂-haloalquilo(C₁-C₆), -NHCO-alquilo(C₁-C₆), -NHCO-haloalquilo(C₁-C₆), -NHC(=O)-alquilo(C₁-C₆), -NHC(=O)-haloalquilo(C₁-C₆), -OCO-alquilo(C₁-C₆), -OCO-haloalquilo(C₁-C₆), -OCO-fenilo o -OCO-fenilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, -OCONH-alquilo(C₁-C₆), -OCONH-haloalquilo(C₁-C₆), -OCONH-fenilo o -OCONH-fenilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, carboxilo, nitro, ciano o con halógeno, o con -CONR⁷R⁸, en donde R⁷ y R⁸ son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, fenilo o fenilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, nitro, ciano o con halógeno, o R⁷ y R⁸ forman un grupo alquilenilo C₃-C₈ que puede contener uno o más átomos de oxígeno o azufre o uno o más grupos amino o alquilamino, o

Y es un heterociclo de 5 a 10 miembros que contiene uno o más átomos de nitrógeno, oxígeno o azufre, heterociclo que puede estar benzocondensado, y heterociclo que puede estar sustituido con alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, hidroxialquilo C₁-C₆, alquilenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilenilo C₂-C₆, alquil(C₁-C₆)-carbonilo, haloalquil(C₁-C₆)-carbonilo, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo, halógeno, azido, tiocianato, tri[alquil(C₁-C₆)]-sililo, mercapto, -SF₅, alquil(C₁-C₆)-tio, alquil(C₁-C₆)-sulfinilo, alquil(C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquil(C₁-C₆)-tio, haloalquil(C₁-C₆)-sulfinilo, haloalquil(C₁-C₆)-sulfonilo, bencilsulfonilo o bencilsulfonilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, fenilsulfonilo o fenilsulfonilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, hidroxilo, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil(C₁-C₆)-sulfonilo, alquil(C₁-C₆)-sulfonilo, fenoxi o fenoxi sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, benciloxi o benciloxi sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, -CONH-SO₂-alquilo(C₁-C₆), -CONH-SO₂-haloalquilo(C₁-C₆), -NHCO-alquilo(C₁-C₆), -NHCO-haloalquilo(C₁-C₆), -NHC(=O)-alquilo(C₁-C₆), -NHC(=O)-haloalquilo(C₁-C₆), -OCO-alquilo(C₁-C₆), -OCO-haloalquilo(C₁-C₆), -OCO-fenilo o -OCO-fenilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, nitro, ciano, formilo, carboxilo o con halógeno, -OCONH-alquilo(C₁-C₆), -OCONH-haloalquilo(C₁-C₆), -OCONH-fenilo o -OCONH-fenilo sustituido con haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, carboxilo, nitro, ciano o con halógeno, o

con $-\text{CONR}^7\text{R}^8$, en donde R^7 y R^8 son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, fenilo o fenilo sustituido con haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, nitro, ciano o con halógeno, o R^7 y R^8 forman juntos un grupo alquilenos $\text{C}_3\text{-C}_8$ que puede contener uno o más átomos de oxígeno o azufre o uno o más grupos amino o alquilamino,

y N-óxidos, sales e isómeros ópticos de compuestos de fórmula I.

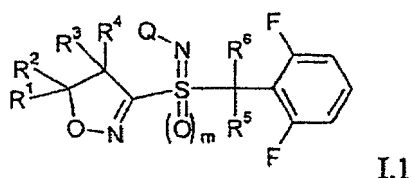
Los radicales alquilo y alcoxi que aparecen en las definiciones de sustituyentes anteriores son, por ejemplo, metilo, metoxi, etilo, etoxi, propilo, propoxi, butilo, butoxi, hexilo, hexiloxi, nonilo, noniloxi y decilo y deciloxi también sus isómeros ramificados. Radicales alquilenos y alquilenos adecuados se derivan de los radicales alquilo mencionados. Los radicales cicloalquilo son generalmente ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo y ciclooctilo. Los radicales cicloalquilo pueden estar en forma bi- o tri-cíclica. Los radicales fenilo pueden estar en forma sustituida. Por ejemplo, Y puede ser un radical fenilo que puede estar sustituido, por ejemplo, con alcoxi o con alcoxi sustituido con halógeno, etc. Los anillos de 3 a 10 miembros que pueden estar presentes como sustituyentes en los compuestos de acuerdo con la invención incluyen anillos aromáticos y no aromáticos tanto carbocíclicos como heterocíclicos. Tales anillos pueden estar en la forma de anillos simples o en la forma de anillos policíclicos. Pueden tener sustituyentes adicionales y/o estar benzocondensados. Pueden mencionarse, a modo de ejemplo, fenilo, naftilo, antrilo, indenilo y fenantrenilo, los radicales cicloalquilo mencionados anteriormente, y también anillos que contienen átomos de oxígeno, azufre o nitrógeno, tales como 1,3-dioxalanilo, dihidro-1,3-dioxolilo, tetrahidrofurano y morfolino, también furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, dihidroisoxazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, tetrazolilo, tetrazinilo, benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo, indolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazolilo, quinolilo, isoquinolilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizininilo.

La invención incluye además N-óxidos de los compuestos de fórmula I.

La invención incluye además los isómeros ópticos de los compuestos de fórmula I, especialmente aquellos que tienen un átomo de carbono quiral en el grupo $-\text{CR}^5\text{R}^6$ - y el grupo $-\text{S}(\text{O})_m\text{NQ}$.

TABLA 1

Compuestos de fórmula I.1



I.1

R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	m	Q
Me	Me	H	H	Br	CF_3	1	H
Me	Me	H	H	CO_2Me	F	0	H
Me	Me	H	H	CN	I	1	H
Me	Me	H	H	Br	I	0	H
CH_2Cl	Me	H	H	Me	I	1	H
CH_2Cl	Me	H	H	CN	CO_2Me	1	H

ES 2 333 977 T3

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	m	Q
CH ₂ Cl	Me	H	H	H	I	0	H
Me	Me	H	H	Br	Cl	1	H
Me	Me	H	H	CN	Br	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CO ₂ Me	Br	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CN	F	1	H
Me	Me	H	H	CO ₂ Me	I	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	F	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Br	Br	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	H	CO ₂ Me	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	H	Br	1	H
Me	Me	H	H	H	Br	1	H
Me	Me	H	H	Br	Br	1	H
Me	Me	H	H	H	CF ₃	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	H	H	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CO ₂ Me	I	0	H
Me	Me	H	H	Me	I	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	F	CF ₃	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CO ₂ Me	F	1	H
Me	Me	H	H	I	I	0	H
Me	Me	H	H	Me	Br	1	H
Me	Me	H	H	I	CF ₃	0	H
Me	Me	H	H	H	Br	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	H	Br	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	CF ₃	1	H
Me	Me	H	H	Br	F	0	H
Me	Me	H	H	F	I	1	H
Me	Me	H	H	Br	F	1	H
Me	Me	H	H	H	H	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CN	CF ₃	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CO ₂ Me	Cl	1	H
Me	Me	H	H	CO ₂ Me	I	1	H
Me	Me	H	H	H	H	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	F	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	I	I	1	H
Me	Me	H	H	Me	CF ₃	0	H

ES 2 333 977 T3

R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	m	Q
Me	Me	H	H	F	F	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Br	CF ₃	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	CN	0	H
Me	Me	H	H	Me	I	1	H
Me	Me	H	H	CO ₂ Me	F	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	Cl	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CN	CN	1	H
Me	Me	H	H	Me	CF ₃	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Br	Cl	1	H
Me	Me	H	H	H	Me	1	H
Me	Me	H	H	CN	CO ₂ Me	1	H
Me	Me	H	H	CN	CN	0	H
Me	Me	H	H	F	F	0	H
Me	Me	H	H	CO ₂ Me	Cl	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Br	I	1	H
Me	Me	H	H	Me	CO ₂ Me	1	H
Me	Me	H	H	H	Cl	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Cl	F	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CN	CF ₃	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Cl	I	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	F	I	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	H	CN	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	Br	0	H
Me	Me	H	H	Cl	F	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	CO ₂ Me	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	Cl	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CO ₂ Me	CF ₃	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	CF ₃	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CN	Cl	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	I	CF ₃	1	H
Me	Me	H	H	H	CO ₂ Me	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Cl	Cl	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CO ₂ Me	Cl	0	H
Me	Me	H	H	H	F	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	F	F	1	H

ES 2 333 977 T3

R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	m	Q
CH ₂ Cl	Me	H	H	Br	F	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Br	CF ₃	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CF ₃	CF ₃	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CN	Br	0	H
Me	Me	H	H	H	I	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CN	I	0	H
Me	Me	H	H	Me	F	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Cl	CF ₃	0	H
Me	Me	H	H	Br	I	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Br	Cl	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CN	CN	0	H
Me	Me	H	H	Cl	CF ₃	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Cl	I	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CN	I	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	I	I	0	H
Me	Me	H	H	Me	Me	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	Me	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	H	Me	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	H	CO ₂ Me	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Br	F	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CN	Br	1	H
Me	Me	H	H	Me	F	0	H
Me	Me	H	H	CN	Br	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CO ₂ Me	CF ₃	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	I	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CN	Cl	1	H
Me	Me	H	H	F	I	0	H
Me	Me	H	H	CN	Cl	1	H
Me	Me	H	H	H	F	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CO ₂ Me	Br	1	H

ES 2 333 977 T3

R¹	R²	R³	R⁴	R⁵	R⁶	m	Q
Me	Me	H	H	I	CF ₃	1	H
Me	Me	H	H	Me	Me	0	H
Me	Me	H	H	Me	CO ₂ Me	1	H
Me	Me	H	H	CN	CF ₃	1	H
Me	Me	H	H	CO ₂ Me	CF ₃	0	H
Me	Me	H	H	CN	Cl	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CO ₂ Me	I	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CN	F	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	F	F	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	H	I	1	H
Me	Me	H	H	Me	CN	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Cl	Cl	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Cl	F	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	H	F	1	H
Me	Me	H	H	CN	CO ₂ Me	0	H
Me	Me	H	H	Me	Cl	0	H
Me	Me	H	H	CO ₂ Me	Br	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	H	CF ₃	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	CN	1	H
Me	Me	H	H	I	I	1	H
Me	Me	H	H	CN	CF ₃	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Br	Br	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Cl	CF ₃	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	F	I	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	H	CN	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	H	CF ₃	1	H
Me	Me	H	H	H	I	0	H

ES 2 333 977 T3

R¹	R²	R³	R⁴	R⁵	R⁶	m	Q
Me	Me	H	H	CO ₂ Me	CF ₃	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CO ₂ Me	F	0	H
Me	Me	H	H	CN	I	0	H
Me	Me	H	H	CO ₂ Me	Cl	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	H	F	0	H
Me	Me	H	H	Cl	Cl	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	I	CF ₃	0	H
Me	Me	H	H	Cl	I	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	F	CF ₃	0	H
Me	Me	H	H	CF ₃	CF ₃	0	H
Me	Me	H	H	CN	CN	1	H
Me	Me	H	H	Br	Cl	0	H
Me	Me	H	H	CN	F	0	H
Me	Me	H	H	Br	CF ₃	0	H
Me	Me	H	H	CN	F	1	H
Me	Me	H	H	H	Cl	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	H	Cl	1	H
Me	Me	H	H	H	Me	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	Me	1	H
Me	Me	H	H	Cl	Cl	0	H
Me	Me	H	H	F	CF ₃	1	H
Me	Me	H	H	Br	Br	0	H
Me	Me	H	H	H	CN	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	H	H	0	H
Me	Me	H	H	Me	Br	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CF ₃	CF ₃	1	H
Me	Me	H	H	Me	Cl	1	H

R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	m	Q
CH ₂ Cl	Me	H	H	Br	I	0	H
Me	Me	H	H	Cl	I	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	CO ₂ Me	0	H
Me	Me	H	H	H	CF ₃	0	H
Me	Me	H	H	Me	CN	0	H
Me	Me	H	H	CO ₂ Me	Br	1	H
Me	Me	H	H	CF ₃	CF ₃	1	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	H	Cl	0	H
Me	Me	H	H	Cl	CF ₃	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	H	Me	0	H
Me	Me	H	H	Cl	F	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	CN	CO ₂ Me	0	H
Me	Me	H	H	F	CF ₃	0	H
Me	Me	H	H	H	CN	0	H
Me	Me	H	H	H	CO ₂ Me	0	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	Br	1	H

Tabla 2

La Tabla 2 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.1, en la que Q es -COCH₃ y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 2 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 2 Q es -COCH₃ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 2 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 2 Q es -COCH₃ en lugar de hidrógeno.

Tabla 3

La Tabla 3 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.1, en la que Q es -CHO y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 3 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 3 Q es -CHO en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 3 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 3 Q es -CHO en lugar de hidrógeno.

Tabla 4

La Tabla 4 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.1, en la que Q es -CO₂CH₃ y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 4 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 4 Q es -CO₂CH₃ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 4 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 4 Q es -CO₂CH₃ en lugar de hidrógeno.

Tabla 5

La Tabla 5 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.1, en la que Q es -CH₃ y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 5 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 5 Q es -CH₃ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 5 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 5 Q es -CH₃ en lugar de hidrógeno.

Tabla 6

La Tabla 6 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.1, en la que Q es -CN y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 6 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 6 Q es -CN en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 6 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 6 Q es -CN en lugar de hidrógeno.

Tabla 7

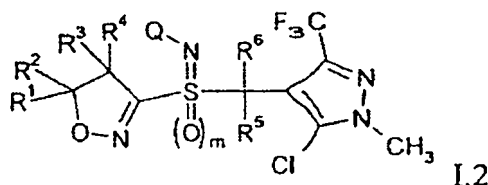
La Tabla 7 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.1, en la que Q es -NO₂ y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 7 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 7 Q es -NO₂ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 7 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 7 Q es NO₂ en lugar de hidrógeno.

Tabla 8

La Tabla 8 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.1, en la que Q es -CO₂^tBu y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 8 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 8 Q es -CO₂^tBu en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 8 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 8 Q es -CO₂^tBu en lugar de hidrógeno.

Tabla 9

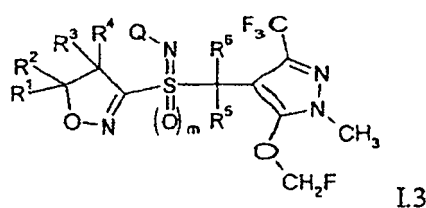
La Tabla 9 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.2, en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, m y Q tienen los valores listados en la Tabla 1.



Así, el compuesto 1 de la Tabla 9 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 9 Y es 5-cloro-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilo en lugar de 2,6-difluorofenilo. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 9 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 9 Y es 5-cloro-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilo en lugar de 2,6-difluorofenilo.

Tabla 10

La Tabla 10 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.3, en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, m y Q tienen los valores listados en la Tabla 1.



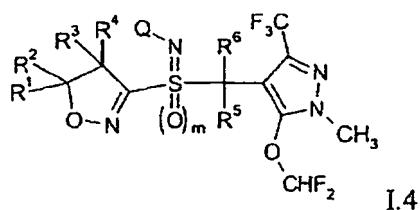
Así, el compuesto 1 de la Tabla 10 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 10 Y es 5-fluorometoxi-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilo en lugar de 2,6-difluorofenilo. De forma

ES 2 333 977 T3

similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 10 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 10 Y es 5-fluorometoxi-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilo en lugar de 2,6-difluorofenilo.

Tabla 11

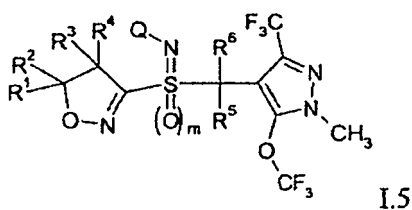
La Tabla 11 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.4, en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , m y Q tienen los valores listados en la Tabla 1.



Así, el compuesto 1 de la Tabla 11 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 11 Y es 5-difluorometoxi-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilo en lugar de 2,6-difluorofenilo. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 11 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 11 Y es 5-difluorometoxi-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilo en lugar de 2,6-difluorofenilo.

Tabla 12

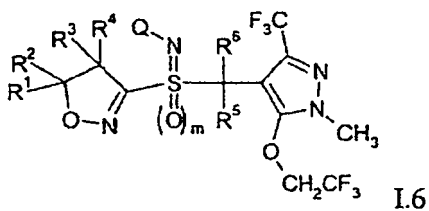
La Tabla 12 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.5, en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , m y Q tienen los valores listados en la Tabla 1.



Así, el compuesto 1 de la Tabla 12 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 12 Y es 1-metil-5-trifluorometoxi-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilo en lugar de 2,6-difluorofenilo. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 12 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 12 Y es 1-metil-5-trifluorometoxi-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilo en lugar de 2,6-difluorofenilo.

Tabla 13

La Tabla 13 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.6, en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , m y Q tienen los valores listados en la Tabla 1.

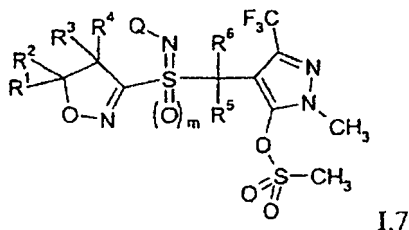


Así, el compuesto 1 de la Tabla 13 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 13 Y es 1-metil-5-(2,2,2-trifluoroetoxi)-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilo en lugar de 2,6-difluorofenilo. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 13 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 13 Y es 1-metil-5-(2,2,2-trifluoroetoxi)-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilo en lugar de 2,6-difluorofenilo.

ES 2 333 977 T3

Tabla 14

La Tabla 14 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.7, en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , m y Q tienen los valores listados en la Tabla 1.

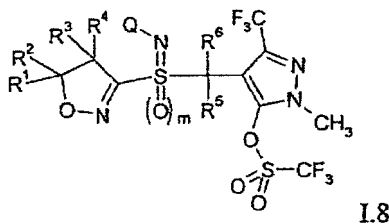


1.7

Así, el compuesto 1 de la Tabla 14 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 14 Y es 1-metil-5-metilsulfoniloxi-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilo en lugar de 2,6-difluorofenilo. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 14 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 14 Y es 1-metil-5-metilsulfoniloxi-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilo en lugar de 2,6-difluorofenilo.

Tabla 15

La Tabla 15 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.8, en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , m y Q tienen los valores listados en la Tabla 1.



1.8

Así, el compuesto 1 de la Tabla 15 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 1, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 15 Y es 1-metil-3-trifluorometil-5-trifluorometilsulfoniloxi-1H-pirazol-4-ilo en lugar de 2,6-difluorofenilo. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 15 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 15 Y es 1-metil-3-trifluorometil-5-trifluorometilsulfoniloxi-1H-pirazol-4-ilo en lugar de 2,6-difluorofenilo.

Tabla 16

La Tabla 16 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.2, en la que Q es $-\text{COCH}_3$ y R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 16 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 9, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 16 Q es $-\text{COCH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 16 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 9, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 16 Q es $-\text{COCH}_3$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 17

La Tabla 17 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.3, en la que Q es $-\text{COCH}_3$ y R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 17 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 10, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 17 Q es $-\text{COCH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 17 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 10, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 17 Q es $-\text{COCH}_3$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 18

La Tabla 18 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.4, en la que Q es $-\text{COCH}_3$ y R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 18 es igual que el compuesto 1 de la

ES 2 333 977 T3

Tabla 11, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 18 Q es $-\text{COCH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 18 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 11, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 18 Q es $-\text{COCH}_3$ en lugar de hidrógeno.

5 Tabla 19

La Tabla 19 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.5, en la que Q es $-\text{COCH}_3$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 19 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 12, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 19 Q es $-\text{COCH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 19 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 12, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 19 Q es $-\text{COCH}_3$ en lugar de hidrógeno.

15 Tabla 20

La Tabla 20 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.6, en la que Q es $-\text{COCH}_3$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 20 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 13, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 20 Q es $-\text{COCH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 20 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 13, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 20 Q es $-\text{COCH}_3$ en lugar de hidrógeno.

25 Tabla 21

La Tabla 21 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.7, en la que Q es $-\text{COCH}_3$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 21 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 14, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 21 Q es $-\text{COCH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 21 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 14, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 21 Q es $-\text{COCH}_3$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 22

La Tabla 22 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.8, en la que Q es $-\text{COCH}_3$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 22 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 15, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 22 Q es $-\text{COCH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 22 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 15, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 22 Q es $-\text{COCH}_3$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 23

La Tabla 23 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.2, en la que Q es $-\text{CHO}$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 23 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 9, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 23 Q es $-\text{CHO}$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 23 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 9, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 23 Q es $-\text{CHO}$ en lugar de hidrógeno.

50 Tabla 24

La Tabla 24 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.3, en la que Q es $-\text{CHO}$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 24 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 10, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 24 Q es $-\text{CHO}$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 24 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 10, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 24 Q es $-\text{CHO}$ en lugar de hidrógeno.

60 Tabla 25

La Tabla 25 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.4, en la que Q es $-\text{CHO}$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 25 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 11, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 25 Q es $-\text{CHO}$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 25 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 11, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 25 Q es $-\text{CHO}$ en lugar de hidrógeno.

ES 2 333 977 T3

Tabla 26

La Tabla 26 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.5, en la que Q es -CHO y $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 26 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 12, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 26 Q es -CHO en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 26 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 12, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 26 Q es -CHO en lugar de hidrógeno.

Tabla 27

La Tabla 27 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.6, en la que Q es -CHO y $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 27 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 13, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 27 Q es -CHO en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 27 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 13, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 27 Q es -CHO en lugar de hidrógeno.

Tabla 28

La Tabla 28 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.7, en la que Q es -CHO y $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 28 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 14, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 28 Q es -CHO en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 28 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 14, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 28 Q es -CHO en lugar de hidrógeno.

Tabla 29

La Tabla 29 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.8, en la que Q es -CHO y $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 29 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 15, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 29 Q es -CHO en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 29 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 15, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 29 Q es -CHO en lugar de hidrógeno.

Tabla 30

La Tabla 30 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.2, en la que Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ y $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 30 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 9, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 30 Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 30 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 9, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 30 Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 31

La Tabla 31 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.3, en la que Q es $-\text{COO}_2\text{H}_3$, y $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 31 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 10, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 31 Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 31 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 10, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 31 Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 32

La Tabla 32 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.4, en la que Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ y $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 32 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 11, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 32 Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 32 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 11, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 32 Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 33

La Tabla 33 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.5, en la que Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ y $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 33 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 12, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 33 Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los

ES 2 333 977 T3

compuestos 2 a 176 de la Tabla 33 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 12, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 33 Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno.

5 Tabla 34

La Tabla 34 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.6, en la que Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 34 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 13, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 34 Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los
10 compuestos 2 a 176 de la Tabla 34 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 13, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 34 Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 35

15 La Tabla 35 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.7, en la que Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 35 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 14, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 35 Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 35 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 14, respectivamente, excepto
20 que en los compuestos de la Tabla 35 Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 36

25 La Tabla 36 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.8, en la que Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 36 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 15, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 36 Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 36 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 15, respectivamente, excepto
30 que en los compuestos de la Tabla 36 Q es $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 37

35 La Tabla 37 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.2, en la que Q es $-\text{CH}_3$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 37 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 9, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 37 Q es $-\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 37 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 9, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 37 Q es $-\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno.

40 Tabla 38

La Tabla 38 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.3, en la que Q es $-\text{CH}_3$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 38 es igual que el compuesto 1 de la Tabla
45 10, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 38 Q es $-\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 38 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 10, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 38 Q es $-\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno.

50 Tabla 39

La Tabla 39 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.4, en la que Q es $-\text{CH}_3$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 39 es igual que el compuesto 1 de la Tabla
55 11, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 39 Q es $-\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 39 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 11, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 39 Q es $-\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 40

60 La Tabla 40 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.5, en la que Q es $-\text{CH}_3$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 40 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 12, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 40 Q es $-\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 40 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 12, respectivamente, excepto que en los
65 compuestos de la Tabla 40 Q es $-\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno.

ES 2 333 977 T3

Tabla 41

La Tabla 41 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.6, en la que Q es $-\text{CH}_3$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 41 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 13, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 41 Q es $-\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 41 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 13, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 41 Q es $-\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 42

La Tabla 42 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.7, en la que Q es $-\text{CH}_3$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 42 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 14, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 42 Q es $-\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 42 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 14, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 42 Q es $-\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 43

La Tabla 43 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.8, en la que Q es $-\text{CH}_3$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 43 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 15, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 43 Q es $-\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 43 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 15, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 43 Q es $-\text{CH}_3$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 44

La Tabla 44 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.2, en la que Q es $-\text{CN}$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 44 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 9, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 44 Q es $-\text{CN}$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 44 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 9, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 44 Q es $-\text{CN}$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 45

La Tabla 45 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.3, en la que Q es $-\text{CN}$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 45 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 10, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 45 Q es $-\text{CN}$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 45 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 10, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 45 Q es $-\text{CN}$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 46

La Tabla 46 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.4, en la que Q es $-\text{CN}$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 46 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 11, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 46 Q es $-\text{CN}$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 46 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 11, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 46 Q es $-\text{CN}$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 47

La Tabla 47 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.5, en la que Q es $-\text{CN}$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 47 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 12, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 47 Q es $-\text{CN}$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 47 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 12, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 47 Q es $-\text{CN}$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 48

La Tabla 48 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.6, en la que Q es $-\text{CN}$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 48 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 13, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 48 Q es $-\text{CN}$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos

ES 2 333 977 T3

2 a 176 de la Tabla 48 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 13, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 48 Q es -CN en lugar de hidrógeno.

5 Tabla 49

La Tabla 49 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.7, en la que Q es -CN y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 49 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 14, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 49 Q es -CN en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos
10 2 a 176 de la Tabla 49 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 14, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 49 Q es -CN en lugar de hidrógeno.

Tabla 50

15 La Tabla 50 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.8, en la que Q es -CN y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 50 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 15, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 50 Q es -CN en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos
20 2 a 176 de la Tabla 50 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 15, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 50 Q es -CN en lugar de hidrógeno.

