

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 380 272**

51 Int. Cl.:
C07D 401/14 (2006.01)
C07D 403/14 (2006.01)
C07D 405/14 (2006.01)
C07D 409/14 (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01)
C07D 417/14 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01)
A01N 43/48 (2006.01)
A01N 43/74 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **08740616 .1**
96 Fecha de presentación: **11.04.2008**
97 Número de publicación de la solicitud: **2144898**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **20.01.2010**

54 Título: **Compuesto de hidrazida heterocíclico y uso plaguicida del mismo**

30 Prioridad:
12.04.2007 JP 2007104468

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
10.05.2012

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
10.05.2012

73 Titular/es:
SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED
27-1, SHINKAWA 2-CHOME, CHUO-KU
TOKYO 104-8260, JP

72 Inventor/es:
JACHMANN, Markus;
NOKURA, Yoshihiko y
IKEGAMI, Hiroshi

74 Agente/Representante:
Ungría López, Javier

ES 2 380 272 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

Compuesto de Hidrazida Heterocíclico y Uso Plaguicida del Mismo

5 Campo Técnico

La presente invención se refiere a un compuesto de hidrazida y el uso plaguicida del mismo.

10 Técnica Anterior

El documento WO 2002/070483 describe diversas actividades de compuestos diamídicos heteroaromáticos de 5 y 6 miembros. Además, en el documento WO 2007/020050 se describen compuestos diamídicos heterobocíclicos y su uso para controlar plagas nocivas en agricultura.

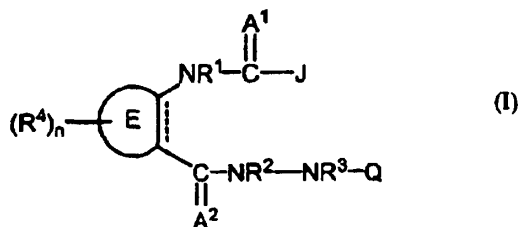
15 Descripción de la Invención

La presente invención está destinada a proporcionar un compuesto que tiene una eficacia excelente para controlar plagas.

20 Los autores de la presente invención han estudiado detenidamente con el fin de encontrar un compuesto que tenga una eficacia excelente para controlar plagas y, como resultado, encontraron que un compuesto de hidrazida representado por la siguiente fórmula (1) tiene una eficacia de control excelente. De este modo, se ha completado la presente invención.

25 De acuerdo con la presente invención, se proporciona:

Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (I) (referido más adelante como el presente compuesto), un N-óxido del mismo o una sal adecuada del mismo:



30 donde,

A¹ y A² representan independientemente un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

E representa, junto con los dos átomos de carbono conectores contiguos, un sistema anular heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema anular heterobocíclico fusionado de 8, 9 o 10 miembros

35 R¹ representa un átomo de hidrógeno, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cianoalquilo C2-C6, hidroxialquilo C1-C6, alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquenilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquinilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxi(C2-C6)carbonilo, alquil(C2-C6)aminocarbonilo, dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo, o trialquil(C3-C6)sililo;

40 o representa fenilo, fenilalquilo C7-C9 o fenilcarbonilo: cada uno de dichos anillos de fenilo sustituidos opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) hidroxilo, (5) carboxilo, (6) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) hidroxialquilo C1-C6, (8) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) cianoalquilo C2-C6, (10) alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquenilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alquinilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (14) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (15) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (16) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (17) alquil(C1-C6)amino, (18) dialquil(C2-C8)amino, (19) cicloalquil(C3-C6)amino, (20) alquil(C2-C6)carbonilo, (21) alcoxi(C2-C6)carbonilo, (22) alquil(C2-C6)aminocarbonilo, (23) dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, (24) cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo y (25) trialquil(C3-C6)sililo,