Tabla 51

25 La Tabla 51 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.2, en la que Q es -NO₂ y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 51 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 9, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 51 Q es -NO₂ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos
30 2 a 176 de la Tabla 51 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 9, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 51 Q es -NO₂ en lugar de hidrógeno.

Tabla 52

35 La Tabla 52 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.3, en la que Q es -NO₂ y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 52 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 10, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 52 Q es -NO₂ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos
40 2 a 176 de la Tabla 52 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 10, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 52 Q es -NO₂ en lugar de hidrógeno.

40 Tabla 53

La Tabla 53 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.4, en la que Q es -NO₂ y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 53 es igual que el compuesto 1 de la Tabla
45 11, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 53 Q es -NO₂ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 53 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 11, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 53 Q es -NO₂ en lugar de hidrógeno.

50 Tabla 54

La Tabla 54 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.5, en la que Q es -NO₂ y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 54 es igual que el compuesto 1 de la Tabla
55 12, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 54 Q es -NO₂ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 54 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 12, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 54 Q es -NO₂ en lugar de hidrógeno.

Tabla 55

60 La Tabla 55 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.6, en la que Q es -NO₂ y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 55 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 13, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 55 Q es -NO₂ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos
65 2 a 176 de la Tabla 55 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 13, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 55 Q es -NO₂ en lugar de hidrógeno.

ES 2 333 977 T3

Tabla 56

La Tabla 56 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.7, en la que Q es $-\text{NO}_2$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 56 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 14, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 56 Q es $-\text{NO}_2$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 56 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 14, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 56 Q es $-\text{NO}_2$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 57

La Tabla 57 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.8, en la que Q es $-\text{NO}_2$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 57 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 15, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 57 Q es $-\text{NO}_2$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 57 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 15, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 57 Q es $-\text{NO}_2$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 58

La Tabla 58 consiste en 176 compuestos de fórmula general I.2, en la que Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 58 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 9, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 58 Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 58 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 9, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 58 Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 59

La Tabla 59 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.3, en la que Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 59 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 10, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 59 Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 59 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 10, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 59 Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 60

La Tabla 60 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.4, en la que Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 60 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 11, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 60 Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 60 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 11, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 60 Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 61

La Tabla 61 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.5, en la que Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 61 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 12, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 61 Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 61 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 12, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 61 Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 62

La Tabla 62 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.6, en la que Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 62 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 13, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 62 Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 62 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 13, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 62 Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ en lugar de hidrógeno.

Tabla 63

La Tabla 63 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.7, en la que Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 63 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 14, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 63 Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los

ES 2 333 977 T3

compuestos 2 a 176 de la Tabla 63 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 14, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 63 Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ en lugar de hidrógeno.

5 Tabla 64

La Tabla 64 consiste en 176 compuestos de fórmula general 1.8, en la que Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ y $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ y m tienen los valores listados en la Tabla 1. Así, el compuesto 1 de la Tabla 64 es igual que el compuesto 1 de la Tabla 15, excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 64 Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ en lugar de hidrógeno. De forma similar, los compuestos 2 a 176 de la Tabla 64 son iguales que los compuestos 2 a 176 de la Tabla 15, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 64 Q es $-\text{CO}_2^t\text{Bu}$ en lugar de hidrógeno.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que

15 R^1 y R^2 son ambos alquilo $\text{C}_1\text{-C}_{10}$;

R^3 y R^4 son ambos hidrógeno;

20 R^5 y R^6 son cada uno independientemente del otro hidrógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alcoxi($\text{C}_1\text{-C}_6$)-carbonilo o halógeno; m es 0 ó 1;

n es 1;

25 Q es hidrógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alcoxi($\text{C}_1\text{-C}_6$)-carbonilo, haloalcoxi($\text{C}_1\text{-C}_6$)-carbonilo, alquil($\text{C}_1\text{-C}_6$)-carbonilo, haloalquil($\text{C}_1\text{-C}_6$)-carbonilo, fenilcarbonilo o fenilcarbonilo sustituido con uno a tres R^9 , o

Q es piridilcarbonilo o piridilcarbonilo sustituido con uno a tres R^9 , o

30 Q es nitro, formilo, alquil($\text{C}_1\text{-C}_6$)-sulfonilo o haloalquil($\text{C}_1\text{-C}_6$)-sulfonilo, o

Q es fenilsulfonilo o fenilsulfonilo sustituido con uno a tres R^9 , o

35 Q es un heterociclo de 3 a 10 miembros que contiene uno a tres átomos de nitrógeno, oxígeno o azufre, heterociclo que puede estar benzocondensado, y heterociclo que puede estar sustituido con alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o ciano; e

Y es fenilo, que está opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alcoxi($\text{C}_1\text{-C}_6$)-carbonilo, ciano, halógeno, alquil($\text{C}_1\text{-C}_6$)-tio, haloalquil($\text{C}_1\text{-C}_6$)-tio, alquil($\text{C}_1\text{-C}_6$)-sulfonilo, haloalquil($\text{C}_1\text{-C}_6$)-sulfonilo, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$ o fenilo, o

Y es un heterociclo de 5 a 10 miembros que contiene uno a tres átomos de nitrógeno, oxígeno o azufre, que está opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o halógeno;

45 R^9 son independientemente entre sí nitro o halógeno;

y N-óxidos, sales e isómeros ópticos de los compuestos de fórmula I.

50 Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que

R^1 y R^2 son cada uno independientemente hidrógeno, metilo, etilo, ciclopropilo, ciclobutilo, fluorometilo, clorometilo, difluorometilo o trifluorometilo, o

55 R^1 y R^2 junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo C_3 o C_4 ,

R^3 y R^4 son cada uno independientemente hidrógeno, metilo, etilo, ciclopropilo, ciclobutilo, fluorometilo, clorometilo, difluorometilo o trifluorometilo, o

60 R^3 y R^4 junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo C_3 o C_4 , o

R^1 con R^3 o R^4 y junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo C_5 o C_6 , o

65 R^2 con R^3 o R^4 y junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo C_5 o C_6 .

Un grupo de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4$ son cada uno independientemente hidrógeno, metilo, fluorometilo, clorometilo, difluorometilo o trifluorometilo.

ES 2 333 977 T3

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R¹ y R² son ambos alquilo C₁-C₁₀.

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R¹ y R² son ambos metilo.

Otro grupo de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R³ y R⁴ son ambos hidrógeno.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Q es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, haloalcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, alquil(C₁-C₆)-carbonilo, haloalquil(C₁-C₆)-carbonilo, fenilcarbonilo o fenilcarbonilo sustituido con uno a tres R⁹, o

Q es piridilcarbonilo o piridilcarbonilo sustituido con uno a tres R⁹, o

Q es nitro, formilo, alquil(C₁-C₆)-sulfonilo o haloalquil(C₁-C₆)-sulfonilo, o

Q es fenilsulfonilo o fenilsulfonilo sustituido con uno a tres R⁹, o

Q es un heterociclo de 3 a 10 miembros que contiene uno a tres átomos de nitrógeno, oxígeno o azufre, heterociclo que puede estar benzocondensado, y heterociclo que puede estar sustituido con alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o ciano; y

R⁹ son independientemente entre sí nitro o halógeno.

Un grupo de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Q es hidrógeno, acetilo, *tert*-butoxicarbonilo, 1-cloroetoxicarbonilo, 4-clorofenilcarbonilo, 2-cloropiridilcarbonilo, 5-cianopirimidin-4-ilo, etoxicarbonilmetilo, formilo, metilo, metilsulfonilo, nitro, 4-nitrofenilcarbonilo, 4-nitrofenilsulfonilo, fenilcarbonilo, trimetilsililo, trifluoroacetilo, 4-trifluorometilpirimidin-2-ilo, trifluorometilsulfonilo.

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Q es hidrógeno, metilo, etilo, isopropilo, ciano, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, *tert*-butoxicarbonilo, benciloxicarbonilo, ciclopropilo, difluorometilo, trifluoroetilo, vinilo, difluorovinilo, diclorovinilo, propargilo, acetilo, ciclopropilcarbonilo, benzofilo, bencilcarbonilo, piridilcarbonilo, trifluoroacetilo, metoxicarboniletilo, nitro, formilo, trimetilsililo, metoxicarbonilmetilo, etoxicarbonilmetilo, cianometilo, metilsulfonilo, ciclopropilsulfonilo, bencilsulfonilo, fenilsulfonilo, fenilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, -CONH-SO₂-CH₃, -CONH-SO₂-CF₃, -CONH₂, -CONHCH₃ o -CON(CH₃)₂.

Un grupo adicional de compuestos muy especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Q es hidrógeno, ciano, nitro, formilo, metilo, acetilo, bencilcarbonilo y piridilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, *tert*-butoxicarbonilo, fenilcarbonilo.

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Q es fenilo o cuyos anillos estar sustituidos con flúor, cloro, bromo, yodo, trifluorometilo, ciclopropilo, metilo, metiltio, metilsulfonilo, metilsulfonilo, trifluorometiltio, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, ciano, nitro, metoxicarbonilo, -CONH₂ o con carboxilo.

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Q es 1,3-dioxalanilo, tetrahidrofuranilo, morfolinilo, furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, tetrazolilo, tetrazinilo, benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo, indolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazolilo, quinolilo, isoquinolilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naphthidrinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizininilo, heterociclos que pueden estar sustituidos con flúor, cloro, bromo, yodo, trifluorometilo, ciclopropilo, metilo, metiltio, metilsulfonilo, metilsulfonilo, trifluorometiltio, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, ciano, nitro, metoxicarbonilo, -CONH₂ o con carboxilo.

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, m, n e Y son como se definen anteriormente y Q es hidrógeno, formilo o acetilo, lo más preferiblemente hidrógeno.

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R¹, R², R³, R⁴, m, n e Y son como se definen anteriormente, R⁵ y R⁶ son independientemente hidrógeno, alcoxycarbonilo, alquilo, ciano, halógeno o haloalquilo y Q es hidrógeno.

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que m es 0 ó 1.

Un grupo adicional de compuestos muy especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que m es 1.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R⁵ y R⁶ son cada uno independientemente del otro hidrógeno, alquilo C₁-C₆ o halógeno.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R⁵ y R⁶ son cada uno independientemente del otro hidrógeno, fluoro, cloro, metilo, acetilo o metoxycarbonilo, preferiblemente hidrógeno, fluoro, cloro o metilo.

Un grupo de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R⁵ y R⁶ son cada uno independientemente hidrógeno, ciano, metilo, etilo, isopropilo, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, benciloxycarbonilo, ciclopropilo, difluorometilo, trifluorometilo, trifluoroetilo, hidroximetilo, metoximetilo, metiltiommetilo, metilsulfonilmetilo, metilsulfonilmetilo, vinilo, difluorovinilo, diclorovinilo, etinilo, propargilo, acetilo, trifluoroacetilo, metoxycarboniletilo, nitro, formilo, bromo, cloro, flúor, yodo, azido, trimetilsililo, metoxycarbonilmetilo, etoxycarbonilmetilo, cianometilo, cianoetilo, mercapto, feniltio, metiltio, metilsulfonilo, metilsulfonilo, bencilsulfonilo, fenilsulfonilo, fenilsulfonilo, trifluorometiltio, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, hidroxilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi, metanosulfonilo, trifluorometanosulfonilo, fenoxi, benciloxi, -CONH-SO₂-CH₃, -CONH-SO₂-CF₃, -NHCO-CH₃, -NHCO-CF₃, -OCO-CH₃, -OCO-CF₃, -OCO-fenilo, -OCONH-CH₃, -OCONH-CH₂CF₃, -OCONH-fenilo, -CONH₂, -CONHCH₃ o -CON(CH₃)₂.

Un grupo adicional de compuestos muy especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R⁵ y R⁶ son cada uno independientemente hidrógeno, ciano, metilo, etilo, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, benciloxycarbonilo, ciclopropilo, difluorometilo, trifluorometilo, trifluoroetilo, vinilo, difluorovinilo, diclorovinilo, etinilo, propargilo, acetilo, trifluoroacetilo, nitro, formilo, bromo, cloro, flúor, yodo, azido, trimetilsililo, metoxycarbonilmetilo, etoxycarbonilmetilo, cianometilo, mercapto, feniltio, metiltio, metilsulfonilo, metilsulfonilo, bencilsulfonilo, fenilsulfonilo, fenilsulfonilo, trifluorometiltio, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, hidroxilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi, metiltiommetilo, metilsulfonilmetilo, metilsulfonilmetilo, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, fenoxi, benciloxi, -CONH-SO₂-CH₃, -CONH-SO₂-CF₃, -NHCO-CH₃, -NHCO-CF₃, -OCO-CH₃, -OCO-CF₃, -OCO-fenilo, -OCONH-CH₃, -OCONH-CH₂CF₃ o -OCONH-fenilo.

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R⁵ y R⁶ son cada uno independientemente fenilo o naftilo, anillos que pueden estar sustituidos con flúor, cloro, bromo, yodo, trifluorometilo, ciclopropilo, metilo, metiltio, metilsulfonilo, metilsulfonilo, trifluorometiltio, trifluorometilsulfonilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, ciano, nitro, metoxycarbonilo, -CONH₂ o con carboxilo, y R⁶ puede ser adicionalmente hidrógeno, ciano, metilo, etilo, isopropilo, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo o benciloxycarbonilo o halógeno o trifluorometilo.

Un grupo adicional de compuestos muy especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R⁵ y R⁶ son cada uno independientemente fenilo o naftilo, anillos que pueden estar sustituidos con flúor, cloro, trifluorometilo, metilsulfonilo, metoxi, trifluorometoxi, ciano, nitro o con metoxycarbonilo y R⁶ puede ser adicionalmente hidrógeno, ciano, metilo, etilo, metoxycarbonilo o etoxycarbonilo o halógeno o trifluorometilo.

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R⁵ y R⁶ son cada uno independientemente 1,3-dioxalanilo, tetrahydrofuranilo, morfolinilo, furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, tetrazolilo, tetrazinilo, benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo, indolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazolilo, quinolilo, isoquinolilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo,

pteridinilo, indolizínilo, dihidroisoxazolilo o un radical de fórmula  heterociclos que pueden estar sustituidos con flúor, cloro, bromo, yodo, trifluorometilo, ciclopropilo, metilo, metiltio, metilsulfonilo, metilsulfonilo, trifluorometiltio, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, ciano, nitro, metoxycarbonilo, -CONH₂ o con carboxilo, y R⁶ puede ser adicionalmente hidrógeno, ciano, metilo, etilo, isopropilo, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo o benciloxycarbonilo o halógeno o trifluorometilo.

Un grupo adicional de compuestos muy especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R⁵ y R⁶ son cada uno independientemente isotiazolilo, isoxazolilo, pirazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo, dihidroisoxazo-

lilo o un radical de fórmula  anillos que pueden estar sustituidos con metilo o metoxi y R⁶ puede ser adicionalmente hidrógeno, ciano, metilo, etilo, metoxycarbonilo o etoxycarbonilo o halógeno o trifluorometilo.

ES 2 333 977 T3

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R⁵ y R⁶ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo de ciclopropilo que puede estar sustituido con metilo, trifluorometilo, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, nitro, vinilo, 2-propenilo, acetilo, benzoílo, fenilo, trifluoroacetilo, metilsulfonilo, ciano, cloro, flúor, bromo o con metoxi.

5

Un grupo adicional de compuestos muy especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R⁵ y R⁶ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo de ciclopropilo que puede estar sustituido con metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, ciano, trifluorometilo, metoxi, nitro, vinilo, bromo, flúor o con cloro.

10

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R⁵ y R⁶ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un heterociclo de 3 a 6 miembros que contiene un átomo de nitrógeno, oxígeno o azufre, heterociclo que puede estar sustituido con metilo, trifluorometilo, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, trifluoroacetilo, trifluorometilsulfonilo, metilsulfonilo, acetilo, fenilo, ciano, cloro, flúor, bromo o con metoxi.

15

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R⁵ y R⁶ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un radical de fórmula C=CH₂, C=CH-CH₃, C=CF₂, C=CCl₂, C=CH-N(CH₃)₂, C=CH-NH(CH₃), C=CH-OCH₃ o C=CH-OC₂H₅.

20

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R¹, R², R³, R⁴, Q, m, n e Y son como se definen anteriormente y R⁵ y R⁶ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo de 3 a 10 miembros que puede contener uno o más átomos de nitrógeno, oxígeno o azufre, especialmente un anillo carbocíclico de 3 a 6 miembros, más especialmente ciclopropilo, y que puede estar sustituido con alquilo, haloalquilo, alcoxi, alcoxycarbonilo, halógeno, nitro o con ciano.

25

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R¹, R², R³, R⁴, R⁶, Q, m, n e Y son como se definen anteriormente y R⁵ es hidrógeno.

30

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R¹, R², R³, R⁴, Q, m, n e Y son como se definen anteriormente y R⁵ y R⁶ son ambos hidrógeno.

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R¹, R², R³, R⁴, R⁶, Q, m, n e Y son como se definen anteriormente y R⁵ es metoxycarbonilo.

35

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R¹, R², R³, R⁴, R⁶, Q, m, n e Y son como se definen anteriormente y R⁵ es ciano.

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R¹, R², R³, R⁴, R⁶, Q, m, n e Y son como se definen anteriormente y R⁵ es metilo.

40

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R¹, R², R³, R⁴, R⁶, Q, m, n e Y son como se definen anteriormente y R⁵ es halógeno.

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R¹, R², R³, R⁴, Q, m, n e Y son como se definen anteriormente y R⁵ y R⁶ son ambos halógeno, preferiblemente seleccionado independientemente de cloro y flúor.

45

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R¹, R², R³, R⁴, R⁶, Q, m, n e Y son como se definen anteriormente y R⁵ es flúor.

50

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R¹, R², R³, R⁴, Q, m, n e Y son como se definen anteriormente y R⁵ y R⁶ son ambos flúor.

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R¹, R², R³, R⁴, R⁶, Q, m, n e Y son como se definen anteriormente y R⁵ es cloro.

55

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R¹, R², R³, R⁴, Q, m, n e Y son como se definen anteriormente y R⁵ y R⁶ son ambos cloro.

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R¹, R², R³, R⁴, Q, m, n e Y son como se definen anteriormente y R⁵ es flúor y R⁶ es cloro.

60

Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que R¹, R², R³, R⁴, R⁶, Q, m, n e Y son como se definen anteriormente y R⁵ es haloalquilo C₁-C₆, especialmente trifluorometilo.

65

ES 2 333 977 T3

2. Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que n es 1 ó

5 1. Un grupo adicional de compuestos muy especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que n es

10 Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es fenilo, que está opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi (C₁-C₆)-carbonilo, ciano, halógeno, alquil(C₁-C₆)-tio, haloalquil(C₁-C₆)-tio, alquil(C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquil(C₁-C₆)-sulfonilo, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ o fenilo, o

15 Y es un heterociclo de 5 a 10 miembros que contiene uno a tres átomos de nitrógeno, oxígeno o azufre, que está opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o halógeno.

20 Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es fenilo, que está opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi (C₁-C₆)-carbonilo, ciano, halógeno, alquil(C₁-C₆)-tio, haloalquil(C₁-C₆)-tio, alquil(C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquil(C₁-C₆)-sulfonilo, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ o fenilo.

25 Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es fenilo opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de ciano, difluorometoxi, etoxycarbonilo, fluoro, metoxycarbonilo, metilo, metilsulfonilo, fenilo, trifluorometoxi, trifluorometilo o trifluorometiltio.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-bifenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-cloro-3-etoxycarbonil-6-metilsulfonilfenilo.

30 Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-cianofenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-difluorometoxifenilo.

35 Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2,3-difluorofenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2,4-difluorofenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2,5-difluorofenilo.

40 Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2,6-difluorofenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 3,5-difluorofenilo.

45 Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2,6-difluoro-3-tolilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 4-etoxycarbonil-2-fluorofenilo.

50 Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 6-fluoro-4H-benzo[1,3]dioxin-8-ilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-fluoro-4-metoxycarbonilfenilo.

55 Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-fluorofenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-fluoro-6-trifluorometilfenilo.

60 Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es fenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-tolilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-trifluorometoxifenilo.

65 Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-trifluorometilfenilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 2-trifluorometiltio.

ES 2 333 977 T3

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es un heterociclo de 5 a 10 miembros que contiene uno a tres átomos de nitrógeno, oxígeno o azufre, que está opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o halógeno.

- 5 Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es pirazolilo opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de difluorometoxi, difluorometilo, metoxi, metilo o trifluorometilo.

Un grupo de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es pirazol-4-ilo.

- 10 Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 5-cloro-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilo.

- 15 Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 3-difluorometoxi-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilo.

Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 1-metil-3-difluorometil-1H-pirazol-4-ilo.

- 20 Un grupo de compuestos preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es 1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilo.

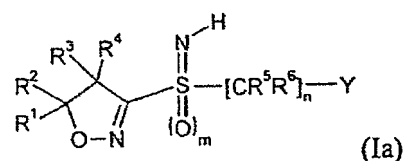
- Un grupo adicional de compuestos especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es fenilo, naftilo, tetrahidronaftilo, 1,3-dioxalanilo, tetrahidrofuranilo, morfolinilo, furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, tetrazolilo, tetrazinilo, benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo, indolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazolilo, quinolilo, isoquinolilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftidrinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo o indolizínilo, anillos que pueden estar sustituidos con flúor, cloro, bromo, yodo, trifluorometilo, ciclopropilo, metilo, metiltio, metilsulfonilo, metilsulfonilo, trifluorometiltio, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, metoxi, etoxi, trifluoroetoxi, trifluorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, ciano, nitro, metoxycarbonilo, -CONH₂ o con carboxilo.

- 35 Un grupo adicional de compuestos muy especialmente preferidos de fórmula I comprende aquellos en los que Y es fenilo, pirimidin-5-ilo, piridin-3-ilo, isotiazol-4-ilo, isoxazol-4-ilo, pirazol-4-ilo o tiofen-3-ilo, cada uno de estos grupos opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo.

- 40 1.1) Los compuestos de fórmula I, en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, Q, n e Y son como se definen anteriormente y m es 0 ó 1, pueden prepararse mediante procedimientos conocidos de por sí, por ej. al hacer reaccionar un compuesto de fórmula Ia

45

50



en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, n e Y son como se definen anteriormente y m es 0 ó 1.

55

1.1A) con compuestos de la fórmula



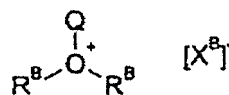
60

- en la que Q es como se define anteriormente y X^A es un grupo de salida adecuado tal como, por ej., un halógeno, tal como bromuro, un carboxilato, tal como acetato, un alquil- o aril-sulfonato, tal como p-toluenosulfonato, una imida, tal como succinimida, una sulfonimida, tal como bis(fenilsulfonil)imida, o un haloalquilsulfonato, tal como trifluorometilsulfonato, en presencia de una base, por ej. una trialkilamina, tal como trietilamina, piridina, un carbonato de metal alcalino, tal como carbonato potásico o carbonato de cesio, un compuesto de alquil-litio, tal como metil-litio, n-butil-litio y *tert*-butil-litio, una dialquilamida de litio, tal como diisopropilamida de litio, un hidruro metálico, preferiblemente un hidruro de metal alcalino, tal como hidruro sódico, o una amida de metal alcalino, tal amida sódica, una bis(tri[alquil(C₁-C₆)]-silyl)amida metálica, tal como bis(trimetilsilyl)amida de litio, un alcóxido metálico, tal como

65

tert-butoxido potásico, un hidróxido de metal alcalino o un hidróxido de metal alcalinotérreo, tal como hidróxido sódico, o una base de fosfaceno, tal como triamida *N'*-*tert*-butil-*N,N,N'*,*N',N'',N''*-hexametilfosforimídica (P_1 -*t*Bu), 1-etil-2,2,4,4,4pentaquis(dimetilamino)-2-lambda⁵-5,4-lambda⁵-5-catenadi(fosfaceno) (P_2 -Et), 1-*tert*-butil-2,2,4,4,4pentaquis(dimetilamino)-2-lambda⁵-5,4-lambda⁵-5-catenadi(fosfaceno) (P_2 -*t*Bu), 2-*tert*-butilimino-2-dietilamino-1,3-dimetilperhidro-1,3,2-diazafosforina (BEMP) o 2,8,9-triisobutil-2,5,8,9-tetraaza-1-fosfabiciclo[3.3.3]undecano (base de Verkade), opcionalmente en presencia de un diluyente, por ej. dimetilsulfóxido, *N,N*-dimetilformamida, un éter, tal como tetrahidrofurano (THF) o 1,2-dimetoxietano, o un hidrocarburo halogenado, tal como diclorometano, o sus mezclas, y opcionalmente en presencia de un catalizador, por ej. un catalizador de transferencia de fase, tal como bromuro de tetrabutilamonio o cloruro de trietilbencilamonio, o un catalizador de metal de transición, tal como acetato de paladio(II) [Pd(OAc)₂] o tris(dibencilidenacetona)dipaladio(0) [Pd₂(dba)₃], habitualmente en presencia de un ligando de fosfina, tal como 2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo (BINAP) o trifenilfosfina, o CuI o CuBr, en un intervalo de temperatura de -120°C a 160°C, preferiblemente de -80°C a 120°C. Tales procedimientos se conocen en la bibliografía y se describen, por ejemplo, en J. Org. Chem., 1993 (58) 1922-1923; Tetrahedron Lett., 1996 (37) 3985-3988; J. Org. Chem., 1973 (38) 20-26; Synthesis, 2002 (7) 879-887; Chem. Eur. J. 12001 (7) 1118-1128, Org. Lett., 2004(6) 3293-3296;

1.1B) con compuestos de la fórmula general



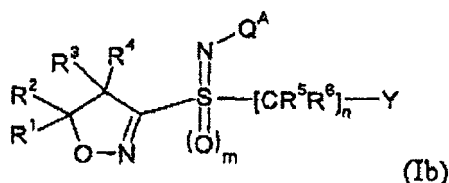
en la que Q y R^B son alquilo C₁-C₆, tal como metilo o etilo, y X^B es un ion conjugado adecuado, tal como tetrafluoroborato, en presencia de una base, por ej. un carbonato de metal alcalino, tal como carbonato potásico o carbonato sódico, y en presencia de un disolvente, por ej. un hidrocarburo halogenado, tal como diclorometano, habitualmente en un intervalo de temperatura de -50°C a 30°C. Tales procedimientos se conocen en la bibliografía y se describen, por ejemplo, en J. Org. Chem., 1978 (43) 4136-4140 y 4140-4143; 7. Am. Chem. Soc., 1970, 92, 6594;

1.1C) con un agente de formilación, por ej. ortoformiato de trimetilo, opcionalmente en presencia de un ácido, tal como ácido p-toluenosulfónico, opcionalmente en presencia de un disolvente inerte, tal como tolueno o xileno, habitualmente en un intervalo de temperatura de 0°C a 200°C, preferiblemente de 50°C a 120°C. Tales procedimientos se conocen en la bibliografía y se describen, por ejemplo, en Tetrahedron Letters, 1987 (36) 4149.

1.1D) con un agente de nitración, por ej. ácido nítrico, opcionalmente en presencia de un ácido, tal como ácido sulfúrico, opcionalmente en presencia de un anhídrido de ácido, tal como anhídrido acético, opcionalmente en presencia de un disolvente inerte, por ej. un hidrocarburo halogenado, tal como diclorometano, en un intervalo de temperatura de -50°C a 80°C, preferiblemente -20°C a 50°C. Tales procedimientos se conocen en la bibliografía y se describen, por ejemplo, en Synthesis, 1986 (5) 426-427, Synthesis, 2003 (4) 565-569.

1.2) Los compuestos de fórmula Ia, en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, n e Y son como se definen anteriormente y m es 0 ó 1, pueden prepararse mediante procedimientos conocidos de por sí, por ej. mediante

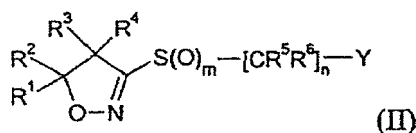
1.2A) desprotección de un compuesto de fórmula Ib



en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, n e Y son como se definen anteriormente, m es 0 ó 1 y Q^A es un grupo ávido de electrones, por ej. alquilsulfonilo, tal como metilsulfonilo, arilsulfonilo, tal como p-toluenosulfonilo o nitrofenilsulfonilo, o un haloalquilcarbonilo, tal como trifluorometilcarbonilo, o un alcoxycarbonilo, tal como *tert*-butoxicarbonilo, o un benzoílo sustituido, tal como 4-nitrobenzoílo o 4-clorobenzoílo, bajo condiciones ácidas, por ej. en presencia de un ácido mineral, tal como ácido sulfúrico o ácido clorhídrico, o un ácido orgánico, tal como ácido trifluoroacético (J. Am. Chem. Soc., 1973 (95) 7418-7423; Chem. Eur. J. 12001 (7) 1118-1128, J. Med. Chem., 2003 (46) 4405-4418, J. Org. Chem., 1976 (41) 1728), o bajo condiciones básicas, por ej. en presencia de un carbonato de metal alcalino, tal como carbonato potásico, o un hidróxido de metal alcalino, tal como hidróxido sódico (Org. Lett., 2004 (8) 1305-1307), o en presencia de un nucleófilo, por ej. un mercaptano, tal como feniltiol

(Tetrahedron Lett., 2002 (43) 2749-2751), en presencia de un diluyente, por ej. un éter, tal como tetrahidrofurano (THF) o 1,4-dioxano, agua, un hidrocarburo halogenado, tal como diclorometano, un alcohol, tal como metanol o etanol, o sus mezclas, habitualmente en un intervalo de temperatura de -20°C a 150°C, preferiblemente -20°C a 50°C;

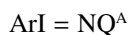
1.2B) al hacer reaccionar compuestos de fórmula II



en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, n e Y son como se definen anteriormente y m es 0 ó 1, con una azida de metal alcalino, tal como azida sódica, bajo condiciones ácidas, habitualmente en presencia de ácido sulfúrico, opcionalmente en presencia de un disolvente, por ej. un hidrocarburo halogenado, tal como cloroformo o diclorometano, en un intervalo de temperatura de -20°C a 50°C, preferiblemente -20°C a 25°C (Synthesis, 2003 (4) 565-569; J. Am. Chem. Soc., 1973 (95) 7418) o al reaccionar con O-mesitilensulfonilhidroxilamina en presencia de un disolvente, por ej. un hidrocarburo halogenado, tal como cloroformo o diclorometano, en un intervalo de temperatura de -20°C a 50°C, preferiblemente -20°C a 25°C (J. Org. Chem., 1974 (39) 24598-2459; J. Org. Chem., 1973 (38) 1239).

1.3) Compuestos de fórmula Ib, en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, n e Y son como se definen anteriormente, m es 0 ó 1 y Q^A es un grupo ávido de electrones, por ej. alquilsulfonilo, tal como metilsulfonilo, arilsulfonilo, tal como p-toluenosulfonilo, o nitrofenilsulfonilo, o un haloalquilarbonilo, tal como trifluorometilcarbonilo, o un alcoxicarbonilo, tal como *tert*-butoxicarbonilo, pueden prepararse mediante procedimientos conocidos de por sí, al hacer reaccionar, por ej., el compuesto de fórmula II (véase anteriormente), en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, n e Y son como se definen anteriormente y m es 0 ó 1,

1.3A) con un reactivo de iminación de la fórmula



en la que Ar es un grupo fenilo, opcionalmente sustituido, por ej., con halógenos, Q^A es un grupo ávido de electrones, por ej. alquilsulfonilo, tal como metilsulfonilo, arilsulfonilo, tal como p-toluenosulfonilo o nitrofenilsulfonilo, o un haloalquilarbonilo, tal como trifluorometilcarbonilo, o un alcoxicarbonilo, tal como *tert*-butoxicarbonilo, opcionalmente en presencia de un catalizador de metal de transición, por ej. RH₂(OAc)₄, Cu(I)PF₆, Cu(OTf)₂ o CuOTf o AgNO₃, opcionalmente en presencia de un ligando, por ej. 4,4',4''-tri-*tert*-butil-2,2':6',2''-terpiridina, y en presencia de un disolvente inerte, tal como tolueno, diclorometano o acetonitrilo. El reactivo de iminación ArI=NQ^A puede estar preformado o generarse *en situ* al hacer reaccionar un compuesto de la fórmula

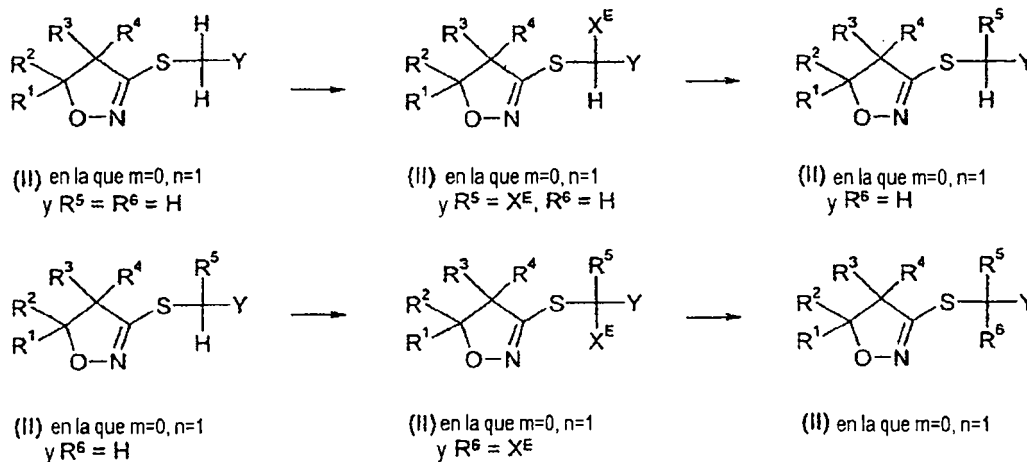


con un compuesto peryodado, tal como PhI(OAc)₂ o PhI(OCOCF₃)₂, opcionalmente en presencia de una base débil, tal como MgO. Tales procedimientos se conocen en la bibliografía y se describen, por ejemplo, en Org. Lett., 2004 (8) 1305-1307, Tetrahedron Lett., 1998 (39) 4805, Synthesis, 1999 (7) 12512-1260;

1.3B) con una azida orgánica, tal como *tert*-butoxicarbonilazida o p-toluenosulfonilazida, opcionalmente en presencia de un catalizador de metal de transición, tal como FeCl₂, en presencia de un disolvente, por ej. un hidrocarburo halogenado, tal como cloroformo o diclorometano, en un intervalo de temperatura de -20°C a 50°C, preferiblemente -20°C a 25°C (Synthesis, 1999 1251-1260, Tetrahedron Lett., 1998 (39) 5015).

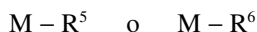
1.4) Los compuestos de fórmula II en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, n e Y son como se definen anteriormente y m es 1 pueden prepararse mediante procedimientos conocidos de por sí al hacer reaccionar compuestos de fórmula II en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, n e Y son como se definen anteriormente y m es 0 con un agente oxidante orgánico o inorgánico adecuado, por ej. un peroxiácido, tal como ácido 3-cloroperoxibenzoico, ácido peracético o peróxido de hidrógeno, un alcóxiperoxido o a peryodato, tal como peryodato sódico, opcionalmente en presencia de un diluyente, tal como un hidrocarburo halogenado, por ej. diclorometano o 1,2-dicloroetano, un alcohol, por ej. metanol, N,N-dimetilformamida, agua o ácido acético o una de sus mezclas. Las reacciones se llevan a cabo habitualmente en un intervalo de temperatura de -80°C a 120°C, preferiblemente de -20°C a 50°C. Tales procedimientos se conocen en la bibliografía y se describen, por ej., en J. Org. Chem., 2003 (68) 3849-3859; J. Med. Chem., 2003 (46) 30213032; J. Org. Chem., 2003 (68) 500-511; Bioorg. Med. Chem., 1999 (9) 1837-1844.

1.5) Los compuestos de fórmula II en la que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ e Y son como se definen anteriormente, m es 0 y n es 1 pueden prepararse, por ejemplo, al partir de compuestos de fórmula II en la que R^1, R^2, R^3, R^4 e Y son como se definen anteriormente, R^5 y R^6 son hidrógeno, m es 0 y n es 1 o compuestos de fórmula II en la que R^1, R^2, R^3, R^4, R^5 e Y son como se definen anteriormente, R^6 es hidrógeno, m es 0 y n es 1,



al hacer reaccionar esos compuestos con un agente halogenante, por ej. bromo o una N-halosuccinimida, tal como N-clorosuccinimida o N-bromosuccinimida, para formar compuestos de fórmula II en la que R^1, R^2, R^3, R^4 e Y son como se definen anteriormente, R^5 es X^E , y X^E es a su vez halógeno, R^6 es hidrógeno, m es 0 y n es 1, o compuestos de fórmula II en la que R^1, R^2, R^3, R^4, R^5 e Y son como se definen anteriormente, R^6 es X^E , y X^E es a su vez halógeno, m es 0 y n es 1, respectivamente, opcionalmente en presencia de un diluyente, por ej. ácido acético o un hidrocarburo halogenado, tal como CCl_4 o diclorometano, en un intervalo de temperatura de $-80^\circ C$ a $120^\circ C$, preferiblemente de $-20^\circ C$ a $60^\circ C$.

Los compuestos de fórmula II en la que R^1, R^2, R^3, R^4 e Y son como se definen anteriormente, R^5 es X^E , y X^E es a su vez halógeno, R^6 es hidrógeno, m es 0 y n es 1 o los compuestos de fórmula II en la que R^1, R^2, R^3, R^4, R^5 e Y son como se definen anteriormente, R^6 es X^E , y X^E es a su vez halógeno, m es 0 y n es 1 pueden oxidarse a continuación directamente como se describe anteriormente o alternativamente (en una segunda etapa) hacerse reaccionar con compuestos de fórmula

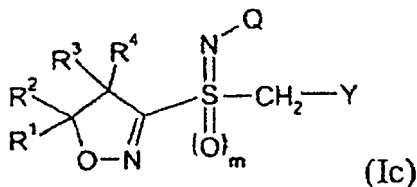


respectivamente, en la que R^5 y R^6 son como se definen anteriormente y $M-R^5$ o $M-R^6$ es una sal adecuada o un compuesto organometálico en el que M es, por ej., Li, MgBr, Na, K o tetraalquilamonio, opcionalmente en presencia de un ácido de Lewis, por ej. $SnCl_4$, opcionalmente en presencia de un agente complejante, por ej. hexametilfosforamida (HMPA) o 1,3dimetil-3,4,5,6-tetrahidro-2(1H)-pirimidinona (DMPU), y opcionalmente en presencia de un diluyente, por ej. acetonitrilo, diclorometano, éter dietílico o tetrahidrofurano (THF), en un intervalo de temperatura de $-120^\circ C$ a $100^\circ C$, preferiblemente de $-80^\circ C$ a $80^\circ C$. Tales procedimientos se conocen en la bibliografía y se describen, por ejemplo, en J. Org. Chem., 1998 (63) 3706-3716; J. Chem. Soc. Perkin Trans., 1995 (22) 2845-2848; Synthesis 1982 (2), 131-132; Liebigs Annalen, 1993,49-54 y Synth. Common., 1990 (20) 1943-1948.

Compuestos de fórmula II en la que R^1, R^2, R^3, R^4, n e Y son como se definen anteriormente, R^5 y R^6 son hidrógeno, m es 0, se han descrito previamente en los documentos WO 01/012613, WO 03/000686 y WO 04/014138.

2) Los compuestos de fórmula I, en la que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, Q, n$ e Y son como se definen anteriormente y m es 1, también pueden prepararse mediante procedimientos conocidos de por sí, al hacer reaccionar, por ej., un compuesto de fórmula I, en la que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, Q, n$ e Y son como se definen anteriormente y m es 0, con un agente oxidante orgánico o inorgánico adecuado, por ej. un peroxiácido, tal como ácido 3-cloroperoxibenzoico, ácido peracético o peróxido de hidrógeno, o un permanganato, tal como permanganato potásico, un alcoxiperóxido o un peryodato, tal como peryodato sódico, o un dioxirano, tal como dimetildioxirano, o un hidroperóxido o hipoclorito, tal como hipoclorito sódico, opcionalmente en presencia de una base, por ej. un carbonato de metal alcalino, tal como carbonato potásico, opcionalmente en presencia de un catalizador de transferencia de fase, tal como bromuro de tetrabutilamonio o cloruro de trietilbencilamonio, y en presencia de un disolvente, por ej. un alcohol, tal como metanol o etanol, acetona, agua, un hidrocarburo halogenado, tal como diclorometano o cloroformo, o sus mezclas, en un intervalo de temperatura de $-20^\circ C$ a $100^\circ C$, preferiblemente de $-20^\circ C$ a $50^\circ C$. Tales procedimientos se conocen en la bibliografía y se describen, por ejemplo, en Synthesis, 1982, 77-78; Tetrahedron Lett., 1997 (31) 5559-5562; J. Org. Chem., 1979 (44) 2510.

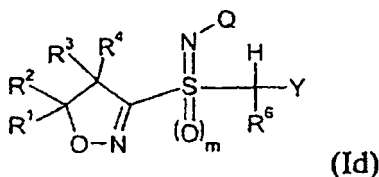
3.1) Los compuestos de fórmula I, en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, Q e Y son como se definen anteriormente, m es 1 y n es 1, también pueden prepararse mediante procedimientos conocidos de por sí, por ej. al hacer reaccionar un compuesto de fórmula Ic



en la que R¹, R², R³, R⁴, Q e Y son como se definen anteriormente y m es 1, en una sola etapa o por etapas en sucesión con compuestos de la fórmula R⁵-X^A y/o R⁶-X^A, en la que R⁵ y R⁶ son como se definen anteriormente y X^A es un grupo de salida adecuado, tal como, por ej., halógeno, tal como bromuro, un carboxilato, tal como acetato, un alquil- o aril-sulfonato, tal como p-toluenosulfonato, una imida, tal como succinimida, una sulfonimida, tal como bis(fenilsulfonil)imida, o un haloalquilsulfonato, tal como trifluorometilsulfonato, en presencia de una base, por ej. un compuesto de alquil-litio, tal como metil-litio, *n*-butil-litio y *tert*-butil-litio, una dialquilamida de litio, tal como diisopropilamida de litio, un hidruro metálico, preferiblemente un hidruro de metal alcalino, tal como hidruro sódico, o una amida de metal alcalino, tal como amida sódica, una bis[tri(alquil C₁-C₆)silil]amida metálica, tal como bis(trimetilsilil)amida de litio, un alcóxido metálico, tal como *tert*-butoxido potásico, o una base de fosfaceno, tal como triamida N'-*tert*-butil-N,N,N',N'',N'''-hexametilfosforimídica (P₁-^tBu), 1-etil-2,2,4,4,4-pentaquis(dimetilamino)-2-lambda⁵-5,4-lambda⁵-5-catenadi(fosfaceno) (P₂-Et), 1-*tert*-butil-2,2,4,4,4-pentaquis(dimetilamino)-2-lambda⁵-5,4-lambda⁵-5-catenadi(fosfaceno) (P₂-^tBu), 2-*tert*-butilimino-2-dietilamino-1,3-dimetil-perhidro-1,3,2-diazafosforina (BEMP) o 2,8,9-triisobutil-2,5,8,9-tetraaza-1-fosfabciclo[3.3.3]undecano (base de Verkade), opcionalmente en presencia de un diluyente, por ej. N,N-dimetilformamida, un éter, tal como tetrahidrofurano (THF) o 1,2-dimetoxietano, o un hidrocarburo halogenado, tal como diclorometano, o sus mezclas, y opcionalmente en presencia de un catalizador, por ej. un catalizador de transferencia de fase, tal como bromuro de tetrabutilamonio o cloruro de trietilbencilamonio, o un catalizador de metal de transición, tal como acetato de paladio(II) [Pd(OAc)₂] o tris(dibencilidenacetona)dipaladio(0) [Pd₂(dba)₃], habitualmente en presencia de un ligando de fosfina, tal como 2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo (BINAP) o trifenilfosfina, en un intervalo de temperatura de -120°C a 160°C, preferiblemente de -80°C a 120°C. Tales procedimientos se conocen en la bibliografía y se describen, por ejemplo, en Eur. J. Org. Chem. 2003 (8) 1500-1526, J. Org. Chem., 2002 (67) 2859-2863; Tetrahedron Lett. 2000 (41) 2851-2854.

En particular, el procedimiento 3.1) es útil para la preparación de un compuesto de fórmula I en la que R¹, R², R³, R⁴, Q e Y son como se definen anteriormente, R⁵ es halógeno, R⁶ es hidrógeno o halógeno, m es 1 y n es 1, mediante la halogenación de un compuesto de fórmula Ic (véase anteriormente), en la que R¹, R², R³, R⁴, Q e Y se definen como anteriormente y m es 1, en una sola etapa o por etapas en sucesión con compuestos de fórmula R⁵-X^A y/o R⁶-X^A, en la que R⁵ y/o R⁶ son halógeno, por ej. flúor, cloro, bromo y yodo, y X^A es un grupo de salida adecuado según se describe anteriormente. Reaccionantes preferidos son N-fluorobencenosulfonimida (NFSI) o bis(tetrafluoroborato) de 1-(clorometil)-4-fluoro-1,4-diazoniabicyclo[2.2.2]octano (SELECTFLUOR) para la fluoración, N-clorosuccinimida (NCS) o hexacloroetano para la cloración, N-bromosuccinimida (NBS) o tribromuro de fenil-trimetilamino (PTT) para la bromación, y N-yodosuccinimida (NIS) para la yodación. Las halogenaciones se llevan a cabo convenientemente en un disolvente inerte, preferiblemente un éter, por ej. THF, y en presencia de una base, preferiblemente bases de fosfaceno, por ej. 2-*tert*-butilimino-2-dietilamino-1,3-dimetilperhidro-1,3,2-diazafosforina (BEMP), triamida N'-*tert*-butil-N,N,N',N'',N'''-hexametilfosforimídica (P₁-^tBu), 1-*tert*-butil-2,2,4,4,4-pentaquis(dimetilamino)-2-lambda⁵-5,4-lambda⁵-5-catenadi(fosfaceno) (P₂-^tBu) o 1-etil-2,2,4,4,4-pentaquis(dimetilamino)-2-lambda⁵-5,4-lambda⁵-5-catenadi(fosfaceno) (P₂-Et) o 2,8,9-triisobutil-2,5,8,9-tetraaza-1-fosfabciclo[3.3.3]undecano (base de Verkade), en un intervalo de temperatura de 0°C a 50°C, preferiblemente de 0°C a 30°C. Alternativamente, las halogenaciones se llevan a cabo en presencia de bases de alcóxido, por ej. *tert*-butoxido potásico, en presencia de un diluyente, preferiblemente un éter, por ej. THF, en un intervalo de temperatura de -100°C a 50°C, preferiblemente de -80°C a 0°C. Alternativamente, las halogenaciones se llevan a cabo en presencia de un compuesto de alquil-litio, por ej. *n*-butil-litio, en presencia de un agente complejante, por ej. 1,3-dimetil-3,4,5,6-tetrahidro-2(1H)-pirimidina (DMPU), en presencia de un diluyente, preferiblemente un éter, por ej. THF, en un intervalo de temperatura de -100°C a 50°C, preferiblemente de -80°C a 0°C. Alternativamente, las halogenaciones se llevan a cabo en presencia de una bis[tri(alquil C₁-C₆)silil]amida metálica, por ej. bis(trimetilsilil)amida sódica, en presencia de un diluyente, preferiblemente un éter, por ej. THF, en un intervalo de temperatura de -100°C a 50°C, preferiblemente de -80°C a 0°C.

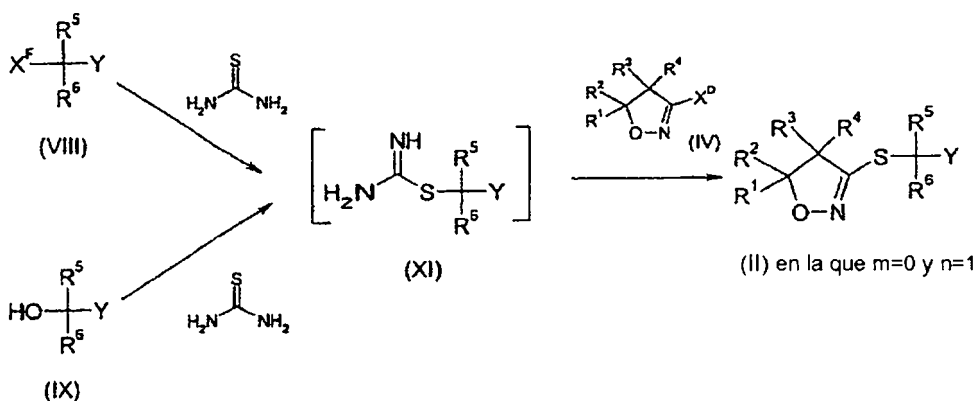
3.2) Los compuestos de fórmula I, en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , Q e Y son como se definen anteriormente, R^6 es alquilo C_1 - C_{10} o halógeno, m es 1 y n es 1 también pueden prepararse mediante procedimientos conocidos de por sí, por ej. al hacer reaccionar un compuesto de fórmula Id



en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , Q e Y se definen como anteriormente, R^6 es alquilo C_1 - C_{10} , por ej. metilo, o halógeno, por ej. cloro o flúor, y m es 1 con un compuesto de fórmula R^5 - X^A , en la que R^5 es como se define anteriormente y X^A es un grupo de salida adecuado según se describe anteriormente, en presencia de una base, opcionalmente en presencia de un diluyente, preferiblemente un disolvente inerte, y opcionalmente en presencia de un agente complejante, en un intervalo de temperatura de -120°C a 100°C , preferiblemente de -80°C a 50°C .

En particular, el procedimiento 3.2) es útil para la preparación de un compuesto de fórmula I en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , Q e Y son como se definen anteriormente, R^5 es halógeno, R^6 es alquilo C_1 - C_{10} o halógeno, m es 1 y n es 1, mediante la halogenación de un compuesto de fórmula Id (véase anteriormente) en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , Q e Y se definen como anteriormente, R^6 es alquilo C_1 - C_{10} , por ej. metilo, o halógeno, por ej. cloro o flúor, y m es 1 con un compuesto de fórmula R^5 - X^A , en la que R^5 es halógeno, por ej. flúor, cloro, bromo y yodo, y X^A es un grupo de salida adecuado según se describe anteriormente. Reaccionantes preferidos son N-fluorobencenosulfonimida (NFSI) o bis (tetrafluoroborato) de 1-(clorometil)-4-fluoro-1,4-diazoniabencilo[2.2.2]octano (SELECTFLUOR) para la fluoración, N-clorosuccinimida (NCS) o hexacloroetano para la cloración, N-bromosuccinimida (NBS) o tribromuro de fenil-trimetilamino (PTT) para la bromación y N-yodosuccinimida (NIS) para la yodación. Las halogenaciones se llevan a cabo convenientemente en un disolvente inerte, preferiblemente un éter, por ej. THF, y en presencia de una base, preferiblemente bases de fosfaceno, por ej. 2-*tert*-butilimino-2-dietilamino-1,3-dimetil-perhidro-1,3,2-diazafosforina (BEMP), triamida N'-*tert*-butil-N,N,N',N',N'',N''-hexametilfosforimídica (P_1 - t Bu), 1-*tert*-butil-2,2,4,4,4-pentaquis (dimetilamino)-2-lambda⁵-5,4-lambda⁵-5-catenadi(fosfaceno) (P_2 - t Bu) o 1-etil-2,2,4,4,4-pentaquis(dimetilamino)-2-lambda⁵-5,4-lambda⁵-5-catenadi(fosfaceno) (P_2 -Et) o 2,8,9-triisobutil-2,5,8,9-tetraaza-1-fosfabiciclo[3.3.3]undecano (base de Verkade), en un intervalo de temperatura de 0°C a 50°C , preferiblemente de 0°C a 30°C . Alternativamente, las halogenaciones se llevan a cabo en presencia de bases de alcóxido, por ej. *tert*-butóxido potásico, en presencia de un diluyente, preferiblemente un éter, por ej. THF, en un intervalo de temperatura de -100°C a 50°C , preferiblemente de -80°C a 0°C . Alternativamente, las halogenaciones se llevan a cabo en presencia de un compuesto de alquil-litio, por ej. *n*-butil-litio, en presencia de un agente complejante, por ej. 1,3-dimetil-3,4,5,6-tetrahidro-2(1H)-pirimidino-na (DMPU), en presencia de un diluyente, preferiblemente un éter, por ej. THF, en un intervalo de temperatura de -100°C a 50°C , preferiblemente de -80°C a 0°C . Alternativamente, las halogenaciones se llevan a cabo en presencia de una bis[(tri(alquil C_1 - C_6)sili]amida metálica, por ej. bis(trimetilsilil)amida sódica, en presencia de un diluyente, preferiblemente un éter, por ej. THF, en un intervalo de temperatura de -100°C a 50°C , preferiblemente de -80°C a 0°C .

Alternativamente, compuestos de fórmula II en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 e Y son como se definen anteriormente, m es 0 y n es 1 pueden prepararse al hacer reaccionar un compuesto de fórmula VIII en la que R^5 , R^6 e Y se definen como anteriormente y XF es un grupo de salida tal como halógeno, por ej. bromuro o cloruro, o alquilsulfonato, por ej. metilsulfonato, o arilsulfonato, por ej. tosilato, con tiourea, opcionalmente en presencia de un diluyente, por ej. un alcohol, por ej., etanol, opcionalmente en presencia de un yoduro alcalino, por ej. yoduro sódico, yoduro potásico, en un intervalo de temperatura de -30°C a 100°C , preferiblemente de 0°C a 80°C , para dar un producto intermedio de isotiourea de fórmula XI, que se hace reaccionar con un compuesto de fórmula IV

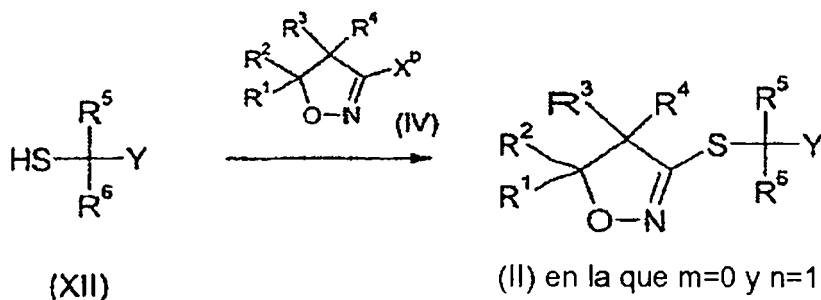


en la que R^1 , R^2 , R^3 y R^4 se definen como anteriormente, y X^D es un grupo de salida adecuado tal como halógeno, por ej. cloruro, un grupo alquil- o aril-sulfonilo, por ej. metilsulfonilo o fenilsulfonilo, un grupo haloalquilsulfonilo,

por ej. trifluorometilsulfonilo, o nitro, en presencia de una base, tal como un carbonato, por ej. carbonato potásico, carbonato sódico o bicarbonato potásico, o un hidróxido, por ej. hidróxido potásico, o un alcóxido, por ej. alcóxido sódico, opcionalmente en presencia de un diluyente, tal como un alcohol, por ej. etanol, un éter, por ej. 1,4-dioxano, THF, un disolvente polar, por ej. agua, DMF o una mezcla de disolventes, por ej. una mezcla de 1,4-dioxano y agua, en un intervalo de temperatura de 20°C a 200°C, preferiblemente de 50°C a 150°C, opcionalmente en presencia de un gas inerte, por ej. nitrógeno, y opcionalmente bajo irradiación de microondas. Tales procedimientos se conocen en la bibliografía y se describen, por ejemplo, en el documento WO 04/0131106.

Un método adicional para preparar productos intermedios de fórmula XI, en la que R⁵, R⁶ e Y son como se definen anteriormente, es hacer reaccionar un compuesto de la fórmula IX, en la que R⁵, R⁶ e Y se definen como anteriormente, con tiourea en presencia de un ácido, por ejemplo un ácido mineral tal como ácido clorhídrico o ácido bromhídrico o ácido sulfúrico o un ácido orgánico tal como ácido trifluoroacético, y opcionalmente en presencia de un diluyente, tal como un éter, por ej. 1,4-dioxano, THF, un disolvente polar, por ej. agua, DMF o una mezcla de disolventes, por ej. una mezcla de 1,4-dioxano y agua, en un intervalo de temperatura de 20°C a 270°C, preferiblemente de 20°C a 150°C, opcionalmente bajo irradiación de microondas. Tales procedimientos se conocen en la bibliografía y se describen, por ejemplo, en Buchwald y Neilsen, JACS, 110(10), 3171-3175 (1988); Frank y Smith, JACS, 68, 2103-2104 (1946); Vetter, Syn. Comm., 28, 3219-3233 (1998).

Un método adicional para preparar compuestos de fórmula II en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ e Y son como se definen anteriormente, m es 0 y n es 1 es hacer reaccionar un compuesto de la fórmula XII en la que R⁵, R⁶ e Y son como se definen anteriormente,



con un compuesto de fórmula IV en la que R¹, R², R³ y R⁴ se definen como anteriormente, y X^D es un grupo de salida adecuado tal como halógeno, por ej. cloruro, un grupo alquil- o aril-sulfonilo, por ej. metilsulfonilo o fenilsulfonilo, un grupo haloalquilsulfonilo, por ej. trifluorometilsulfonilo, o nitro, en presencia de una base, por ej. carbonato potásico, opcionalmente en presencia de un diluyente, por ej. DMF, en un intervalo de temperatura de 0°C a 100°C, preferiblemente de 20°C a 50°C, y opcionalmente bajo una atmósfera inerte, por ej., nitrógeno. Tales procedimientos se conocen en la bibliografía y se describen, por ejemplo, en los documentos WO 01/012613, WO 02/062770 y WO 04/010165.

Los compuestos de fórmula Ic y Id, en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁶, Q e Y son como se definen anteriormente y m es 1, pueden prepararse como se describe anteriormente.

Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención pueden usarse como herbicidas en forma no modificada, según se obtienen en la síntesis, pero generalmente pueden formularse como composiciones herbicidas de diversos modos usando adyuvantes de formulación, tales como vehículos, disolventes y sustancias tensioactivas. Las formulaciones pueden estar en diversas formas físicas, por ej. en la forma de polvos para espolvoreo, geles, polvos humectables, gránulos dispersables en agua, comprimidos dispersables en agua, pellas efervescentes, concentrados emulsionables, concentrados microemulsionables, emulsiones de aceite en agua, fluidos oleosos, dispersiones acuosas, dispersiones oleosas, suspoemulsiones, suspensiones de cápsulas, gránulos emulsionables, líquidos solubles, concentrados solubles en agua (con agua o un disolvente orgánico miscible con agua como vehículo), películas polímeras impregnadas o en otras formas conocidas, por ej., de the Manual on Development and Use of FAO Specifications for Plant Protection Products, 5ª Edición, 1999. Tales formulaciones bien pueden usarse directamente o bien se diluyen antes del uso. Las diluciones pueden realizarse, por ejemplo, con agua, fertilizantes líquidos, micronutrientes, organismos biológicos, aceite o disolventes.

Las formulaciones pueden prepararse, por ej., al mezclar el ingrediente activo con los adyuvantes de formulación para obtener composiciones en la forma de sólidos finamente divididos, gránulos, soluciones, dispersiones o emulsiones. Los ingredientes activos también pueden formularse con otros adyuvantes, tales como sólidos finamente divididos, aceites minerales, aceites de origen vegetal o animal, aceites modificados de origen vegetal o animal, disolventes orgánicos, agua, sustancias tensioactivas o sus combinaciones. Los ingredientes activos también pueden estar contenidos en microcápsulas muy finas que consisten en un polímero. Las microcápsulas contienen los ingredientes activos en un vehículo poroso. Esto permite que los ingredientes activos se liberen al entorno en cantidades controladas (por ej.

liberación lenta). Las microcápsulas tienen habitualmente un diámetro de 0,1 a 500 micras. Contienen ingredientes activos en una cantidad de aproximadamente 25 a 95% en peso del peso de la cápsula. Los ingredientes activos pueden estar en la forma de un sólido monolítico, en la forma de partículas finas en dispersión sólida o líquida o en la forma de una dilución adecuada. Las membranas encapsulantes comprenden, por ejemplo, cauchos naturales o sintéticos, celulosa, copolímeros de estireno/butadieno, poliacrilonitrilo, poliácido, poliésteres, poliamidas, poliureas, poliuretano o polímeros químicamente modificados y xantatos de almidón u otros polímeros que son conocidos para el experto en la técnica relacionada. Alternativamente, pueden formarse microcápsulas muy finas en las que está contenido el ingrediente activo en la forma de partículas finamente divididas en una matriz sólida de sustancia de base, pero las microcápsulas no están ellas mismas encapsuladas.

Los adyuvantes de formulación que son adecuados para la preparación de las composiciones de acuerdo con la invención son conocidos de por sí. Como vehículos líquidos pueden usarse: agua, tolueno, xileno, éter de petróleo, aceites vegetales, acetona, metil-etil-cetona, ciclohexanona, anhídridos de ácido, acetónitrilo, acetofenona, acetato de amilo, 2-butanona, carbonato de butileno, clorobenceno, ciclohexano, ciclohexanol, ésteres alquílicos de ácido acético, diacetona alcohol, 1,2-dicloropropano, dietanolamina, p-dietilbenceno, dietilenglicol, abietato de dietilenglicol, éter butílico de dietilenglicol, éter etílico de dietilenglicol, éter metílico de dietilenglicol, N,N-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, 1,4-dioxano, dipropilenglicol, éter metílico de dipropilenglicol, dibenzoato de dipropilenglicol, diproxitol, alquilpirrolidona, acetato de etilo, 2-etilhexanol, carbonato de etileno, 1,1,1-tricloroetano, 2-heptanona, alfa-pineno, d-limoneno, lactato de etilo, etilenglicol, éter butílico de etilenglicol, éter metílico de etilenglicol, gamma-butirolactona, glicerol, acetato de glicerol, diacetato de glicerol, triacetato de glicerol, hexadecano, hexilenglicol, acetato de isoamilo, acetato de isobornilo, isooctano, isoforona, isopropilbenceno, miristato de isopropilo, ácido láctico, laurilamina, óxido de mesitilo, metoxipropanol, metil-isoamil-cetona, metil-isobutil-cetona, laurato de metilo, octanoato de metilo, oleato de metilo, cloruro de metileno, m-xileno, n-hexano, n-octilamina, ácido octadecanoico, acetato de octilamina, ácido oleico, oleilamina, o-xileno, fenol, polietilenglicol (PEG400), ácido propiónico, lactato de propilo, carbonato de propileno, propilenglicol, éter metílico de propilenglicol, p-xileno, tolueno, fosfato de trietilo, trietilenglicol, ácido xilenosulfónico, parafina, aceite mineral, tricloroetileno, percloroetileno, acetato de etilo, acetato de amilo, acetato de butilo, éter metílico de propilenglicol, éter metílico de dietilenglicol, metanol, etanol, isopropanol y alcoholes de peso molecular superior, tales como alcohol amílico, alcohol tetrahidrofurfurílico, hexanol, octanol, etilenglicol, propilenglicol, glicerol, N-metil-2-pirrolidona y similares. El agua es generalmente el vehículo de elección para diluir los concentrados. Vehículos sólidos adecuados son, por ejemplo, talco, dióxido de titanio, arcilla pirofilitica, sílice, arcilla atapulgítica, kiéselgur, piedra caliza, carbonato cálcico, bentonita, montmorillonita cálcica, hollejos de semillas de algodón, harina de trigo, harina de soja, piedra pómez, harina de madera, cáscaras de nuez trituradas, lignina y sustancias similares, según se describen, por ejemplo, en CPR 180.1001. (c) y (d).

Un gran número de sustancias tensioactivas puede usarse ventajosamente en formulaciones tanto sólidas como líquidas, especialmente en aquellas formulaciones que pueden diluirse con un vehículo antes del uso. Las sustancias tensioactivas pueden ser aniónicas, catiónicas, no iónicas o polímeras y pueden usarse como emulsionantes, agentes humectantes o agentes de suspensión o para otros propósitos. Sustancias tensioactivas típicas incluyen, por ejemplo, sales de sulfatos de alquilo, tales como laurilsulfato de dietanolamonio; sales de alquilarilsulfonatos, tales como dodecilsulfonato cálcico; productos de adición de alquilfenol/óxido de alquileno, tales como etoxilato de nonilfenol; productos de adición de alcohol/óxido de alquileno, tales como etoxilato de alcohol tridecílico; jabones, tales como estearato sódico; sales de alquilnaftalenosulfonatos, tales como dibutilnaftalenosulfonato sódico; ésteres dialquílicos de sales de sulfosuccinato, tales como di(2-etilhexil)sulfosuccinato sódico; ésteres de sorbitol, tales como oleato de sorbitol; aminas cuaternarias, tales como cloruro de lauriltrimetilamonio, ésteres polietilenglicólicos de ácidos grasos, tales como estearato de polietilenglicol; copolímeros de bloques de óxido de etileno y óxido de propileno; y sales de ésteres de mono- y di-alquilfosfato; y también sustancias adicionales descritas, por ej., en "McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual" MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey, 1981.

Adyuvantes adicionales que pueden usarse habitualmente en formulaciones plaguicidas incluyen inhibidores de la cristalización, modificadores de la viscosidad, agentes de suspensión, colorantes, antioxidantes, agentes espumantes, absorbentes de luz, agentes auxiliares para mezcla, antiespumantes, agentes complejantes, sustancias neutralizantes o modificadoras del pH y tampones, inhibidores de la corrosión, fragancias, agentes humectantes, potenciadores de la captación, micronutrientes, plastificantes, deslizantes, lubricantes, dispersantes, espesantes, anticongelantes, microbicidas y también fertilizantes líquidos y sólidos.

Las composiciones de acuerdo con la invención pueden incluir adicionalmente un aditivo que comprende un aceite de origen vegetal o animal, un aceite mineral, ésteres alquílicos de tales aceites o mezclas de tales aceites y derivados de aceite. La cantidad de aditivo oleoso en la composición de acuerdo con la invención es generalmente de 0,01 a 10%, basada en la mezcla de pulverización. Por ejemplo, el aditivo oleoso puede añadirse al tanque de pulverización en la concentración deseada después de que se haya preparado la mezcla de pulverización. Aditivos oleosos preferidos comprenden aceites minerales o un aceite de origen vegetal, por ejemplo aceite de colza, aceite de oliva o aceite de girasol, un aceite vegetal emulsionado, tal como AMIGO® (Rhone-Poulenc Canada Inc.), ésteres alquílicos de aceites de origen vegetal, por ejemplo los derivados metílicos o un aceite de origen animal, tal como aceite de pescado o sebo de ternero. Un aditivo preferido contiene, por ejemplo, como componentes activos esencialmente 80% en peso de ésteres alquílicos de aceites de pescado y 15% en peso de aceite de colza metilado, y además 5% en peso de emulsionantes y modificadores del pH habituales. Aditivos oleosos especialmente preferidos comprenden ésteres alquílicos de ácidos grasos C₈-C₂₂, siendo de importancia especialmente los derivados metílicos de ácidos grasos

ES 2 333 977 T3

C₁₂-C₁₈, por ejemplo los ésteres metílicos de ácido láurico, ácido palmítico y ácido oleico. Esos ésteres se conocen como laurato de metilo (CAS-111-82-0), palmitato de metilo (CAS-112-39-0) y oleato de metilo (CAS-112-62-9). Un derivado de éster metílico de ácido graso preferido es Emery® 2230 y 2231 (Cognis GmbH). Estos y otros derivados oleosos se conocen además de the Compendium of Herbicide Adjuvants, 5ª Edición, Southern Illinois University, 2000.

La aplicación y la acción de los aditivos oleosos pueden mejorarse adicionalmente mediante la combinación con sustancias tensioactivas, tales como surfactantes no iónicos, aniónicos o catiónicos. Ejemplos de surfactantes aniónicos, no iónicos y catiónicos adecuados se listan en las páginas 7 y 8 del documento WO 97/34485. Sustancias tensioactivas preferidas son surfactantes aniónicos del tipo del dodecibencilsulfonato, especialmente sus sales cálcicas, y también surfactantes no iónicos del tipo de los etoxilatos de alcohol graso. Se da una preferencia especial a alcoholes grasos C₁₂-C₂₂ etoxilados que tienen un grado de etoxilación de 5 a 40. Ejemplos de surfactantes disponibles comercialmente son los tipos Genapol (Clariant AG). También se prefieren los surfactantes silicónicos, especialmente heptametiltriloxanos modificados con poli(óxido de alquilo) que están disponibles comercialmente, por ej. como Silwet L-77®, y también surfactantes perfluorados. La concentración de las sustancias tensioactivas en relación con el aditivo total es generalmente de 1 a 30% en peso. Ejemplos de aditivos oleosos que consisten en mezclas de aceite o aceites minerales o sus derivados con surfactantes son Edenor ME SU®, Turbocharge® (Syngenta AG, CH) o ActipronC (BP Oil UK Limited, GB).

Si se desea, también es posible que las sustancias tensioactivas mencionadas se usen en las formulaciones por sí mismas, es decir sin aditivos oleosos.

Por otra parte, la adición de un disolvente orgánico a la mezcla de aditivo oleoso/surfactante puede contribuir a una potenciación adicional de la acción. Disolventes adecuados son, por ejemplo, Solvesso® (ESSO) o Aromatic Solvent® (Exxon Corporation). La concentración de tales disolventes puede ser de 10 a 80% en peso del peso total. Aditivos oleosos que están presentes mezclados con disolventes se describen, por ejemplo, en el documento US-A4.834.908. Un aditivo oleoso disponible comercialmente divulgado allí es conocido por el nombre MERGE® (BASF Corporation). Un aditivo oleoso adicional que se prefiere de acuerdo con la invención es SCORE® (Syngenta Crop Protection Canada).

Además de los aditivos oleosos listados anteriormente, con el propósito de potenciar la acción de las composiciones de acuerdo con la invención, también es posible añadir a la mezcla de pulverización formulaciones de alquilpirrolidonas (por ej. Agrimax®). También pueden usarse formulaciones de látices sintéticos, por ej. poliacrilamida, compuestos polivinílicos o poli-1-p-menteno (por ej. Bond®, Courier® o Emerald®). También es posible añadir a la mezcla de pulverización soluciones que contienen ácido propiónico, por ejemplo Eurogkem Pen-e-trate®, como agente potenciador de la acción.

Las composiciones herbicidas comprenden generalmente de 0,1 a 99% en peso, especialmente de 0,1 a 95% en peso, de compuestos de fórmula I y de 1 a 99,9% en peso de un adyuvante de formulación que incluye preferiblemente de 0 a 25% en peso de una sustancia tensioactiva. Mientras que los productos comerciales se formularán preferiblemente como concentrados, el usuario final empleará normalmente formulaciones diluidas.

Las dosis de aplicación de los compuestos de fórmula I variarán dentro de límites amplios y dependen de la naturaleza del suelo, el método de aplicación (antes o después del brote; recubrimiento de semillas; aplicación a la hilera de siembra; aplicación sin labranza, etc.), la planta de cultivo, la hierba o mala hierba que ha de controlarse, las condiciones climáticas imperantes y otros factores gobernados por el método de aplicación, la época de la aplicación y el cultivo elegido. Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención se aplican generalmente en una dosis de 10 a 2000 g/ha, especialmente de 50 a 1000 g/ha.

Las formulaciones preferidas tienen especialmente las siguientes composiciones (% = porcentaje en peso):

Concentrados emulsionables

ingrediente activo:	1 a 95%, preferiblemente 60 a 90%
agente tensioactivo:	1 a 30%, preferiblemente 5 a 20%
vehículo líquido:	1 a 80%, preferiblemente 1 a 35%

Polvos de espolvoreo

ingrediente activo:	0,1 a 10%, preferiblemente 0,1 a 5%
vehículo sólido:	99,9 a 90%, preferiblemente 99,9 a 99%

ES 2 333 977 T3

Concentrados en suspensión

	ingrediente activo:	5 a 75%, preferiblemente 10 a 50%
5	agua:	94 a 24%, preferiblemente 88 a 30%
	agente tensioactivo:	1 a 40%, preferiblemente 2 a 30%

10 Polvos humectables

	ingrediente activo:	0,5 a 90%, preferiblemente 1 a 80%
	agente tensioactivo:	0,5 a 20%, preferiblemente 1 a 15%
15	vehículo sólido:	5 a 95%, preferiblemente 15 a 90%

Gránulos

20	ingrediente activo:	0,1 a 30%, preferiblemente 0,1 a 15%
	vehículo sólido:	99,5 a 70%, preferiblemente 97 a 85%

25 Los siguientes Ejemplos ilustran adicionalmente, pero no limitan, la invención.

Ejemplos de Formulación para herbicidas de fórmula I (% = % en peso)

30	<u>F1. Concentrados emulsionables</u>	a)	b)	c)	d)
	ingrediente activo	5%	10%	25%	50%
35	dodecilbencenosulfonato cálcico	6%	8%	6%	8%
	éter poliglicólico de aceite de ricino (36 moles de óxido de etileno)	4%	—	4%	4%
40	éter poliglicólico de octilfenol (7-8 moles de óxido de etileno)	—	4%	—	2%
	NMP	—	—	10%	20%
45	mezcla de hidrocarburos aromáticos C ₉ -C ₁₂	85%	78%	55%	16%

50 Pueden obtenerse emulsiones de cualquier concentración deseada a partir de tales concentrados mediante dilución con agua.

	<u>F2. Soluciones</u>	a)	b)	c)	d)
55	ingrediente activo	5%	10%	50%	90%
	1-metoxi-3-(3-metoxipropoxi)-propano	—	20%	20%	—
	polietilenglicol PM 400	20%	10%	—	—
60	NMP	—	—	30%	10%
	mezcla de hidrocarburos aromáticos C ₉ -C ₁₂	75%	60%	—	—

65 Las soluciones son adecuadas para el uso en forma de microgotas.

ES 2 333 977 T3

F3. Polvos humectables

	a)	b)	c)	d)
ingrediente activo	5%	25%	50%	80%
5 lignosulfonato sódico	4%	—	3%	—
laurilsulfato sódico	2%	3%	—	4%
diisobutilnaftalenosulfonato sódico	—	6%	5%	6%
10 éter poliglicólico de octilfenol (7-8 moles de óxido de etileno)	—	1%	2%	—
ácido silícico altamente dispersado	1%	3%	5%	10%
15 caolín	88%	62%	35%	—

El ingrediente activo se mezcla a fondo con los adyuvantes y la mezcla se tritura a fondo en un molino adecuado, proporcionando polvos humectables que pueden diluirse con agua para dar suspensiones de cualquier concentración deseada.

F4. Gránulos revestidos

	a)	b)	c)
25 ingrediente activo	0,1%	5%	15%
ácido silícico altamente dispersado	0,9%	2%	2%
vehículo inorgánico	99,0%	93%	83%
30 (diámetro 0,1-1 mm)			
por ej. CaCO_3 o SiO_2			

El ingrediente activo se disuelve en cloruro de metileno y se aplica al vehículo mediante pulverización, y el disolvente se separa por evaporación a vacío.

F5. Gránulos revestidos

	a)	b)	c)
40 ingrediente activo	0,1%	5%	15%
polietilenglicol PM 200	1,0%	2%	3%
45 ácido silícico altamente dispersado	0,9%	1%	2%
vehículo inorgánico	98,0%	92%	80%
(diámetro 0,1-1 mm)			
50 por ej. CaCO_3 o SiO_2			

El ingrediente activo finamente triturado se aplica uniformemente, en un mezclador, al vehículo humedecido con polietilenglicol. Se obtienen de este modo gránulos revestidos no pulverulentos.

F6. Gránulos de extrusora

	a)	b)	c)	d)
ingrediente activo	0,1%	3%	5%	15%
60 lignosulfonato sódico	1,5%	2%	3%	4%
carboximetilcelulosa	1,4%	2%	2%	2%
caolín	97,0%	93%	90%	79%

El ingrediente activo se mezcla y se tritura con los adyuvantes y la mezcla se humedece con agua. La mezcla se extruye y a continuación se seca en una corriente de aire.

ES 2 333 977 T3

F7. Polvos de espolvoreo

	a)	b)	c)
ingrediente activo	0,1%	1%	5%
talco	39,9%	49%	35%
caolín	60,0%	50%	60%

Se obtienen polvos de espolvoreo listos para usar al mezclar el ingrediente activo con los vehículos y triturar la mezcla en un molino adecuado.

F1. Concentrados para suspensiones

	a)	b)	c)	d)
ingrediente activo	3%	10%	25%	50%
etilenglicol	5%	5%	5%	5%
éter poliglicólico de nonilfenol (15 moles de óxido de etileno)	-	1%	2%	-
lignosulfonato sódico	3%	3%	4%	5%
carboximetilcelulosa	1%	1%	1%	1%
solución acuosa de formaldehído al 37%	0,2%	0,2%	0,2%	0,2%
emulsión oleosa de silicona	0,8%	0,8%	0,8%	0,8%
agua	87%	79%	62%	38%

El ingrediente activo finamente triturado se mezcla íntimamente con los adyuvantes, dando un concentrado para suspensiones a partir del cual pueden obtenerse suspensiones de cualquier concentración deseada mediante dilución con agua.

La invención se refiere además a un método para el control selectivo de hierbas y malas hierbas en cultivos de plantas útiles, en el que las plantas útiles o su área de cultivo o emplazamiento se trata con los compuestos de fórmula I.

Cultivos de plantas útiles en los que puede usarse la composición de acuerdo con la invención incluyen especialmente maíz, soja, algodón, cereales, por ej. trigo y cebada, arroz, caña de azúcar, remolacha azucarera, girasoles y colza. También debe entenderse que los cultivos incluyen aquellos cultivos que se han hecho tolerantes a herbicidas o clases de herbicidas (por ej. inhibidores de ALS, GS, EPSPS, PPO y HPPD) mediante métodos convencionales de reproducción o mediante ingeniería genética. Un ejemplo de un cultivo que se ha hecho tolerante a imidazolinonas, por ej. imazamox, mediante métodos convencionales de reproducción es colza de verano (canola) Clearfield®. Ejemplos de cultivos que se han hecho tolerantes a herbicidas mediante métodos de ingeniería genética incluyen, por ej., variedades de maíz resistentes a glifosato y glufosinato disponibles comercialmente bajo los nombres comerciales RoundupReady® y Libertilink®. Las malas hierbas que han de controlarse pueden ser malas hierbas tanto monocotiledóneas como dicotiledóneas, por ejemplo *Stellaria*, *Nasturtium*, *Agrostis*, *Digitaria*, *Avena*, *Setaria*, *Sinapis*, *Lolium*, *Solanum*, *Echinochloa*, *Scirpus*, *Monochoria*, *Sagittaria*, *Bromus*, *Alopecurus*, *Sorghum*, *Rottboellia*, *Cyperus*, *Abutilon*, *Sida*, *Xanthium*, *Amaranthus*, *Chenopodium*, *Ipomoea*, *Chrysanthemum*, *Galium*, *Viola* y *Veronica*.

También debe entenderse que los cultivos son aquellos que se han hecho resistentes a insectos dañinos mediante métodos de ingeniería genética, por ejemplo maíz Bt (resistente al piral del maíz), algodón Bt (resistente al gorgojo de las cápsulas del algodón) y también patatas Bt (resistentes al escarabajo de la patata). Ejemplos de maíz Bt son los híbridos de maíz Bt 176 de NK® (Syngenta Seeds). La toxina Bt es una proteína que es formada naturalmente por la bacteria del suelo *Bacillus thuringiensis*. Ejemplos de toxinas o plantas transgénicas capaces de sintetizar tales toxinas se describen en los documentos EP-A-451 878, EP-A-374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, WO 03/052073 y EP-A-427 529. Ejemplos de plantas transgénicas que comprenden uno o más genes que codifican para una resistencia insecticida y expresan una o más toxinas son KnockOut® (maíz), Yield Gard® (maíz), NuCOTIN33B® (algodón), Bollgard® (algodón), NewLeaf® (patatas), NatureGard® y Protexcta®. Los cultivos de plantas o su material de siembra pueden ser tanto resistentes a herbicidas como, al mismo tiempo, resistentes a la alimentación por insectos (episodios transgénicos "superpuestos"). Por ejemplo, las semillas pueden tener la capacidad para expresar una proteína Cry3 insecticida mientras que al mismo tiempo son tolerantes a glifosato. También debe entenderse que los cultivos son aquellos que se obtienen mediante métodos convencionales de reproducción o ingeniería genética y contienen los llamados rasgos añadidos ("output traits") (por ej. estabilidad al almacenamiento mejorada, valor nutricional superior y sabor mejorado).

Áreas bajo labranza incluyen terreno sobre el cual las plantas de cultivo ya están creciendo y terreno destinado a la labranza con esas plantas de cultivo.

Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención también pueden usarse en combinación con uno o más herbicidas diferentes. En particular, son importantes las siguientes mezclas del compuesto de fórmula I:

- compuesto de fórmula I + acetocloro, compuesto de fórmula I + acifluorfen, compuesto de fórmula I + acifluorfen-sodio, compuesto de fórmula I + aclonifeno, compuesto de fórmula I + acroleína, compuesto de fórmula I + alacloro, compuesto de fórmula I + aloxidim, compuesto de fórmula I + alcohol alílico, compuesto de fórmula I + ametrina, compuesto de fórmula I + amicarbazona, compuesto de fórmula I + amidosulfurón, compuesto de fórmula I + aminopiridil, compuesto de fórmula I + amitrol, compuesto de fórmula I + sulfamato amónico, compuesto de fórmula I + anilofos, compuesto de fórmula I + asulam, compuesto de fórmula I + atratón, compuesto de fórmula I + atrazina, compuesto de fórmula I + azimsulfurón, compuesto de fórmula I + BCPC, compuesto de fórmula I + beflubutamid, compuesto de fórmula I + benazolin, compuesto de fórmula I + benfluralin, compuesto de fórmula I + benfuresato, compuesto de fórmula I + bensulfurón, compuesto de fórmula I + bensulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + bensulida, compuesto de fórmula I + bentazona, compuesto de fórmula I + benzfendizona, compuesto de fórmula I + benzbiciclón, compuesto de fórmula I + benzofenap, compuesto de fórmula I + bifenox, compuesto de fórmula I + bilanafos, compuesto de fórmula I + bispiribac, compuesto de fórmula I + bispiribac-sodio, compuesto de fórmula I + bórax, compuesto de fórmula I + bromacil, compuesto de fórmula I + bromobutida, compuesto de fórmula I + bromoxinil, compuesto de fórmula I + butacloro, compuesto de fórmula I + butafenacil, compuesto de fórmula I + butamifos, compuesto de fórmula I + butralin, compuesto de fórmula I + butroxidim, compuesto de fórmula I + butilato, compuesto de fórmula I + ácido cacodílico, compuesto de fórmula I + clorato cálcico, compuesto de fórmula I + cafenstrol, compuesto de fórmula I + carbetamida, compuesto de fórmula I + carfentazona, compuesto de fórmula I + carfentazona-etilo, compuesto de fórmula I + CDEA, compuesto de fórmula I + CEPC, compuesto de fórmula I + cloroflurenol, compuesto de fórmula I + cloroflurenol-metilo, compuesto de fórmula I + cloridazón, compuesto de fórmula I + cloroimurón, compuesto de fórmula I + cloroimurón-etilo, compuesto de fórmula I + ácido cloroacético, compuesto de fórmula I + clorotolurón, compuesto de fórmula I + cloroprofam, compuesto de fórmula I + clorosulfurón, compuesto de fórmula I + clorotal, compuesto de fórmula I + clorotal-dimetilo, compuesto de fórmula I + cinidón-etilo, compuesto de fórmula I + cinmetilín, compuesto de fórmula I + cinosulfurón, compuesto de fórmula I + cisanilida, compuesto de fórmula I + cletodim, compuesto de fórmula I + clodinafop, compuesto de fórmula I + clodinafop-propargilo, compuesto de fórmula I + clomazona, compuesto de fórmula I + clomeprop, compuesto de fórmula I + clopiridil, compuesto de fórmula I + cloransulam, compuesto de fórmula I + cioransulam-metilo, compuesto de fórmula I + CMA, compuesto de fórmula I + 4-CPB, compuesto de fórmula I + CPMF, compuesto de fórmula I + 4-CPP, compuesto de fórmula I + CPPC, compuesto de fórmula I + cresol, compuesto de fórmula I + cumilurón, compuesto de fórmula I + cianamida, compuesto de fórmula I + cianazina, compuesto de fórmula I + cicloato, compuesto de fórmula I + ciclosulfamurón, compuesto de fórmula I + cicloxidim, compuesto de fórmula I + cihalofop, compuesto de fórmula I + cihalofop-butilo, compuesto de fórmula I + 2,4-D, compuesto de fórmula I + 3,4-DA, compuesto de fórmula I + daimurón, compuesto de fórmula I + dalapón, compuesto de fórmula I + dazomet, compuesto de fórmula I + 2,4-DB, compuesto de fórmula I + 3,4-DB, compuesto de fórmula I + 2,4-DEB, compuesto de fórmula I + desmedifam, compuesto de fórmula I + dicamba, compuesto de fórmula I + diclobenil, compuesto de fórmula I + ortodichlorobenceno, compuesto de fórmula I + para-dichlorobenceno, compuesto de fórmula I + dicloroprop, compuesto de fórmula I + dicloroprop-P, compuesto de fórmula I + diclofop, compuesto de fórmula I + diclofop-metilo, compuesto de fórmula I + diclosulam, compuesto de fórmula I + difenzoquat, compuesto de fórmula I + metilsulfato de difenzoquat, compuesto de fórmula I + diflufenicán, compuesto de fórmula I + diflufenzopir, compuesto de fórmula I + dimefurón, compuesto de fórmula I + dimepiperato, compuesto de fórmula I + dimetacloro, compuesto de fórmula I + dimetametrina, compuesto de fórmula I + dimetenamid, compuesto de fórmula I + dimetenamid-P, compuesto de fórmula I + dimetipín, compuesto de fórmula I + ácido dimetilaránico, compuesto de fórmula I + dinitramina, compuesto de fórmula I + dinoterb, compuesto de fórmula I + difenamid, compuesto de fórmula I + diquat, compuesto de fórmula I + dibromuro de diquat, compuesto de fórmula I + ditiopir, compuesto de fórmula I + diuron, compuesto de fórmula I + DNOC, compuesto de fórmula I + 3,4-DP, compuesto de fórmula I + DSMA, compuesto de fórmula I + EBEP, compuesto de fórmula I + endotal, compuesto de fórmula I + EPTC, compuesto de fórmula I + esprocarb, compuesto de fórmula I + etalfluralin, compuesto de fórmula I + etametsulfurón, compuesto de fórmula I + etametsulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + etofumesato, compuesto de fórmula I + etoxifén, compuesto de fórmula I + etoxisulfurón, compuesto de fórmula I + etobenzanid, compuesto de fórmula I + fenoxaprop-P, compuesto de fórmula I + fenoxaprop-P-etilo, compuesto de fórmula I + fentrazamida, compuesto de fórmula I + sulfato ferroso, compuesto de fórmula I + flazifop-M, compuesto de fórmula I + flazasulfurón, compuesto de fórmula I + florasulam, compuesto de fórmula I + fluzifop, compuesto de fórmula I + fluzifop-butilo, compuesto de fórmula I + fluzifop-P, compuesto de fórmula I + fluzifop-P-butilo, compuesto de fórmula I + flucarbazona, compuesto de fórmula I + flucarbazona-sodio, compuesto de fórmula I + flucetosulfurón, compuesto de fórmula I + flucloalín, compuesto de fórmula I + flufenacet, compuesto de fórmula I + flufenpir, compuesto de fórmula I + flufenpir-etilo, compuesto de fórmula I + flumetsulam, compuesto de fórmula I + flumiclorac, compuesto de fórmula I + flumiclorac-pentilo, compuesto de fórmula I + flumioxazín, compuesto de fórmula I + fluometurón, compuesto de fórmula I + fluoroglicofén, compuesto de fórmula I + fluoroglicofén-etilo, compuesto de fórmula I + flupropanato, compuesto de fórmula I + flupirsulfurón, compuesto de fórmula I + flupirsulfurón-metil-sodio, compuesto de fórmula I + flurenol, compuesto de fórmula I + fluridona, compuesto de fórmula I + fluorocloridona, compuesto de fórmula I + fluoxipir, compuesto de fórmula I + flurtamona, compuesto de fórmula I + flutiacet, compuesto de fórmula I + flutiacet-metilo, compuesto de fórmula I + fomesafén, compuesto de fórmula I + foramsulfurón, compuesto de fórmula I + fosamina, compuesto de fórmula I + glufosinato, compuesto de fórmula I + glufosinato-amonio, compuesto de fórmula I + glifosato, compuesto de fórmula I + halosulfurón, compuesto de fórmula I + halosulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + haloxifop, compuesto de fórmula I + haloxifop-P, compuesto de fórmula I + HC-252, compuesto de fórmula I + hexazinona, compuesto de fórmula I + imazametabenz, compuesto de fórmula I + imazametabenz-metilo, compuesto de fórmula I + imazamox, compuesto

de fórmula I + imazapic, compuesto de fórmula I + imazapir, compuesto de fórmula I + imazaquín, compuesto de fórmula I + imazetapir, compuesto de fórmula I + imazosulfurón, compuesto de fórmula I + indanofán, compuesto de fórmula I + yodometano, compuesto de fórmula I + yodosulfurón, compuesto de fórmula I + yodosulfurón-metil-sodio, compuesto de fórmula I + ioxinil, compuesto de fórmula I + isoproturón, compuesto de fórmula I + isourón, compuesto de fórmula I + isoxabén, compuesto de fórmula I + isoxaclorotol, compuesto de fórmula I + isoxaflutol, compuesto de fórmula I + karbutilato, compuesto de fórmula I + lactofén, compuesto de fórmula I + lenacil, compuesto de fórmula I + linurón, compuesto de fórmula I + MAA, compuesto de fórmula I + MAMA, compuesto de fórmula I + MCPA, compuesto de fórmula I + MCPA-tioetilo, compuesto de fórmula I + MCPB, compuesto de fórmula I + mecoprop, compuesto de fórmula I + mecoprop-P, compuesto de fórmula I + mefenacet, compuesto de fórmula I + mefluidida, compuesto de fórmula I + mesosulfurón, compuesto de fórmula I + mesosulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + mesotriona, compuesto de fórmula I + metam, compuesto de fórmula I + metamifop, compuesto de fórmula I + metamitrón, compuesto de fórmula I + metazacloro, compuesto de fórmula I + metabenziazurón, compuesto de fórmula I + ácido metilarsónico, compuesto de fórmula I + metildimrón, compuesto de fórmula I + isotiocianato de metilo, compuesto de fórmula I + metobenzurón, compuesto de fórmula I + metolacloro, compuesto de fórmula I + S-metolacloro, compuesto de fórmula I + metosulam, compuesto de fórmula I + metoxurón, compuesto de fórmula I + metribuzín, compuesto de fórmula I + metsulfurón, compuesto de fórmula I + metsulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + MK-616, compuesto de fórmula I + molinato, compuesto de fórmula I + monolinurón, compuesto de fórmula I + MSMA, compuesto de fórmula I + naproanilida, compuesto de fórmula I + napropamida, compuesto de fórmula I + naptalam, compuesto de fórmula I + neburón, compuesto de fórmula I + nicosulfurón, compuesto de fórmula I + ácido nonanoico, compuesto de fórmula I + norflurazón, compuesto de fórmula I + ácido oleico (ácidos grasos), compuesto de fórmula I + orbencarb, compuesto de fórmula I + ortosulfamurón, compuesto de fórmula I + orizalín, compuesto de fórmula I + oxadiargilo, compuesto de fórmula I + oxadiazón, compuesto de fórmula I + oxasulfurón, compuesto de fórmula I + oxaziclomefona, compuesto de fórmula I + oxifluorfen, compuesto de fórmula I + paraquat, compuesto de fórmula I + dicloruro de paraquat, compuesto de fórmula I + pebulato, compuesto de fórmula I + pendimetalín, compuesto de fórmula I + penoxsulam, compuesto de fórmula I + pentaclorofenol, compuesto de fórmula I + pentanocloro, compuesto de fórmula I + pentoxazona, compuesto de fórmula I + petoxamid, compuesto de fórmula I + crudos de petróleo, compuesto de fórmula I + fenmedifam, compuesto de fórmula I + fenmedifam-etilo, compuesto de fórmula I + picloram, compuesto de fórmula I + picolinafén, compuesto de fórmula I + pinoxadén, compuesto de fórmula I + piperofos, compuesto de fórmula I + arsenito potásico, compuesto de fórmula I + azida potásica, compuesto de fórmula I + pretilacloro, compuesto de fórmula I + primisulfurón, compuesto de fórmula I + primisulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + prodiamina, compuesto de fórmula I + profluzol, compuesto de fórmula I + profoxidim, compuesto de fórmula I + prometón, compuesto de fórmula I + prometrina, compuesto de fórmula I + propacloro, compuesto de fórmula I + propanil, compuesto de fórmula I + propaquizafop, compuesto de fórmula I + propazina, compuesto de fórmula I + profam, compuesto de fórmula I + propisocloro, compuesto de fórmula I + propoxicarbazona, compuesto de fórmula I + propoxicarbazona-sodio, compuesto de fórmula I + propizamida, compuesto de fórmula I + prosulfocarb, compuesto de fórmula I + prosulfurón, compuesto de fórmula I + piraclonil, compuesto de fórmula I + piraflufén, compuesto de fórmula I + piraflufén-etilo, compuesto de fórmula I + pirazolinato, compuesto de fórmula I + pirazosulfurón, compuesto de fórmula I + pirazosulfurón-etilo, compuesto de fórmula I + pirazoxifén, compuesto de fórmula I + piribenzoxim, compuesto de fórmula I + piributicarb, compuesto de fórmula I + piridafol, compuesto de fórmula I + piridato, compuesto de fórmula I + piritalid, compuesto de fórmula I + piriminobac, compuesto de fórmula I + piriminobac-metilo, compuesto de fórmula I + pirimisulfán, compuesto de fórmula I + piritiobac, compuesto de fórmula I + piritiobac-sodio, compuesto de fórmula I + quinclozac, compuesto de fórmula I + quinmerac, compuesto de fórmula I + quincloclamina, compuesto de fórmula I + quizalofop, compuesto de fórmula I + quizalofop-P, compuesto de fórmula I + rimsulfurón, compuesto de fórmula I + setoxidim, compuesto de fórmula I + sidurón, compuesto de fórmula I + simazina, compuesto de fórmula I + simetrina, compuesto de fórmula I + SMA, compuesto de fórmula I + arsenito sódico, compuesto de fórmula I + azida sódica, compuesto de fórmula I + cloroato sódico, compuesto de fórmula I + sulcotriona, compuesto de fórmula I + sulfentrazona, compuesto de fórmula I + sulfometurón, compuesto de fórmula I + sulfometurón-metilo, compuesto de fórmula I + sulfosulfurón, compuesto de fórmula I + ácido sulfúrico, compuesto de fórmula I + aceites de alquitrán, compuesto de fórmula I + 2,3,6-TBA, compuesto de fórmula I + TCA, compuesto de fórmula I + TCA-sodio, compuesto de fórmula I + tebutiurón, compuesto de fórmula I + tepraloxidim, compuesto de fórmula I + terbacil, compuesto de fórmula I + terbutetón, compuesto de fórmula I + terbutilazina, compuesto de fórmula I + terbutrina, compuesto de fórmula I + tenilcloro, compuesto de fórmula I + tiazopir, compuesto de fórmula I + tifensulfurón, compuesto de fórmula I + tifensulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + tiobencarb, compuesto de fórmula I + tiocarbazil, compuesto de fórmula I + topramezona, compuesto de fórmula I + tralcoxidim, compuesto de fórmula I + trialato, compuesto de fórmula I + triasulfurón, compuesto de fórmula I + triaziflam, compuesto de fórmula I + tribenurón, compuesto de fórmula I + tribenurón-metilo, compuesto de fórmula I + tricamba, compuesto de fórmula I + triclopir, compuesto de fórmula I + trietazina, compuesto de fórmula I + trifloxisulfurón, compuesto de fórmula I + trifloxisulfurón-sodio, compuesto de fórmula I + trifluralín, compuesto de fórmula I + triflusulfurón, compuesto de fórmula I + triflusulfurón-metilo, compuesto de fórmula I + trihidroxitriazina, compuesto de fórmula I + tritosulfurón, compuesto de fórmula I + éster etílico de ácido [3[2-cloro-4-fluoro-5-(1-metil-6-trifluorometil-2,4-dioxo-1,2,3,4-tetrahidropirimidin-3-il)fenoxi]-2-piridiloxi]acético.

Los socios de mezcladura del compuesto de fórmula I también pueden estar en forma de ésteres o sales, según se menciona, por ej., en The Pesticide Manual, 12ª Edición (BCPC), 2000.

La relación de mezcladura del compuesto de fórmula I al socio de mezcladura es preferiblemente de 1:100 a 1000:1.

ES 2 333 977 T3

Las mezclas pueden usarse ventajosamente en las formulaciones mencionadas anteriormente (en cuyo caso, “ingrediente activo” se refiere a la mezcla respectiva de compuesto de fórmula I con el socio de mezcladura).

Mezclas preferidas de un compuesto de fórmula I con uno o más herbicidas adicionales incluyen:

Mezclas de un compuesto de la fórmula I con una triazina (por ej. compuesto de fórmula I + ametrina, compuesto de fórmula I + atrazina, compuesto de fórmula I + cianazina, compuesto de fórmula I + dimetametrina, compuesto de fórmula I + metribuzín, compuesto de fórmula I + prometón, compuesto de fórmula I + prometrina, compuesto de fórmula I + propazina, compuesto de fórmula I + simazina, compuesto de fórmula I + simetrina, compuesto de fórmula I + terbutetión, compuesto de fórmula I + terbutilazina, compuesto de fórmula I + terbutrina, compuesto de fórmula I + trietazina). Particularmente preferidas son mezclas de un compuesto de fórmula I con atrazina, metribuzín, prometón o con terbutilazina (es decir, compuesto de fórmula I + atrazina, compuesto de fórmula I + metribuzín, compuesto de fórmula I + prometrina y compuesto de fórmula I + terbutilazina).

Mezclas de un compuesto de fórmula I con isoxaflutol.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con isoxaflutol y una triazina.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con isoxaflutol y glifosato.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con isoxaflutol y glufosinato.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con mesotriona.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con mesotriona y una triazina.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con mesotriona y glifosato.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con mesotriona y glufosinato.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con sulcotriona.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con sulcotriona y una triazina.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con sulcotriona y glifosato.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con sulcotriona y glufosinato.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con una triazolinona (por ej. compuesto de fórmula I + amicarbazona).

Mezclas de un compuesto de fórmula I con un inhibidor de ALS (por ej. compuesto de fórmula I + clorosulfurón, compuesto de fórmula I + cinosulfurón, compuesto de fórmula I + cloransulam, compuesto de fórmula I + etametsulfurón, compuesto de fórmula I + flazasulfurón, compuesto de fórmula I + foramsulfurón, compuesto de fórmula I + flumetsulam, compuesto de fórmula I + imazametabenz, compuesto de fórmula I + imazamox, compuesto de fórmula I + imazapic, compuesto de fórmula I + imazapir, compuesto de fórmula I + imazetapir, compuesto de fórmula I + yodosulfurón, compuesto de fórmula I + metsulfurón, compuesto de fórmula I + nicosulfurón, compuesto de fórmula I + oxasulfurón, compuesto de fórmula I + primisulfurón, compuesto de fórmula I + prosulfurón, compuesto de fórmula I + piritiobac, compuesto de fórmula I + rimsulfurón, compuesto de fórmula I + sulfosulfurón, compuesto de fórmula I + tifensulfurón, compuesto de fórmula I + triasulfurón, compuesto de fórmula I + tribenurón, compuesto de fórmula I + trifloxisulfurón, compuesto de fórmula I + ácido 4-[(4,5-dihidro-3-metoxi-4-metil-5-oxo)-1H-1,2,4-triazol-1-ilcarbonilsulfamoil]-5-metiltiofeno-3-carboxílico (BAY636)). Se prefieren particularmente mezclas de un compuesto de fórmula I con flazasulfurón, foramsulfurón, flumetsulam, imazapir, imazetapir, yodosulfurón, nicosulfurón, rimsulfurón, trifloxisulfurón o con ácido 4-[(4,5-dihidro-3-metoxi-4-metil-5-oxo)-1H-1,2,4-triazol-1-ilcarbonilsulfamoil]-5-metiltiofeno-3-carboxílico (BAY636) (es decir, compuesto de fórmula I + flazasulfurón, compuesto de fórmula I + foramsulfurón, compuesto de fórmula I + flumetsulam, compuesto de fórmula I + imazapir, compuesto de fórmula I + imazetapir, compuesto de fórmula I + yodosulfurón, compuesto de fórmula I + nicosulfurón, compuesto de fórmula I + rimsulfurón, compuesto de fórmula I + trifloxisulfurón y compuesto de fórmula I + ácido 4-[(4,5-dihidro-3-metoxi-4-metil-5-oxo)-1H-1,2,4-triazol-1-ilcarbonilsulfamoil]-5-metiltiofeno-3-carboxílico (BAY636)).

Mezclas de un compuesto de fórmula I con un inhibidor de PPO (por ej. compuesto de fórmula I + fomesafén, compuesto de fórmula I + flumioxazín, compuesto de fórmula I + sulfentrazona, compuesto de fórmula I + éster etílico de ácido [3-[2-cloro-4-fluoro-5-(1-metil-6-trifluorometil-2,4-dioxo-1,2,3,4-tetrahidropirimidin-3-il)fenoxi]-2-piridiloxi]acético). Se prefieren particularmente mezclas de un compuesto de fórmula I con flumioxazín, sulfentrazona o éster etílico de ácido [3-[2-cloro-4-fluoro-5-(1-metil-6-trifluorometil-2,4-dioxo-1,2,3,4-tetrahidropirimidin-3-il)fenoxi]-2-piridiloxi]acético (es decir, compuesto de fórmula I + flumioxazín, compuesto de fórmula I + sulfentrazona y compuesto de fórmula I + éster etílico de ácido [3-[2-cloro-4-fluoro-5-(1-metil-6-trifluorometil-2,4-dioxo-1,2,3,4-tetrahidropirimidin-3-il)fenoxi]-2-piridiloxi]acético).

ES 2 333 977 T3

Mezclas de un compuesto de fórmula I con glifosato.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con glufosinato.

5 Mezclas de un compuesto de fórmula I con paraquat.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con pendimetalín o un compuesto de fórmula I con trifluralín. Se prefieren particularmente mezclas de un compuesto de fórmula I con pendimetalín.

10 Mezclas de un compuesto de fórmula I con metamitrón.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con clomazona.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con metazaclo.

15 Mezclas de un compuesto de fórmula I con clodinafop o un compuesto de fórmula I con pinoxadén.

Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención también pueden usarse en combinación con aseguradores. Asimismo, mezclas de un compuesto de fórmula I de acuerdo con la invención con uno o más herbicidas adicionales también pueden usarse en combinación con uno o más aseguradores. Los aseguradores pueden ser cloquintocet-mexilo (CAS RN 99607-70-2) o una de sus sales de litio, sodio, potasio, calcio, magnesio, aluminio, hierro, amonio, amonio cuaternario, sulfonio o fosfonio, tales como las divulgadas en el documento WO 02/34048, fenclorazol-etilo (CAS RN 103112-35-2) y el ácido correspondiente (CAS RN 103112-36-3), mefenpir-dietilo (CAS RN 135590-91-9) y el diácido correspondiente (CAS RN 135591-00-3), isoxadifén-etilo (CAS RN 163520-33-0) y el ácido correspondiente (CAS RN 209866-92-2), furilazol (CAS RN 121776-33-8) y el isómero R correspondiente (CAS RN 121776-57-6), benoxacor (CAS RN 9873004-2), dicloromid (CAS RN 37764-25-3), MON4660 (CAS RN 71526-07-3), oxabetrinil (CAS RN 74782-23-3), ciometrinil (CAS RN 78370-21-5) y el isómero (Z) correspondiente (CAS RN 63278-33-1), fenclorim (CAS RN 3740-92-9), N-ciclopropil-4-(2-metoxi-benzoilsulfamoil)-benzamida (CAS RN 221667-31-8), N-isopropil-4-(2-metoxibenzoilsulfamoil)-benzamida (CAS RN 221668-34-4), anhídrido naftálico (CAS RN 81-84-5) y flurazol (CAS RN 72850-64-7).

Preferiblemente, la relación de mezcladura de compuesto de fórmula I a asegurador es de 100:1 a 1:10, especialmente de 20:1 a 1:1.

35 Las mezclas pueden usarse ventajosamente en las formulaciones mencionadas anteriormente (en cuyo caso “ingrediente activo” se refiere a la mezcla respectiva de compuesto de fórmula I con el asegurador).

Mezclas preferidas de un compuesto de fórmula I con herbicidas y aseguradores adicionales incluyen:

40 Mezclas de un compuesto de fórmula I con una triazina y un asegurador.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con glifosato y un asegurador.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con glufosinato y un asegurador.

45 Mezclas de un compuesto de fórmula I con isoxaflutol y un asegurador.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con isoxaflutol y una triazina y un asegurador.

50 Mezclas de un compuesto de fórmula I con isoxaflutol y glifosato y un asegurador.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con isoxaflutol y glufosinato y un asegurador.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con mesotriona y un asegurador.

55 Mezclas de un compuesto de fórmula I con mesotriona y una triazina y un asegurador.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con mesotriona y glifosato y un asegurador.

60 Mezclas de un compuesto de fórmula I con mesotriona y glufosinato y un asegurador.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con sulcotriona y un asegurador.

Mezclas de un compuesto de fórmula I con sulcotriona y una triazina y un asegurador.

65 Mezclas de un compuesto de fórmula I con sulcotriona y glifosato y un asegurador.

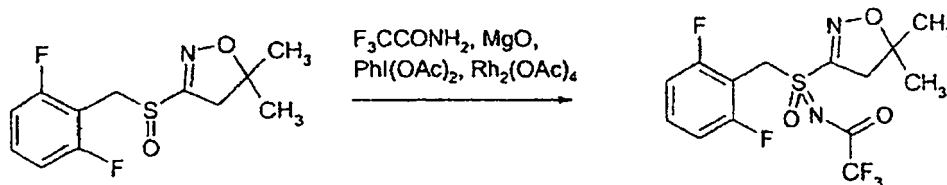
Mezclas de un compuesto de fórmula I con sulcotriona y glufosinato y un asegurador.

Los siguientes Ejemplos ilustran adicionalmente, pero no limitan, la invención.

Ejemplos de preparación

Ejemplo P1

Preparación de 3-{2,6-difluorofenilmetano(N-trifluorometilcarbonyl)sulfoximinil}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol



Trifluoroacetamida (356 mg, 3,15 mmol), óxido de magnesio (254 mg, 6,3 mmol), dímero de acetato de rodio (II) (17,4 mg, 0,04 mmol) y diacetato de yodobenceno (761 mg, 2,36 mmol) se añadieron a una solución de 3-(2,6-difluorofenilmetanosulfinil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol (430 mg, 1,58 mmol) en diclorometano (16 ml) bajo nitrógeno y la solución de color verde oscuro se agitó durante 12 horas a temperatura ambiente. La mezcla se filtró a través de celita, la celita se lavó con diclorometano y el filtrado se concentró. El producto en bruto se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo) para dar el producto (Compuesto N° 1.04 de la Tabla 65) como un sólido amarillo (282 mg, 47% de rendimiento).

Los siguientes compuestos se sintetizaron como se describe en el Ejemplo P1: Compuesto N° 1.11 de la Tabla 65 usando 4-nitrofenilsulfonamida como reaccionante, Compuesto N° 1.12 de la Tabla 65 usando metilsulfonamida como reaccionante, Compuesto N° 1.06 de la Tabla 65 usando éster *terc*-butílico de ácido carbámico como reaccionante, Compuesto N° 2.02 de la Tabla 66 usando 3-(5-cloro-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetanosulfinil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol como material de partida, Compuesto N° 2.05 de la Tabla 66 usando 3-(1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetanosulfinil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol y Compuesto N° 2.08 de la Tabla 66 usando 3-(3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-ilmetanosulfinil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol.

Ejemplo P2

Preparación de 3-{2,6-difluorofenilmetanosulfoximinil}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol

Se añadió carbonato potásico (77 mg, 0,56 mmol) a 3-{2,6-difluorofenilmetano(N-trifluorometilcarbonyl)-sulfoximinil}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol (Compuesto N° 1.04 de la Tabla 65) (194 mg, 0,51 mmol) en metanol (0,2 ml). Después de 15 minutos, la mezcla se concentró y se sometió a reparto entre diclorometano y agua. La fase orgánica se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato magnésico y se concentró para dar una goma de color amarillo pálido que se solidificaba al reposar para dar el producto (Compuesto 1.01 de la Tabla 65) como un sólido color crema (133 mg, 98% de rendimiento).

Los siguientes compuestos se sintetizaron como se describe en el Ejemplo P2:

Compuesto N° 1.02 de la Tabla 65 a partir de Compuesto N° 1.05 de la Tabla 65,

Compuesto N° 1.22 de la Tabla 65 a partir de Compuesto N° 1.38 de la Tabla 65,

Compuesto N° 1.52 de la Tabla 65 a partir de Compuesto N° 1.50 de la Tabla 65,

Compuesto N° 1.53 de la Tabla 65 a partir de Compuesto N° 1.51 de la Tabla 65,

Compuesto N° 2.01 de la Tabla 66 a partir de Compuesto N° 2.02 de la Tabla 66,

Compuesto N° 2.06 de la Tabla 66 a partir de Compuesto N° 2.05 de la Tabla 66 y

Compuesto N° 2.07 de la Tabla 66 a partir de Compuesto N° 2.08 de la Tabla 66.

El siguiente compuesto se sintetizó como se describe en el Ejemplo P11 seguido por el procedimiento descrito en el Ejemplo P2:

Compuesto N° 1.56 de la Tabla 65 a partir de 3-{3-trifluorometoxifenilmetano(N-[4-nitrobenzoil])-sulfoximinil}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol.

ES 2 333 977 T3

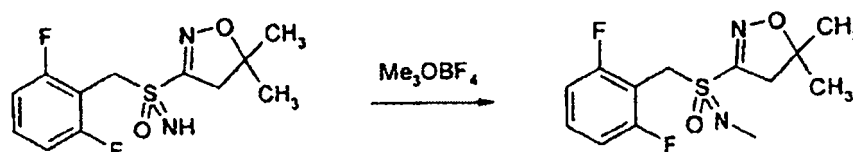
El siguiente compuesto se sintetizó como se describe en el Ejemplo P12 seguido por el procedimiento descrito en el Ejemplo P2:

Compuesto N° 1.57 de la Tabla 65 a partir de 3-{3-trifluorometoxifenilmetano(N-[4-nitrobenzoil])-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol.

Compuesto N° 2.03 de la Tabla 66 a partir de 3-{5-metoxi-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-ilmetano(N-[4-nitrobenzoil])-sulfoximinil}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol.

Ejemplo P3

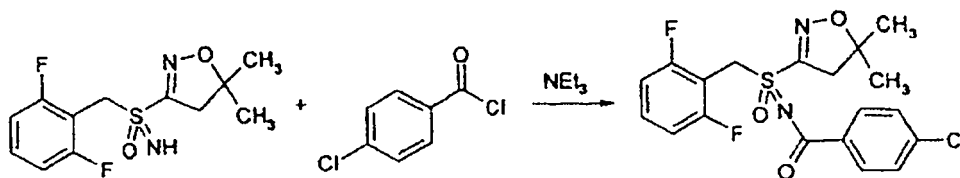
Preparación de 3-{2,6-difluorofenilmetano(N-metil)sulfoximinil}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol



Una solución de 3-{2,6-difluorofenilmetanosulfoximinil}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol (Compuesto N° 1.01 de la Tabla 65) (50 mg, 0,17 mmol) en diclorometano (0,2 ml) se añadió gota a gota a una suspensión de tetrafluoroborato de trimetiloxonio (26 mg, 0,17 mmol) en diclorometano (0,5 ml) bajo nitrógeno. Después de 12 horas a temperatura ambiente, la mezcla se lavó con bicarbonato sódico, la fase acuosa se extrajo varias veces con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato magnésico y se concentraron. El producto en bruto se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo) para dar el producto (Compuesto 1.08 de la Tabla 65) (15 mg, 29% de rendimiento).

Ejemplo P4

Preparación de 3-{2,6-difluorofenilmetano(N-[4-clorobenzoil]sulfoximinil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol



Trietilamina (0,6 ml, 5,5 mmol) y cloruro de 4-clorobenzoilo (0,53 ml, 5,2 mmol) se añadieron gota a gota a 3-{2,6-difluorofenilmetanosulfoximinil}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol (Compuesto N° 1.01 de la Tabla 65) (1,2 g, 4,2 mmol) en diclorometano (10 ml) a 0°C bajo nitrógeno. La mezcla se agitó durante 1 hora a 0°C y durante 10 horas a temperatura ambiente, se vertió en agua y se extrajo varias veces con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato magnésico, se concentraron y se purificaron mediante cromatografía sobre gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo) para dar el producto (Compuesto N° 1.03 de la Tabla 65) como un sólido blanco (540 mg, 53% de rendimiento).

Los siguientes compuestos se sintetizaron como se describe en el Ejemplo P4:

Compuesto N° 1.07 de la Tabla 65 usando cloruro de acetilo como reaccionante,

Compuesto N° 1.17 de la Tabla 65 usando cloroformiato de 1-cloroetilo como reaccionante,

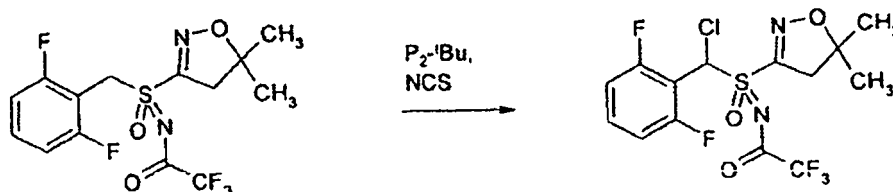
Compuesto N° 1.21 de la Tabla 65 usando cloruro de 2-cloronicotinoilo cloruro como reaccionante,

Compuesto N° 1.36 de la Tabla 65 usando cloruro de benzoilo como reaccionante y

Compuesto N° 1.45 de la Tabla 65 usando cloruro de 4-nitrobenzoilo como reaccionante.

Ejemplo P6

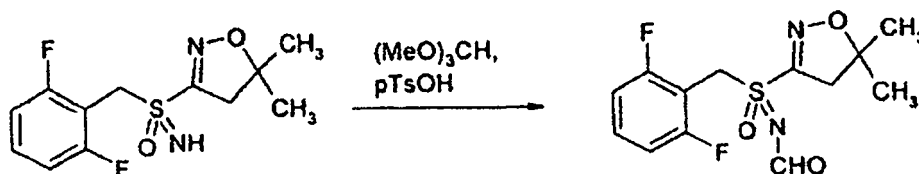
Preparación de 3-{2,6-difluorofenilclorometano(N-[trifluoroacetil]sulfoximinil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol



1-*tert*-Butil-2,2,4,4,4-pentaquis(dimetilamino)-2-lambda⁵-5,4-lambda⁵-5-catenadi(fosfaceno) (P₂-^tBu) (2 M en THF) (0,14 ml, 0,29 mmol) se añadió a una solución de 3-{2,6-difluorofenilmetano(N-trifluorometilcarbonil)sulfoximinil}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol (Compuesto N° 1.04 de la Tabla 65) (100 mg, 0,26 mmol) en THF (3 ml) bajo nitrógeno. Después de 10 minutos, se añadió N-clorosuccinimida (NCS) (38 mg, 0,29 mmol) y la mezcla se agitó durante 10 minutos. La mezcla se vertió en ácido clorhídrico acuoso (1 M) y se extrajo varias veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato magnésico, se concentraron y se purificaron mediante cromatografía sobre gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo) para dar el producto (Compuesto N° 1.05 de la Tabla 65) como un sólido blanco (50 mg, 46% de rendimiento).

Ejemplo P7

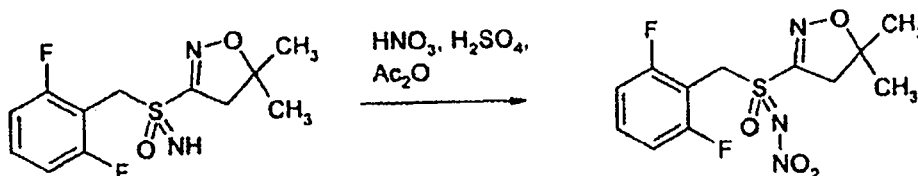
Preparación de 3-{2,6-difluorofenilmetano(N-[formil]sulfoximinil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol



3-{2,6-Difluorofenilmetanosulfoximinil}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol (Compuesto N° 1.01 de la Tabla 65) (100 mg, 0,35 mmol) y una cantidad catalítica de ácido p-toluenosulfónico se disolvieron en ortoformiato de trimetilo (1 ml) y se calentaron hasta 90°C durante 3,5 horas. La mezcla se enfrió hasta temperatura ambiente, se concentró y el producto en bruto se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo) para dar el producto (Compuesto N° 1.13 de la Tabla 65) (8 mg, 11% de rendimiento).

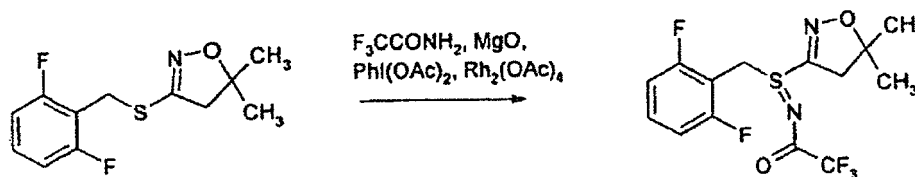
Ejemplo P8

Preparación de 3-{2,6-difluorofenilmetano(N-[nitro]sulfoximinil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol



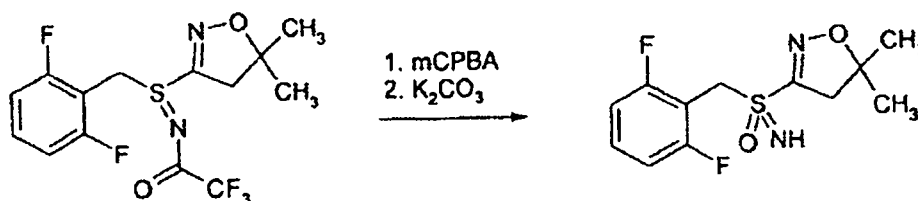
3-{2,6-Difluorofenilmetanosulfoximinil}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol (Compuesto N° 1.01 de la Tabla 65) (100 mg, 0,35 mmol) se disolvió en diclorometano (0,7 ml) y se añadió ácido nítrico fumante (15 µl, 0,35 mmol). Después de 10 minutos, la mezcla se enfrió hasta 0°C y se añadieron anhídrido acético (0,7 ml, 7,29 mmol) y 1 gota de ácido sulfúrico concentrado. La mezcla se agitó durante 20 minutos a 0°C y durante 1,5 horas a temperatura ambiente, se diluyó con acetato de etilo y se lavó varias veces con agua y solución acuosa saturada de bicarbonato sódico. La fase acuosa se extrajo con etilo acetato, las fases orgánicas combinadas se lavaron de nuevo con agua, se secaron sobre sulfato magnésico y se concentraron. La trituración con *n*-hexano suministraba el producto (Compuesto N° 1.15 de la Tabla 65) (54,8 mg, 47% de rendimiento).

Ejemplo P9

Preparación de 3-[2,6-difluorofenilmetano(N-[trifluoroacetil]sulfiliminil)]-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol

Trifluoroacetamida (4,4 g, 38,9 mmol), óxido de magnesio (3,1 g, 77,7 mmol), dímero de acetato de rodio(II) (217 mg, 0,49 mmol) y diacetato de yodobenceno (9,4 g, 29,1 mmol) se añadieron a una solución de 3-(2,6-difluorofenilmetanosulfanil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol (5 g, 19,4 mmol) en diclorometano (150 ml) bajo nitrógeno y la suspensión gris se agitó durante 12 horas a temperatura ambiente. La mezcla se filtró y el filtrado se concentró. El producto en bruto se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo) para dar el producto (Compuesto N° 1.09 de la Tabla 65) (6,7 g, 90% de pureza, 84% de rendimiento).

Ejemplo P10

Preparación de 3-[2,6-difluorofenilmetanosulfoximinil]-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol

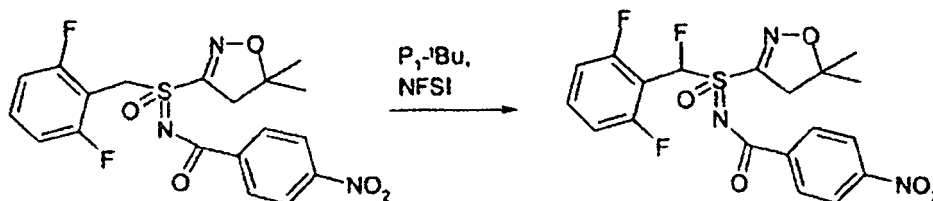
Se añadió carbonato potásico (5,3 g, 38,4 mmol) en agua (13 ml) a una solución de 3-[2,6-difluorofenilmetano (N-trifluorometilcarbonil)sulfiliminil]-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol (Compuesto N° 1.09 de la Tabla 65) (6,7 g, 18,3 mmol) en etanol (90 ml). Se añadió gota a gota una solución de ácido m-cloroperoxibenzoico (50-70% en peso) (8,84 g, 30,7 mmol) en etanol (30 ml) y la mezcla se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. La reacción se extinguió mediante la adición de solución acuosa de metabisulfito al 40% (50 ml). La mezcla se agitó durante 10 minutos antes de que se extrajera varias veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con bicarbonato sódico acuoso y salmuera, se secaron sobre sulfato magnésico y se concentraron para dar el producto (Compuesto N° 1.01 de la Tabla 65) como un sólido blanco (3,7 g, 70% de rendimiento).

Los siguientes compuestos se sintetizaron como se describe en el Ejemplo P9 seguido por el procedimiento descrito en el Ejemplo P10:

Compuesto N° 1.24 de la Tabla 65 a partir de 3-(2-trifluorometoxifenilmetanosulfanil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol, Compuesto N° 1.25 de la Tabla 65 a partir de 3-(2-difluorometoxifenilmetanosulfanil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol, Compuesto N° 1.26 de la Tabla 65 a partir de 3-(2-trifluorometiltiofenilmetanosulfanil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol, Compuesto N° 1.27 de la Tabla 65 a partir de 3-(2-tolilmetanosulfanil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol, Compuesto N° 1.28 de la Tabla 65 a partir de 3-(2,6-difluoro-3-tolilmetanosulfanil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol, Compuesto N° 1.29 de la Tabla 65 a partir de 3-(2,3-difluorofenilmetanosulfanil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol, Compuesto N° 1.30 de la Tabla 65 a partir de 3-(2,4-difluorofenilmetanosulfanil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol, Compuesto N° 1.31 de la Tabla 65 a partir de 3-(2-trifluorometilfenilmetanosulfanil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol, Compuesto N° 1.32 de la Tabla 65 a partir de 3-(2-fluoro-6-trifluorometilfenilmetanosulfanil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol, Compuesto N° 1.33 de la Tabla 65 a partir de 3-(2-bifenilmetanosulfanil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol, Compuesto N° 1.34 de la Tabla 65 a partir de 3-(2,5-difluorofenilmetanosulfanil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol, Compuesto N° 1.39 de la Tabla 65 a partir de 3-(2-fluorofenilmetanosulfanil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol, Compuesto N° 1.40 de la Tabla 65 a partir de 3-(3,5-difluorofenilmetanosulfanil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol, Compuesto N° 1.41 de la Tabla 65 a partir de 3-(2-cianofenilmetanosulfanil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol, Compuesto N° 1.42 de la Tabla 65 a partir de 3-fenilmetanosulfanil-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol, Compuesto N° 1.46 de la Tabla 65 a partir de 3-(2-fluoro-4-metoxicarbonilfenilmetanosulfanil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol, Compuesto N° 1.47 de la Tabla 65 a partir de 3-(4-etoxicarbonil-2-fluorofenilmetanosulfanil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol, Compuesto N° 1.48 de la Tabla 65 a partir de 3-(6-fluoro-4H-benzo[1,3]dioxin-8-ilmetanosulfanil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol, el Compuesto N° 1.49 de la Tabla 65 se aisló durante la síntesis del Compuesto N° 1.48 de la Tabla 65, Compuesto N° 1.59 de la Tabla 65 a partir de 3-(2-cloro-3-etoxicarbonil-6-metilsulfonilfenilmetanosulfanil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol.

Ejemplo P11

Preparación de 3-{2,6-difluorofenilfluorometano(N-(4-nitrobenzoyl)sulfoximinil)}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol

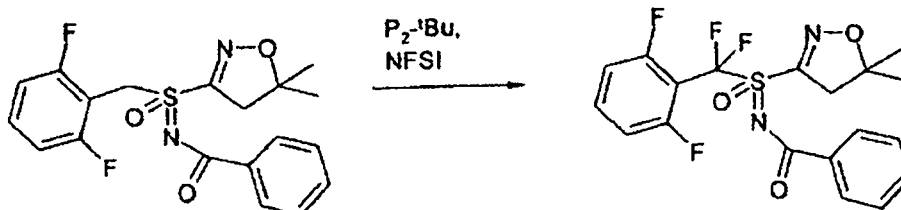


A una solución de 3-{2,6-difluorofenilmetano(N-(4-nitrobenzoyl)sulfoximinil)}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol (Compuesto N° 1.45 de la Tabla 65) (500 mg, 1,14 mmol) en THF (5 ml) se añadió gota a gota triamida N'-*tert*-butil-N,N,N',N'',N'''-hexametilfosforimídica (P₁-*t*Bu) (0,31 ml, 1,2 mmol). Después de 10 minutos, se añadió N-fluorobencenosulfonimida (NFSI) (378 mg, 2,58 mmol) y la mezcla se agitó durante 5 horas. La mezcla se concentró y se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo) para dar el diastereoisómero A (Compuesto N° 1.50 de la Tabla 65) como un sólido blanco (340 mg, 65% de rendimiento) y el diastereoisómero B (Compuesto N° 1.51 de la Tabla 65) como un sólido blanco (103 mg, 20% de rendimiento).

Los siguientes compuestos se sintetizaron como se describe en el Ejemplo P11: Compuesto N° 1.35 de la Tabla 65 a partir de Compuesto N° 1.36 de la Tabla 65 y Compuesto N° 1.43 de la Tabla 65 a partir de Compuesto N° 1.03 de la Tabla 65.

Ejemplo P12

Preparación de 3-{2,6-difluorofenildifluorometano(N-[benzoyl]sulfoximinil)}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol

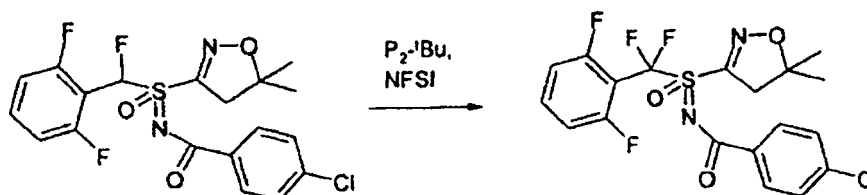


A una solución de 3-{2,6-difluorofenilmetano(N-[benzoyl]sulfoximinil)}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol (Compuesto N° 1.36 de la Tabla 65) (155 mg, 0,39 mmol) en THF (5 ml) se añadió gota a gota 1-*tert*-butil-2,2,4,4,4-pentaquis(dimetilamino)-2-lambda⁵-5,4-lambda⁵-5-catenadi(fosfaceno) (P₂-*t*Bu) (2 M en THF) (0,44 ml, 0,87 mmol). Después de 10 minutos, se añadió N-fluorobencenosulfonimida (NFSI) (274 mg, 0,87 mmol) y la mezcla se agitó durante 30 minutos. La mezcla se concentró y se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo) para dar el producto (Compuesto N° 1.37 de la Tabla 65) como un sólido blanco (94 mg, 56% de rendimiento).

El Compuesto N° 1.38 de la Tabla 65 se sintetizó como se describe en el Ejemplo P12 a partir de Compuesto N° 1.45 de la Tabla 65.

Ejemplo P13

Preparación de 3-{2,6-difluorofenildifluorometano(N-[4-clorobenzoyl]sulfoximinil)}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol

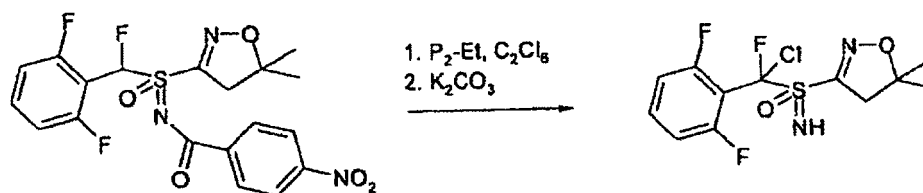


A una solución de 3-{2,6-difluorofenilfluorometano(N-[4-clorobenzoyl]sulfoximinil)}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol (Compuesto N° 1.43 de la Tabla 65) (450 mg, 1,0 mmol) en THF (5 ml) se añadió gota a gota 1-*tert*-butil-

2,2,4,4,4-pentaquis(dimetilamino)-2-lambda⁵-5,4-lambda⁵-5-catenadi(fosfaceno) (P₂-ⁱBu) (2 M en THF) (0,55 ml, 1,1 mmol). Después de 10 minutos, se añadió N-fluorobencenosulfonimida (NFSI) (350 mg, 1,1 mmol) y la mezcla se agitó durante 30 minutos. La mezcla se concentró y se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo) para dar el producto (Compuesto N° 1.44 de la Tabla 65) como un sólido blanco (200 mg, 53% de rendimiento).

Ejemplo P14

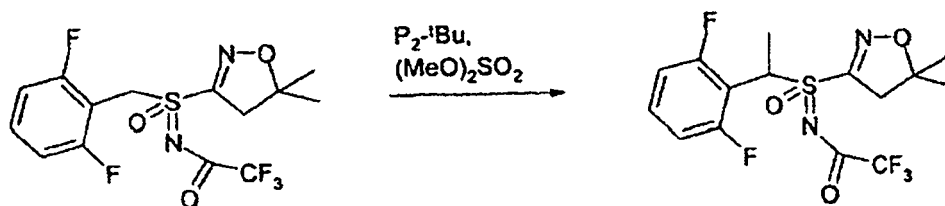
Preparación de 3-{2,6-difluorofenilfluoroclorometanosulfoximinil}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol



Una mezcla diastereoisómera de 3-{2,6-difluorofenilfluorometano(N-[4-nitrobenzoyl]sulfoximinil)}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol (Compuesto N° 1.50 de la Tabla 65 y Compuesto N° 1.51 de la Tabla 65) (300 mg, 0,66 mmol) y hexacloroetano (172 mg, 0,72 mmol) se disolvieron en THF (5 ml) y se añadió gota a gota a 0°C 1-etil-2,2,4,4,4-pentaquis(dimetilamino)-2-lambda⁵-5,4-lambda⁵-5-catenadi(fosfaceno) (P₂Et) (0,24 ml, 0,72 mmol). Después de 30 minutos, se añadieron varias gotas de solución acuosa saturada de cloruro amónico y la mezcla se concentró. El residuo se disolvió en metanol (5 ml) y se añadió carbonato potásico (100 mg, 0,72 mmol). Después de 2 horas, la mezcla se concentró, el residuo se disolvió en diclorometano, se lavó varias veces con solución acuosa saturada de bicarbonato sódico y salmuera y se secó sobre sulfato magnésico. La mezcla se concentró y se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo) para dar el diastereoisómero A (Compuesto N° 1.54 de la Tabla 65) como un sólido blanco (27 mg, 12% de rendimiento) y el diastereoisómero B (Compuesto N° 1.55 de la Tabla 65) como un sólido blanco (57 mg, 25% de rendimiento).

Ejemplo P15

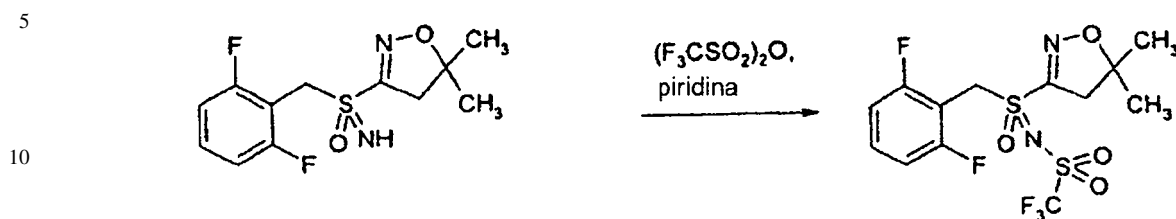
Preparación de 3-{1'-[2,6-difluorofenil]etano(N-[trifluoroacetil]sulfoximinil)}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol



A una solución de 3-{2,6-difluorofenilmetano(N-trifluorometilcarbonyl)sulfoximinil}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol (Compuesto N° 1.04 de la Tabla 65) (227 mg, 0,59 mmol) en THF (10 ml) se añadió 1-*tert*-butil-2,2,4,4,4-pentaquis(dimetilamino)-2-lambda⁵-5,4-lambda⁵-5-catenadi(fosfaceno) (P₂-ⁱBu) (2 M en THF) (0,3 ml, 0,65 mmol) bajo nitrógeno a temperatura ambiente. Después de 5 minutos, se añadió sulfato de dimetilo (109 µl, 0,65 mmol) y la mezcla se agitó durante 30 minutos. La reacción se extinguió mediante la adición de ácido clorhídrico acuoso (2 M) (0,5 ml) y se extrajo con acetato de etilo. Los extractos orgánicos combinados se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato magnésico, se filtraron a través de gel de sílice y se concentraron. El residuo se purificó mediante HPLC preparativa (acetato de etilo al 20%/hexano) para dar el diastereoisómero A (Compuesto N° 1.19 de la Tabla 65) como una goma incolora (58 mg, 25% de rendimiento) y el diastereoisómero B (Compuesto N° 1.20 de la Tabla 65) como una goma incolora (45 mg, 19% de rendimiento).

Ejemplo P16

Preparación de 3-{2,6-difluorofenilmetano(*N*-trifluorometilsulfonyl)sulfoximinil}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol

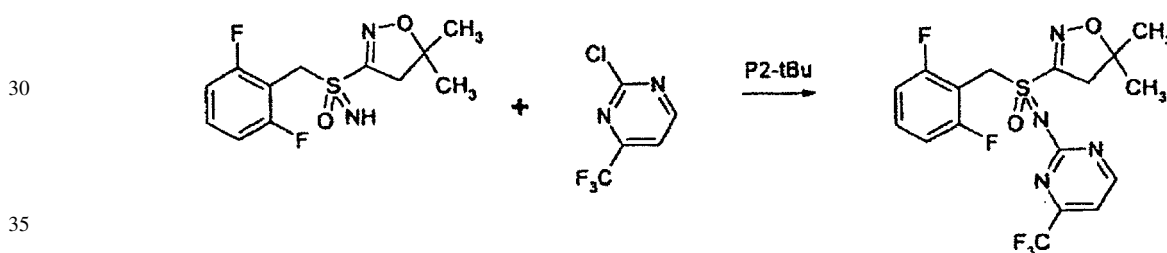


15 3-{2,6-difluorofenilmetanosulfoximinil}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol (Compuesto N° 1.01 de la Tabla 65) (100 mg, 0,35 mmol) y piridina (0,08 ml, 1,04 mmol) se disolvieron en diclorometano (5 ml) y se añadió gota a gota a 0°C anhídrido trifluorometanosulfónico (0,09 ml, 0,52 mmol). La mezcla se dejó calentar hasta temperatura ambiente y se agitó durante 4 h. La mezcla se diluyó con acetato de etilo (10 ml), se lavó con agua (10 ml) y HCl 2 M (10 ml), se secó sobre MgSO₄ y se concentró. La purificación mediante cromatografía sobre gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo) daba el producto (Compuesto N° 1.14 de la Tabla 65) como una goma incolora (78 mg, 53% de rendimiento).

20

Ejemplo P17

25 Preparación de 3-{2,6-difluorofenilmetano(*N*-[4-trifluorometil-2-pirimidil])-sulfoximinil}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol



40 3-{2,6-difluorofenilmetanosulfoximinil}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol (Compuesto N° 1.01 de la Tabla 65) (200 mg, 0,69 mmol) se disolvió en tetrahidrofurano (3 ml) y se añadió gota a gota 1-*terc*-butil-2,2,4,4,4-pentaquis(dimetilamino)-2-lambda⁵-5,4-lambda⁵-5-catenadi(fosfaceno) (P₂-^tBu) (2 M en THF) (0,42 ml, 0,83 mmol), seguido por 2-cloro-4-trifluorometilpirimidina (152 mg, 0,83 mmol). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 24 h y a continuación se calentó hasta reflujo durante 5 h. Después de enfriar, se añadió acetato de etilo (10 ml) y la mezcla se lavó con HCl 2 M (10 ml), se secó sobre MgSO₄ y se concentró. La purificación mediante cromatografía sobre gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo) daba el producto (Compuesto N° 1.16 de la Tabla 65) como un sólido blanco (83 mg, 28% de rendimiento).

45

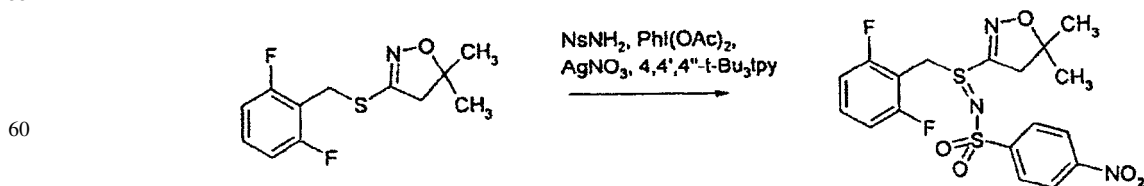
El Compuesto N° 1.23 de la Tabla 65 se sintetizó como se describe en el Ejemplo P17 usando 4-cloro-5-cianopirimidina como reaccionante.

50

Ejemplo P18

Preparación de 3-{2,6-difluorofenilmetano(*N*-[4-nitrofenilsulfonyl]sulfiliminil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol

55



65 4-Nitrobencenosulfonamida (189 mg, 0,93 mmol), nitrato de plata (11 mg, 0,06 mmol), 4,4',4''-tri-*terc*-butil-2,2':6',2''-terpiridina (25 mg, 0,06 mmol) y diacetato de yodobenceno (375 mg, 1,17 mmol) se añadieron a una solución de 3-(2,6-difluorofenilmetanosulfanil)-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol (200 mg, 0,8 mmol) en acetonitrilo (5 ml) bajo nitrógeno y la solución de color rojo oscuro resultante se agitó durante 12 horas a temperatura ambiente y a

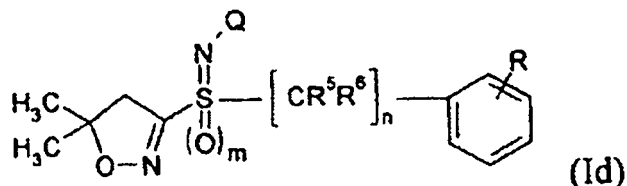
ES 2 333 977 T3

continuación se calentó durante 5 min en un tubo sellado hasta 100°C en el microondas. La solución de color amarillo pálido resultante se concentró y el producto en bruto se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (eluyente: hexano/acetato de etilo) para dar 3-{2,6-difluorofenilmetano(N-[4-nitrofenilsulfonyl]sulfiliminil)}-5,5-dimetil-4,5-dihidroisoxazol como un sólido blanco (107 mg, 25% de rendimiento).

Los compuestos mencionados en la siguiente tabla 65 posterior pueden prepararse de manera análoga.

TABLA 65

Compuestos de fórmula Id

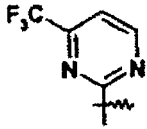


N°	R	m	R ⁵	R ⁶	Q	n	P.f. [°C]	1H-NMR (400 MHz, CDC13)
1.01	2,6-F	1	H	H	H	1	89-91	1,45 (s, 3H, Me), 1,55 (s, 3H, Me), 2,9 (d, 1H, CH ₂), 3,1 (d, 1H, CH ₂), 3,28 (s ancho, 1H, NH), 4,65 (d, 1H, CH ₂), 4,80 (d, 1H, CH ₂), 7,0 (m, 2H, CH), 7,4 (m, 1H, CH),
1.02	2,6-F	1	Cl	H	H	1	100	mezcla 1:1 de diastereoisómeros: 1,42 (s, 3H, Me), 1,47 (s, 3H, Me), 1,52 (s, 3H, Me), 1,57 (s, 3H, Me), 2,95 (d, 1H, CH ₂), 3,15 (d, 1H, CH ₂), 3,2 (d, 1H, CH ₂), 3,3 (d, 1H, CH ₂), 3,53 (s ancho, 1H, NH), 3,6 (s ancho, 1H, NH), 6,42 (s, 1H, CHCl), 6,62 (s, 1H, CHCl), 7,02 (m, 4H, CH), 7,45 (m, 2H, CH).
1.03	2,6-F	1	H	H	CO(4-ClPh)	1	154-156	1,55 (s, 6H, Me), 3,15 (d, 1H, CH ₂), 3,35 (d, 1H, CH ₂), 5,0 (d, 1H, CH ₂), 5,15 (d, 1H, CH ₂), 7,02 (t, 2H, CH), 7,38 (d, 2H, CH), 7,45 (m, 1H, CH), 8,0 (d, 2H, CH).
1.04	2,6-F	1	H	H	-COCF ₃	1	143-144	1,55 (s, 6H, Me), 3,05 (d, 1H, CH ₂), 3,25 (d, 1H, CH ₂), 4,95 (d, 1H, CH ₂), 5,2 (d, 1H, CH ₂), 7,05 (m, 2H, CH), 7,5 (m, 1H, CH).

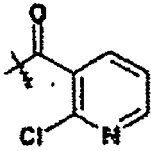
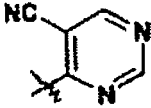
ES 2 333 977 T3

N°	R	m	R ⁵	R ⁶	Q	n	P.f. [°C]	1H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.05	2,6-F	1	H	H	-COCF ₃	1		1,60 (s, 6H, Me), 3,25 (d, 1H, CH ₂), 3,45 (d, 1H, CH ₂), 6,9 (m, 1H, CHCl), 7,05 (m, 2H, CH), 7,52 (m, 1H, CH).
1.06	2,6-F	1	H		-(CO)O ^t Bu	1		1,48-1,52 (m, 15H, Me), 3,0 (d, 1H, CH ₂), 3,1 (d, 1H, CH ₂), 4,8 (d, 1H, CH ₂), 5,0 (d, 1H, CH ₂), 7,0 (m, 2H, CH), 7,4 (m, 1H, CH).
1.07	2,6-F	1	H	H	-COCH ₃	1		1,45 (s, 3H, Me), 1,55 (s, 3H, Me), 2,2 (s, 3H, Me), 3,05 (d, 1H, CH ₂), 3,25 (d, 1H, CH ₂), 4,85 (d, 1H, CH ₂), 5,05 (d, 1H, CH ₂), 7,0 (m, 2H, CH), 7,4 (m, 1H, CH).
1.08	2,6-F	1	H	H	-CH ₃	1		1,45 (s, 3H, Me), 1,55 (s, 3H, Me), 2,85 (s, 3H, Me), 2,85 (d, 1H, CH ₂), 3,05 (d, 1H, CH ₂), 4,55 (d, 1H, CH ₂), 3,05 (d, 1H, CH ₂), 4,55 (d, 1H, CH ₂), 4,75 (d, 1H, CH ₂), 7,0 (m, 2H, CH), 7,4 (m, 1H, CH).
1.09	2,6-F	0	H	H	-COCF ₃	1		1,5 (s, 6H, Me), 3,0 (d, 1H, CH ₂), 3,2 (d, 1H, CH ₂), 4,65 (d, 1H, CH ₂), 4,85 (d, 1H, CH ₂), 7,0 (m, 2H, CH), 7,45 (m, 1H, CH).
1.11	2,6-F	1	H	H	-SO ₂ (4-NO ₂ Ph)	1		1,55 (s, 6H, Me), 3,25 (d, 1H, CH ₂), 3,35 (d, 1H, CH ₂), 4,95 (d, 1H, CH ₂), 5,1 (d, 1H, CH ₂), 7,05 (m, 2H, CH), 7,5 (m, 1H, CH), 8,15 (m, 2H, CH), 8,35 (m, 2H, CH).
1.12	2,6-F	1	H	H	-SO ₂ Me	1		1,50 (s, 3H, Me), 1,6 (s, 3H, Me), 3,1 (s, 3H, Me), 3,1 (d, 1H, CH ₂), 3,3 (d, 1H, CH ₂), 4,9 (d, 1H, CH ₂), 5,0 (d, 1H, CH ₂), 7,0 (m, 2H, CH), 7,45 (m, 1H, CH).

ES 2 333 977 T3

N°	R	m	R ⁵	R ⁶	Q	n	P.f. [°C]	1H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.13	2,6-F	1	H	H	-CHO	1		1,50 (s, 6H, Me), 3,1 (d, 1H, CH ₂), 3,25 (d, 1H, CH ₂), 5,0 (d, 1H, CH ₂), 5,1 (d, 1H, CH ₂), 7,02 (m, 2H, CH), 7,45 (m, 1H, CH), 8,4 (s, 1H, CHO).
1.14	2,6-F	1	H	H	-SO ₂ CF ₃	1	108	1,57 (s, 3H, Me), 1,59 (s, 3H, Me), 3,15 (d, 1H, CH ₂), 3,25 (d, 1H, CH ₂), 5,05 (d, 1H, CH ₂), 5,15 (d, 1H, CH ₂), 7,05 (m, 2H, CH), 7,5 (m, 1H, CH).
1.15	2,6-F	1	H	H	-NO ₂	1		1,5 (s, 3H, Me), 1,6 (s, 3H, Me), 3,1 (d, 1H, CH ₂), 3,3 (d, 1H, CH ₂), 5,05 (s, 2H, CH ₂), 7,05 (m, 2H, CH), 7,5 (m, 1H, CH).
1.16	2,6-F	1	H	H		1		1,45 (s, 3H, Me), 1,5 (s, 3H, Me), 2,95 (d, 1H, CH ₂), 3,3 (d, 1H, CH ₂), 5,1 (d, 1H, CH ₂), 5,18 (d, 1H, CH ₂), 7,0 (m, 2H, CH), 7,2 (d, 1H, CH), 7,4-7,5 (m, 1H, CH), 8,7 (d, 1H, CH).
1.17	2,6-F	1	H	H	-(CO)OCH ₂ ClCH ₃	1		mezcla 1:1 de diastereoisómeros: 1,5 (s, 6H, Me), 1,52 (s, 3H, Me), 1,55 (s, 3H, Me), 1,7 (s, 3H, Me), 1,75 (s, 3H, Me), 3,0 (d, 1H, CH ₂), 3,03 (d, 1H, CH ₂), 3,18 (d, 1H, CH ₂), 3,2 (d, 1H, CH ₂), 4,95 (d, 1H, CH ₂), 5,0 (d, 1H, CH ₂), 5,05 (d, 1H, CH ₂), 5,1 (d, 1H, CH ₂), 6,5 (q, 2H, CH), 7,0-7,1 (m, 4H, CH), 7,4 7,5 (m, 2H, CH).
1.19	2,6-F	1	H	-CH ₃	-COCF ₃			Diastereoisómero A: 1,54 (s, 3H, Me), 1,57 (s, 3H, Me), 2,02 (d, 3H, Me), 3,06 (d, 1H, CH ₂), 3,31 (d, 1H, CH ₂), 5,43 (q, 1H, CHMe), 7,00 (m, 2H, CH), 7,43 (m, 1H, CH).

ES 2 333 977 T3

N°	R	m	R ⁵	R ⁶	Q	n	P. f. [°C]	1H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.20	2,6-F	1	H	-CH ₃	-COCF ₃	1		Diastereoisómero B: 1,36 (s, 3H, Me), 1,48 (s, 3H, Me), 2,02 (d, 3H, Me), 2,67 (d, 1H, CH ₂), 3,12 (d, 1H, CH ₂), 5,35 (q, 1H, CHMe), 7,00 (m, 2H, CH), 7,43 (m, 1H, CH).
1.21	2,6-F	1	H	H		1		1,55 (s, 3H, Me), 1,57 (s, 3H, Me), 3,15 (d, 1H, CH ₂), 3,35 (d, 1H, CH ₂), 5,05 (d, 1H, CH ₂), 5,2 (d, 1H, CH ₂), 7,0-7,05 (m, 2H, CH), 7,3 (dd, 1H, CH), 7,4-7,5 (m, 1H, CH), 8,2 (dd, 1H, CH), 8,45 (dd, 1H, CH).
1.22	2,6-F	1	F	F	H	1	112	1,52 (s, 3H, Me), 1,55 (s, 3H, Me), 3,15 (d, 1H, CH ₂), 3,26 (d, 1H, CH ₂), 3,6 (s ancho, 1H, NH), 7,05 (t, 2H, CH), 7,5-7,6 (m, 1H, CH).
1.23	2,6-f	1	H	H		1		1,48 (s, 3H, Me), 1,52 (s, 3H, Me), 3,1 (d, 1H, CH ₂), 3,2 (d, 1H, CH ₂), 5,1 (d, 1H, CH ₂), 5,15 (d, 1H, CH ₂), 7,0-7,05 (m, 2H, CH), 7,4-7,5 (m, 1H, CH), 8,2 (d, 1H, CH), 8,25 (d, 1H, CH).
1.24	2-OCF ₃	1	H	H	H	1		1,4 (s, 3H, Me), 1,45 (s, 3H, Me), 2,9 (d, 1H, CH ₂), 3,0 (d, 1H, CH ₂), 2,9-3,1 (s ancho, 1H, NH), 4,7 (d, 1H, CH ₂), 4,78 (d, 1H, CH ₂), 7,3-7,4 (m, 2H, CH), 7,4-7,5 (m, 1H, CH), 7,5-7,6 (m, 1H, CH).
1.25	2-OCHF ₂	1	H	H	H	1		1,4 (s, 6H, Me), 2,9 (d, 1H, CH ₂), 3,05 (d, 1H, CH ₂), 4,72 (d, 1H, CH ₂), 4,8 (d, 1H, CH ₂), 6,6 (t, 1H, CH), 7,2-7,3 (m, 2H, CH), 7,4-7,45 (m, 1H, CH), 7,55-7,6 (m, 1H, CH).

ES 2 333 977 T3

N°	R	m	R ⁵	R ⁶	Q	n	P.f. [°C]	1H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.26	2-SCF ₃	1	H	H	H	1		1,4 (s, 3H, Me), 1,45 (s, 3H, Me), 2,9 (d, 1H, CH ₂), 3,05 (d, 1H, CH ₂), 5,0 (d, 1H, CH ₂), 5,08 (d, 1H, CH ₂), 7,5-7,6 (m, 2H, CH), 7,65 (d, 1H, CH), 7,85 (d, 1H, CH).
1.27	2-CH ₃	1	H	H	H	1		1,4 (s, 3H, Me), 1,45 (s, 3H, Me), 2,5 (s, 3H, Me), 2,65 (d, 1H, CH ₂), 2,95 (d, 1H, CH ₂), 4,7 (d, 1H, CH ₂), 4,85 (d, 1H, CH ₂), 7,2-7,35 (m, 3H, CH), 7,4 (d, 1H, CH).
1.28	2,6-F, 3-CH ₃	1	H	H	H	1		1,5 (s, 3H, Me), 1,51 (s, 3H, Me), 2,25 (s, 3H, Me), 3,0 (d, 1H, CH ₂), 3,08 (d, 1H, CH ₂), 4,7 (d, 1H, CH ₂), 4,75 (d, 1H, CH ₂), 6,9 (m, 1H, CH), 7,2-7,3 (m, 1H, CH).
1.29	2,3-F	1	H	H	H	1		1,48 (s, 3H, Me), 1,5 (s, 3H, Me), 2,95 (d, 1H, CH ₂), 3,05 (d, 1H, CH ₂), 2,9-3,1 (s ancho, 1H, NH), 4,7 (d, 1H, CH ₂), 4,75 (d, 1H, CH ₂), 7,1-7,3 (m, 3H, CH).
1.30	2,4-F	1	H	H	H	1		1,48 (s, 3H, Me), 1,5 (s, 3H, Me), 2,95 (d, 1H, CH ₂), 3,05 (d, 1H, CH ₂), 4,65 (d, 1H, CH ₂), 4,7 (d, 1H, CH ₂), 6,9-7,0 (m, 2H, CH), 7,5-7,55 (m, 1H, CH).
1.31	2-CF ₃	1	H	H	H	1		1,4 (s, 3H, Me), 1,45 (s, 3H, Me), 2,9 (d, 1H, CH ₂), 3,05 (d, 1H, CH ₂), 3,4-3,7 (s ancho, 1H, NH), 4,9 (d, 1H, CH ₂), 4,95 (d, 1H, CH ₂), 7,55 (t, 1H, CH), 7,65 (t, 1H, CH), 7,75 (d, 1H, CH), 7,85 (d, 1H, CH).

ES 2 333 977 T3

N°	R	m	R ⁵	R ⁶	Q	n	P.f. [°C]	1H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.32	2-F, 6-CF ₃	1	H	H	H	1		1,55 (s, 6H, Me), 3,1 (d, 1H, CH ₂), 3,15 (d, 1H, CH ₂), 5,05 (d, 1H, CH ₂), 5,08 (d, 1H, CH ₂), 7,35-7,4 (m, 1H, CH), 7,5-7,6 (m, 2H, CH).
1.33	2-Ph	1	H	H	H	1		1,4 (s, 3H, Me), 1,41 (s, 3H, Me), 2,7 (d, 1H, CH ₂), 2,85 (d, 1H, CH ₂), 3,1-3,3 (s ancho, 1H, NH), 4,7 (d, 1H, CH ₂), 4,8 (d, 1H, CH ₂), 7,35-7,5 (m, 8H, CH), 7,7 (d, 1H, CH).
1.34	2,5-F	1	H	H	H	1		1,48 (s, 3H, Me), 1,49 (s, 3H, Me), 2,95 (d, 1H, CH ₂), 3,05 (d, 1H, CH ₂), 4,65 (s, 2H, CH ₂), 7,1-7,15 (m, 2H, CH), 7,2-7,3 (m, 1H, CH).
1.35	2,6-F	1	H	F	-COPh	1	128	1,6 (s, 6H, Me) 3,3 (d, 1H, CH ₂), 3,6 (d, 1H, CH ₂), 7,05-7,1 (m, 2H, CH), 7,25 (d, 1H, CH), 7,35-7,40 (m, 2H, CH), 7,5-7,6 (m, 2H, CH), 8,0 (d, 2H, CH).
1.36	2,6-F	1	H	H	-COPh	1	141	1,53 (s, 3H, Me), 1,54 (s, 3H, Me), 3,15 (d, 1H, CH ₂), 3,4 (d, 1H, CH ₂), 5,0 (d, 1H, CH ₂), 5,15 (d, 1H, CH ₂), 7,0-7,05 (m, 2H, CH), 7,35-7,45 (m, 3H, CH), 7,5-7,53 (m, 1H, CH), 8,1 (d, 2H, CH).
1.37	2,6-F	1	F	F	-COPh	1		1,55 (s, 6H, Me), 3,2 (d, 1H, CH ₂), 3,32 (d, 1H, CH ₂), 7,05-7,1 (m, 2H, CH), 7,38-7,42 (m, 2H, CH), 7,5-7,55 (m, 1H, CH), 7,55-7,65 (m, 1H, CH), 8,03 (d, 2H, CH).
1.38	2,6-F	1	F	F	-CO(4- NO ₂ Ph)	1	159	1,6 (s, 6H, Me), 3,2 (d, 1H, CH ₂), 3,39 (d, 1H, CH ₂), 7,1-7,15 (m, 2H, CH), 7,6-7,7 (m, 1H, CH), 8,2 (d, 2H, CH), 8,25 (d, 2H, CH).

ES 2 333 977 T3

N°	R	m	R ⁵	R ⁶	Q	n	P. f. [°C]	1H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.39	2-F	1	H	H	H	1		1,38 (s, 3H, Me), 1,42 (s, 3H, Me), 2,85 (d, 1H, CH ₂), 3,1 (d, 1H, CH ₂), 4,95 (d, 1H, CH ₂), 5,0 (d, 1H, CH ₂), 7,08-7,2 (m, 2H, CH), 7,38-7,43 (m, 2H, CH).
1.40	3,5-F	1	H	H	H	1		1,43 (s, 3H, Me), 1,48 (s, 3H, Me), 2,7-2,9 (s ancho, 1H, NH), 2,85 (d, 1H, CH ₂), 3,0 (d, 1H, CH ₂), 4,55 (d, 1H, CH ₂), 4,65 (d, 1H, CH ₂), 6,85-6,9 (m, 1H, CH), 6,97-7,02 (m, 2H, CH).
1.41	2-CN	1	H	H	H	1	127	1,48 (s, 6H, Me), 3,1 (s, 2H, CH ₂), 3,05-3,2 (s ancho, 1H, NH), 4,85 (s, 2H, CH ₂), 7,5-7,55 (m, 1H, CH), 7,65-7,7 (m, 1H, CH), 7,7-7,75 (m, 2H, CH).
1.42	H	1	H	H	H	1	87	1,45 (s, 3H, Me), 1,53 (s, 3H, Me), 2,62 (d, 1H, CH ₂), 2,9 (d, 1H, CH ₂), 3,1-3,18 (s ancho, 1H, NH), 4,55 (d, 1H, CH ₂), 4,68 (d, 1H, CH ₂), 7,4-7,5 (m, 5H, CH).
1.43	2,6-F	1	H	F	-CO(4-ClPh)	1	159	1,6 (s, 6H, Me), 3,3 (d, 1H, CH ₂), 3,57 (d, 1H, CH ₂), 7,05-7,1 (m, 2H, CH), 7,2 (d, 1H, CH), 7,35 (d, 2H, CH), 7,5-7,6 (m, 1H, CH), 7,9 (d, 2H, CH).
1.44	2,6-F	1	F	F	-CO(4-ClPh)	1		1,6 (s, 6H, Me), 3,2 (d, 1H, CH ₂), 3,5 (d, 1H, CH ₂), 7,1 (t, 2H, CH), 7,38 (d, 2H, CH), 7,58-7,65 (m, 1H, CH), 7,95 (d, 2H, CH),
1.45	2,6-F	1	H	H	-CO(4-NO ₂ Ph)	1	164	1,55 (s, 6H, Me), 3,15 (d, 1H, CH ₂), 3,4 (d, 1H, CH ₂), 5,0 (d, 1H, CH ₂), 5,15 (d, 1H, CH ₂), 7,0-7,05 (m, 2H, CH), 7,4-7,5 (m, 1H, CH), 8,23 (s, 4H, CH),

ES 2 333 977 T3

N°	R	m	R ⁵	R ⁶	Q	n	P.f. [°C]	1H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.46	2-F, 4-(CO)OCH ₃	1	H	H	H	1		1,45 (s, 6H, Me), 2,8-3,0 (s ancho, 1H, NH), 2,95 (d, 1H, CH ₂), 3,05 (d, 1H, CH ₂), 3,95 (s, 3H, Me), 4,73 (s, 2H, CH ₂), 7,6 (t, , 1H, CH), 7,8 (d, 1H, CH), 7,9 (d, 1H, CH),
1.47	2-F 4-(CO)CH ₃	1	H	H	H	1	125	1,4 (t, 3H, Me), 1,48 (s, 6H, Me), 2,6-2,9 (s ancho, 1H, NH), 2,95 (d, 1H, CH ₂), 3,05 (d, 1H, CH ₂), 4,4 (q, 2H, CH ₂), 4,72 (s, 2H, CH ₂), 7,6 (t, 1H, CH), 7,8 (d, 1H, CH), 7,9 (d, 1H, CH).
1.48	2,3- OCH ₂ OCH ₂ -, 5-F	1	H	H	H	1	126	1,45 (s, 6H, Me), 2,95 (d, 1H, CH ₂), 3,05 (d, 1H, CH ₂), 3,2-3,4 (s ancho, 1H, NH), 4,63 (d, 1H, CH ₂), 4,68 (d, 1H, CH ₂), 4,88 (s, 2H, CH ₂), 5,25 (s, 2H, CH ₂), 6,75 (dd, 1H, CH), 7,1 (dd, 1H, CH).
1.49	2,3- OCH ₂ OCH ₂ -, 5-F	1	H	H	-COCF ₃	1		1,5 (s, 3H, Me), 1,51 (s, 3H, Me), 2,95 (d, 1H, CH ₂), 3,18 (d, 1H, CH ₂), 4,9 (s, 2H, CH ₂), 5,0 (s, 2H, CH ₂), 5,32 (d, 1H, CH ₂), 5,37 (d, 1H, CH ₂), 6,82 (dd, 1H, CH), 7,05 (dd, 1H, CH).
1.50	2,6-F	1	H	F	-CO(4- NO ₂ Ph)	1		Diastereoisómero A: 1,6 (s, 6H, Me), 3,32 (d, 1H, CH ₂), 3,6 (d, 1H, CH ₂), 7,1-7,15 (m, 2H, CH), 7,2 (d, 1H, CH), 7,55-7,65 (m, 1H, CH), 8,12 (d, 2H, CH), 8,33 (d, 2H, CH).
1.51	2,6-F	1	H	F	-CO(4- NO ₂ Ph)	1		Diastereoisómero B: 1,48 (s, 3H, Me), 1,52 (s, 3H, Me), 3,15 (d, 1H, CH ₂), 3,3 (d, 1H, CH ₂), 6,85 (d, 1H, CH), 6,95-7,05 (m, 2H, CH), 7,45-7,5 (m, 1H, CH), 8,13 (d, 2H, CH), 8,17 (d, 2H, CH).

ES 2 333 977 T3

N°	R	m	R ⁵	R ⁶	Q	n	P.f. [°C]	1H-NMR (400 MHz, CDC13)
1.52	2,6-F	1	H	F	H	1		Diastereoisómero A: 1,55 (s, 6H, Me), 3,22 (d, 1H, CH ₂), 3,3 (d, 1H, CH ₂), 3,4 (s ancho, 1H, NH), 6,9 (d, 1H, CH), 7,0-7,1 (m, 2H, CH), 7,45-7,55 (m, 1H, CH).
1.53	2,6-F	1	H	F	H	1		Diastereoisómero B: 1,55 (s, 6H, Me) 3,15 (d, 1H, CH ₂), 3,22 (d, 1H, CH ₂), 3,4 (s ancho, 1H, NH), 6,65 (d, 1H, CH), 7,0-7,05 (m, 2H, CH), 7,45-7,55 (m, 1H, CH).
1.54	2,6-F	1	Cl	F	H	1		Diastereoisómero A: 1,5 (s, 3H, Me), 1,55 (s, 3H, Me), 3,2 (d, 1H, CH ₂), 3,28 (d, 1H, CH ₂), 3,85 (s ancho, 1H, NH), 7,0 (t, 2H, CH), 7,45-7,52 (m, 1H, CH).
1.55	2,6-F	1	Cl	F	H	1		Diastereoisómero B: 1,5 (s, 3H, Me), 1,52 (s, 3H, Me), 3,02 (d, 1H, CH ₂), 3,25 (d, 1H, CH ₂), 3,65 (s ancho, 1H, NH), 7,05 (t, 2H, CH), 7,45-7,55 (m, 1H, CH).
1.56	2-OCF ₃	1	H	F	H	1		mezcla 4:1 de diastereoisómeros (no separados) isómero principal: 1,5 (s, 3H, Me), 1,55 (s, 3H, Me), 3,1 (d, 1H, CH ₂), 3,12 (d, 1H, CH ₂), 3,2-3,3 (s ancho, 1H, NH), 6,7 (d, 1H, CH), 7,38-7,45 (m, 2H, CH), 7,6 (t, 1H, CH), 7,8 (d, 1H, CH), isómero secundario: 1,5 (s, 3H, Me), 1,55 (s, 3H, Me), 3,2-3,3 (m, 3H, CH ₂ y NH), 6,9 (d, 1H, CH), 7,38-7,45 (m, 2H, CH), 7,6 (t, 1H, CH), 7,65 (d, 1H, CH).

ES 2 333 977 T3

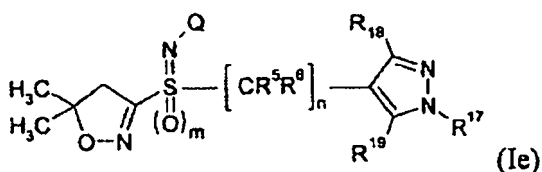
N°	R	m	R ⁵	R ⁶	Q	n	P.f. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.57	2-OCF ₃	1	F	F	H	1		1,52 (s, 3H, Me), 1,55 (s, 3H, Me), 3,15 (d, 1H, CH ₂), 3,28 (d, 1H, CH ₂), 3,5 (s ancho, 1H, NH), 7,45-7,52 (m, 2H, CH), 7,67-7,72 (m, 1H, CH), 7,75 (d, 1H, CH).
1.58	2-Cl, 3-(CO)OC ₂ H ₅ , 6-SO ₂ CH ₃	1	H	H	-COCF ₃	1		1,43 (t, 3H, Me), 1,51 (s, 3H, Me), 1,55 (s, 3H, Me), 3,08 (d, 1H, CH ₂), 3,23 (d, 1H, CH ₂), 3,38 (s, 3H, Me), 4,46 (q, 2H, CH ₂), 5,22 (d, 1H, CH ₂), 6,01 (d, 1H, CH ₂), 7,95 (d, 1H, CH), 8,15 (d, 1H, CH).
1.59	2-Cl, 3-(CO)OC ₂ H ₅ , 6-SO ₂ CH ₃	1	H	H	H	1	44- 47	1,41 (t, 3H, Me), 1,54 (s, 6H, Me), 3,17 (s, 2H, CH ₂), 3,38 (s, 3H, Me), 4,45 (q, 2H, CH ₂), 5,80 (s ancho, 2H, CH ₂), 7,86 (d, 1H, CH), 8,14 (d, 1H, CH),

Clave:

Me = metilo; s = singlete; m = multiplete; d = doblete; dd = doble doblete; t = triplete; q = cuádruplete.

TABLA 66

Compuestos de fórmula Ie



N°	m	R ⁵	R ⁶	Q	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹	n	P.f. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
2.01	1	H	H	H	CH ₃	CF ₃	Cl	1	101- 103	1,50 (s, 6H, Me), 2,3 (s ancho, 1H, NH), 3,0 (d, 1H, CH ₂), 3,2 (d, 1H, CH ₂), 3,8 (s, 3H, Me), 4,60 (d, 1H, CH ₂), 4,7 (d, 1H, CH ₂).
2.02	1	H	H	-COCF ₃	CH ₃	CF ₃	Cl	1		1,55 (s, 6H, Me), 3,15 (d, 1H, CH ₂), 3,35 (d, 1H, CH ₂), 3,94 (s, 3H, Me), 4,22 (s, 2H, CH ₂).
2.03	1	F	F	H	CH ₃	CF ₃	Cl	1		1,52 (s, 3H, Me), 1,54 (s, 3H, Me), 3,15 (d, 1H, CH ₂), 3,25 (d, 1H, CH ₂), 3,55 (s ancho, 1H, NH),

ES 2 333 977 T3

N°	m	R ⁵	R ⁶	Q	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹	n	P. f. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDC13)
										3,97 (s, 3H, Me).
2.05	1	H	H	-COCF ₃	CH ₃	CF ₃	H	1		1,51 (s, 3H, Me), 1,52 (s, 3H, Me), 3,07 (d, 1H, CH ₂), 3,30 (d, 1H, CH ₂), 4,00 (s, 3H, Me), 4,94 (s, 2H, CH ₂), 7,70 (s, 1H, CH).
2.06		H	H	H	CH ₃	CHF ₂	H	1		1,44 (s, 3H, Me), 1,47 (s, 3H, Me), 2,98 (d, 1H, CH ₂), 3,08 (d, 1H, CH ₂), 3,97 (s, 3H, Me), 4,56 (d, 1H, CH ₂), 4,62 (d, 1H, CH ₂), 7,75 (s, 1H, CH).
2.07		H	H	H	CH ₃	CHF ₂	H	1		1,43 (s, 3H, Me), 1,46 (s, 3H, Me), 2,99 (d, 1H, CH ₂), 3,08 (d, 1H, CH ₂), 3,93 (s, 3H, Me), 4,59 (d, 1H, CH ₂), 4,65 (d, 1H, CH ₂), 6,76 (t, 1H, CH), 7,70 (s, 1H, CH).
2.08		H	H	-COCF ₃	CH ₃		H	1		1,50 (s, 3H, Me), 1,51 (s, 3H, Me), 3,00 (d, 1H, CH ₂), 3,28 (d, 1H, CH ₂), 3,96 (s, 3H, Me), 4,96 (s, 2H, CH ₂), 6,76 (t, 1H, CH), 7,70 (s, 1H, CH).

Clave:

Me = metilo s = singlete d = doblete t = triplete

Ejemplos biológicos

Ejemplo B1

Acción herbicida

Plantas de prueba monocotiledóneas y dicotiledóneas se sembraron en suelo estándar esterilizado en bandejas de ensayo que tenían cada una 96 celdillas. Después de un día (antes del brote) o después de 8 a 9 días de labranza (después del brote) bajo condiciones controladas en una cámara climática (labranza a 17/23°C; 13 horas de luz; 50-60% de humedad; después de la aplicación a 19/24°C), las plantas se trataron con una solución acuosa de pulverización de 1000 mg/l del ingrediente activo usado (incluyendo DMSO al 10% como disolvente). Las plantas se desarrollaron sobre la cámara climática hasta que se evaluaba la prueba (10 = daño total a la planta, 0 = sin daño a la planta) después de 9 ó 13 días.

(Tabla pasa a página siguiente)

ES 2 333 977 T3

TABLA B1

Aplicación antes del brote

Comp. No.		Digitaria	Agrostis	Poa	Setaria
1.01	1000	10	10	10	9
1.02	1000	10	10	10	10
1.03	1000	8	7	10	8
1.04	1000	10	10	10	10
1.05	1000	9	10	10	9
1.06	1000	7	9	6	10
1.07	1000	9	10	10	9
1.08	1000	7	10	10	9
1.13	1000	9	10	10	9
1.14	1000	7	10	10	0
1.15	1000	9	10	10	8
1.17	1000	8	10	10	8
1.19	1000	9	10	6	9
1.20	1000	8	9	4	8
1.21	1000	9	10	10	9
1.22	1000	10	10	10	10
1.24	1000	9	10	0	8
1.25	1000	9	10	10	8
1.27	1000	8	5	0	5
1.28	1000	9	10	10	8
1.29	1000	8	10	10	6
1.30	1000	10	10	10	8
1.31	1000	8	10	10	8
1.32	1000	10	10	10	9
1.34	1000	9	10	10	8
1.35	1000	8	10	10	8
1.36	1000	5	10	0	7
1.48	1000	8	0	0	8
1.56	1000	9	10	10	8
2.01	1000	10	0	0	10

Ejemplo E1

Prueba de aseguramiento sobre maíz antes del brote

Las plantas de prueba se sembraron en bandejas de siembra bajo condiciones de invernadero. Se usó una tierra estándar como el sustrato de cultivo. En una fase anterior al brote, los herbicidas se aplicaron tanto por sí mismos como en una mezcla con aseguradores a la superficie del suelo. La aplicación se llevó a cabo con una suspensión acuosa de las sustancias de prueba, preparada a partir de un polvo humectable al 25% (Ejemplo F₃, b de acuerdo con el documento WO 97/34485) o a partir de un concentrado para suspensiones (Ejemplo F8 de acuerdo con el documento WO 97/34485), para alcanzar un equivalente de campo de 200 l/ha. Las pruebas se evaluaron después de 14 días (100% = plantas completamente muertas; 0% = sin acción fitotóxica sobre las plantas).

ES 2 333 977 T3

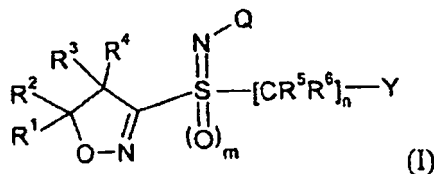
TABLA E1

Acción del asegurador durante el uso anterior al brote sobre maíz (Marista)

Comp. 1.01 WP 25% AW/W	Comp. 1.01 WP 25% AW/W	Comp. 1.01 WP 25% AW/W	Comp. 1.01 WP 25% AW/W
400 200 [g/ha]	400 200 [g/ha] Benoxacor WP 25% AW/W 100 50 [g/ha]	400 200 [g/ha] Dicloromid EC 250 GA/L 100 50 [g/ha]	400 200 [g/ha] Furilazol WP 5% AW/W 100 50 [g/ha]
62,5 67,5 [%]	55 0 [%]	57,5 7,5 [%]	25 2,5 [%]

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I)



en la que

R¹ y R² son ambos alquilo C₁-C₁₀;

R³ y R⁴ son ambos hidrógeno;

R⁵ y R⁶ son cada uno independientemente del otro hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo o halógeno;
m es 0 ó 1;

n es 1;

Q es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, haloalcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, alquil(C₁-C₆)-carbonilo, haloalquil(C₁-C₆)-carbonilo, fenilcarbonilo o fenilcarbonilo sustituido con uno a tres R⁹, o

Q es piridilcarbonilo o piridilcarbonilo sustituido con uno a tres R⁹, o

Q es nitro, formilo, alquil(C₁-C₆)-sulfonilo o haloalquil(C₁-C₆)-sulfonilo, o

Q es fenilsulfonilo o fenilsulfonilo sustituido con uno a tres R⁹, o

Q es un heterociclo de 3 a 10 miembros que contiene uno a tres átomos de nitrógeno, oxígeno o azufre, heterociclo que puede estar benzocondensado, y heterociclo que puede estar sustituido con alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o ciano; e

Y es fenilo, que está opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₆)-carbonilo, ciano, halógeno, alquil(C₁-C₆)-tio, haloalquil(C₁-C₆)-tio, alquil(C₁-C₆)-sulfonilo, haloalquil(C₁-C₆)-sulfonilo, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ o fenilo, o

Y es un heterociclo de 5 a 10 miembros que contiene uno a tres átomos de nitrógeno, oxígeno o azufre, que está opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o halógeno;

R⁹ son independientemente unos de otros nitro o halógeno; y

N-óxidos, sales e isómeros ópticos de compuestos de fórmula I.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que R¹ y R² son ambos metilo.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que R⁵ y R⁶ son independientemente entre sí hidrógeno, fluoro, cloro, metilo, acetilo o metoxycarbonilo.

4. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que R⁵ y R⁶ son independientemente entre sí halógeno.

5. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que R⁵ y R⁶ se seleccionan de cloro y flúor.

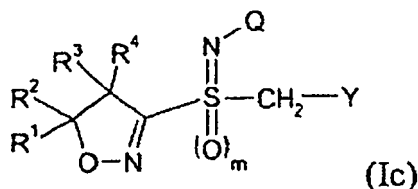
6. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que R⁵ y R⁶ son flúor.

7. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que Q es hidrógeno, formilo o acetilo.

8. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que Q es hidrógeno.

9. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que m es 1.

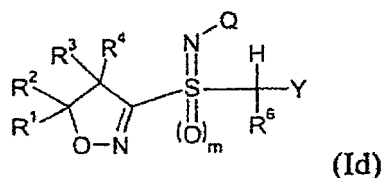
10. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula I, en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , Q e Y son como se definen en la reivindicación 1 y m es 1 y n es 1, en el que un compuesto de fórmula Ic,



en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , Q e Y son como se definen en la reivindicación 1 y m es 1, se hace reaccionar en un disolvente inerte en presencia de una base en una sola etapa o por etapas en sucesión con compuestos de la fórmula R^5-X^A y/o R^6-X^A , en la que R^5 y R^6 son como se definen en la reivindicación 1 y X^A es un grupo de salida.

11. Un procedimiento de acuerdo con la reivindicación 10, en el que R^5 y/o R^6 son halógeno.

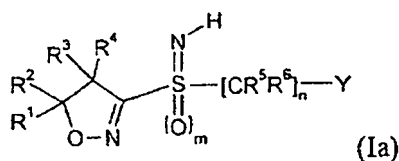
12. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula I en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , Q e Y son como se definen en la reivindicación 1, R^6 es alquilo C_1-C_{10} o halógeno, m es 1 y n es 1, en el que un compuesto de fórmula Id,



en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , Q e Y son como se definen en la reivindicación 1, R^6 es alquilo C_1-C_{10} o halógeno y m es 1, se hace reaccionar en un disolvente inerte en presencia de una base con un compuesto de fórmula R^5-X^A , en la que R^5 es como se define en la reivindicación 1 y X^A es un grupo de salida.

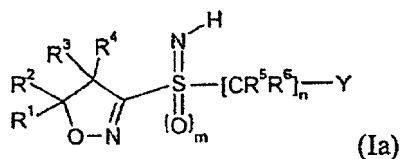
13. Un procedimiento de acuerdo con la reivindicación 12, en el que R^5 es halógeno.

14. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula I en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , Q, n e Y son como se definen en la reivindicación 1 y m es 0 ó 1, en el que un compuesto de fórmula Ia,



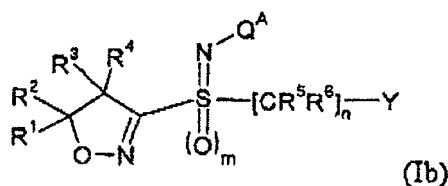
en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , n e Y son como se definen en la reivindicación 1 y m es 0 ó 1, se hace reaccionar en un disolvente inerte en presencia de una base con un compuesto de la fórmula $Q-X^A$, en la que Q es como se define en la reivindicación 1 y X^A es un grupo de salida.

15. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula I en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , Q, n y X son como se definen en la reivindicación 1 y m es 1, en el que un compuesto de fórmula Ia,



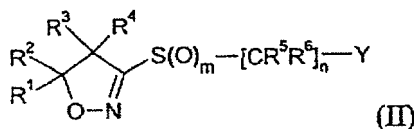
en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , n e Y son como se definen en la reivindicación 1 y m es 1, se hace reaccionar en un disolvente inerte con un agente de nitración.

16. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula Ia en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , n e Y son como se definen en la reivindicación 1 y m es 0 ó 1, en el que un compuesto de fórmula Ib,



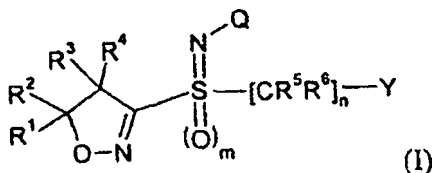
en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , n e Y son como se definen en la reivindicación 1, m es 0 ó 1 y Q^A es un grupo ávido de electrones, se hace reaccionar en un disolvente inerte bien con un ácido, bien con una base o bien con un nucleófilo adecuado.

17. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula Ib en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , n e Y son como se definen en la reivindicación 1 y m es 0 ó 1, en el que un compuesto de fórmula II,



en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , n e Y son como se definen en la reivindicación 1 y m es 0 ó 1, se hace reaccionar en un disolvente inerte en presencia de un catalizador de metal de transición adecuado con una azida orgánica o con un reactivo de iminación de la fórmula $ArI=NQ^A$, en la que Q^A es un grupo ávido de electrones y Ar es un fenilo opcionalmente sustituido.

18. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula I en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , Q , n e Y son como se definen en la reivindicación 1 y m es 1, en el que un compuesto de fórmula I,



en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , Q , n e Y son como se definen en la reivindicación 1 y m es 0, se hace reaccionar con un oxidante en un disolvente inerte.

19. Una composición herbicida que comprende una cantidad herbicidamente eficaz de un compuesto de fórmula I además de adyuvantes de formulación.

20. Una composición de acuerdo con la reivindicación 19, que comprende un herbicida adicional además del compuesto de fórmula I.

21. Una composición de acuerdo con la reivindicación 19, que comprende un asegurador además del compuesto de fórmula I.

22. Un método para controlar hierbas y malas hierbas en cultivos de plantas útiles, que comprende aplicar una cantidad herbicidamente eficaz de un compuesto de fórmula I, o de una composición que comprende tal compuesto, a las plantas o a su emplazamiento.