55 R² y R³ representan independientemente un átomo de hidrógeno, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cianoalquilo C2-C6, hidroxialquilo C1-C6, alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente

con uno o más átomos de halógeno, alquenilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquinilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfínico sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxil(C2-C6)carbonilo, alquil(C2-C6)aminocarbonilo, dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo, o trialquil(C3-C6)sililo; o representa fenilo, fenilalquilo C7-C9 o fenilcarbonilo: cada uno de dichos anillos de fenilo sustituidos opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) hidroxilo, (5) carboxilo, (6) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) hidroxialquilo C1-C6, (8) alcoxil C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) cianoalquilo C2-C6, (10) alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquenilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alquinilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (14) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (15) alquil(C1-C6)sulfínico sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (16) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (17) alquil(C1-C6)amino, (18) dialquil(C2-C8)amino, (19) cicloalquil(C3-C6)amino, (20) alquil(C2-C6)carbonilo, (21) alcoxil(C2-C6)carbonilo, (22) alquil(C2-C6)aminocarbonilo, (23) dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, (24) cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo y (25) trialquil(C3-C6)sililo; o

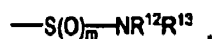
R² y R³ se toman junto con los dos átomos de nitrógeno a los que están unidos para formar un anillo de 5 a 8 miembros que contiene dos átomos de nitrógeno, uno o más CH₂ o C(=O), y opcionalmente uno o dos miembros anulares seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de oxígeno, (2) un átomo de azufre, (3) S(=O), (4) S(=O)₂ y (4) NR^a (donde R^a representa alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, o un fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxil C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfínico sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno); y donde el anillo en los átomos de carbono está sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, y (3) alcoxil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; R⁴ representa un átomo de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, carboxilo, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxil C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cianoalquilo C2-C6, alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquenilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquinilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfínico sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)amino, dialquil(C2-C8)amino, cicloalquil(C3-C6)amino, alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxil(C2-C6)carbonilo, alquil(C2-C6)aminocarbonilo, dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, o trialquil(C3-C6)sililo; o representa un fenilo, bencilo, fenoxil, o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) hidroxilo, (5) carboxilo, (6) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) hidroxialquilo C1-C6, (8) alcoxil C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) cianoalquilo C2-C6, (10) alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquenilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alquinilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (14) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (15) alquil(C1-C6)sulfínico sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (16) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (17) alquil(C1-C6)amino, (18) dialquil(C2-C8)amino, (19) cicloalquil(C3-C6)amino, (20) alquil(C2-C6)carbonilo, (21) alcoxil(C2-C6)carbonilo, (22) alquil(C2-C6)aminocarbonilo, (23) dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, (24) cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo y (25) trialquil(C3-C6)sililo,

n representa un número entero de 0 a 3 (siempre que, cuando n es un número entero de 2 o más, los R⁴ pueden ser iguales o diferentes);
Q representa Q1, Q2, Q3, Q4, Q5 o Q6:

Q1: -C(=A³¹)-R⁶
 Q2: -C(=A³²)-OR⁷
 Q3: -C(=A³³)-SR⁸
 Q4: -C(=A³⁴)-NR⁹R¹⁰
 Q5:

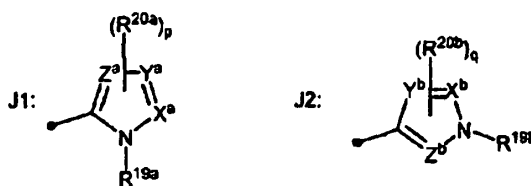


Q6:



- 10 A³¹, A³², A³³ y A³⁴ representan un átomo de oxígeno, o un átomo de azufre;
 m representa un número entero de 0 a 2
 R⁶ representa un átomo de hidrógeno; alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquino C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquilo C1-C6 sustituido
 15 opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (3) alquil(C1-C6)tio
 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (4) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de
 20 halógeno, (6) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, y (7) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente
 con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; fenilo sustituido opcionalmente con
 uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2)
 25 ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6
 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno
 o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno,
 30 (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino
 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente
 con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-
 C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-
 C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; naftilo sustituido opcionalmente
 con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2)
 35 ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5)
 alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; un anillo heterocíclico no aromático de 3
 a 8 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que
 40 consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de
 halógeno; fenilalquilo C7-C9 o fenoxialquilo C7-C9: cada uno de dichos anillos de fenilo sustituidos opcionalmente
 con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2)
 ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6
 45 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;
 R⁷ y R⁸ representan alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alcoxialquilo C2-C6
 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o
 más átomos de halógeno; alquino C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cicloalquilo
 C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste
 50 en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;
 fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste
 en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos
 de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio
 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente
 con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de
 55 halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-
 C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido
 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno
 o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de
 halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;
 heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados
 60 del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente
 con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;
 o fenilalquilo C7-C9 cuyo radical anular fenilo está sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes
 independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo

C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno,
 R^9 y R^{10} representan independientemente un átomo de hidrógeno; alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;
 5 alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquino C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro,
 10 (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; o fenilalquilo C7-C9 cuyo radical anular fenilo está sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno,
 20 R^{11} representa alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; o un fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; o un anillo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno,
 35 R^{12} y R^{13} representan independientemente alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; o fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; J representa J1 o J2:



X^a , Y^a , Z^a , X^b , Y^b y Z^b representan independientemente CH o un átomo de nitrógeno;
 R^{19a} y R^{19b} representan un átomo de hidrógeno; alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cianoalquilo C2-C6, alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;
 50 alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquino C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro,
 55 (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino

sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; fenilalquilo C7-C9 cuyo anillo de fenilo está sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; o piridinilalquilo C7-C9 cuyo anillo de piridina está sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, R^{20a} y R^{20b} representan un átomo de halógeno; ciano; nitro; tiocianato; alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cianoalquilo(C2-C6)oxi; alcoxi(C2-C6)alquiloxi sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquenil(C2-C6)oxi sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquinil(C2-C6)oxi sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; o fenoxi sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, p representa un número entero de 0 a 3 (siempre que, cuando p es un número entero de 2 o 3, dos o más R^{20a} pueden ser iguales o diferentes); q representa un número entero de 0 a 3 (siempre que, cuando q es un número entero de 2 o 3, dos o más R^{20b} pueden ser iguales o diferentes).

Además esta invención también contiene un método para controlar una plaga de invertebrados aplicando el presente compuesto, un N-óxido del mismo o una sal adecuada de mismo desde el punto de vista agrícola mediante contacto directamente con una plaga, o con el lugar en el que habita la plaga. Que incluye el uso del presente compuesto, un N-óxido del mismo o una sal adecuada de mismo desde el punto de vista agrícola como ingrediente activo en una composición plaguicida.

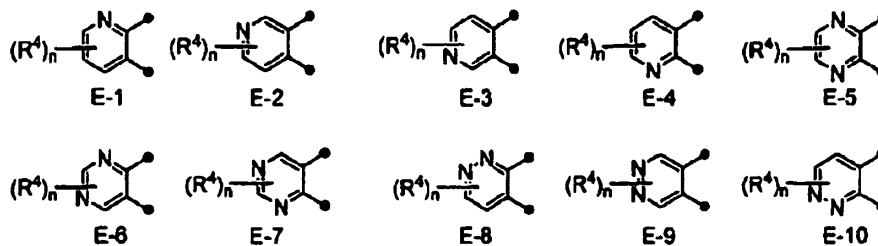
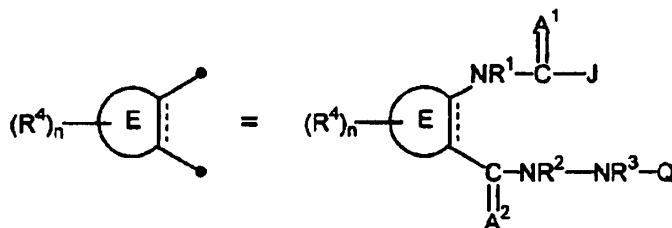
Una composición que comprende el presente compuesto, un N-óxido del mismo o una sal adecuada de mismo desde el punto de vista agrícola y al menos un componente adicional seleccionado del grupo de tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. Esta invención también incluye un método para controlar una plaga de invertebrados mediante el uso del presente compuesto, un N-óxido del mismo o una sal adecuada de mismo desde el punto de vista agrícola como ingrediente activo en una composición plaguicida y una cantidad activa desde el punto de vista biológico de al menos un compuesto o agente adicional. La invención también tiene que ver con el uso del presente compuesto, un N-óxido del mismo o una sal adecuada de mismo desde el punto de vista agrícola para la fabricación de una preparación plaguicida.

10 **Mejor Modo de Llevar a Cabo la Invención**

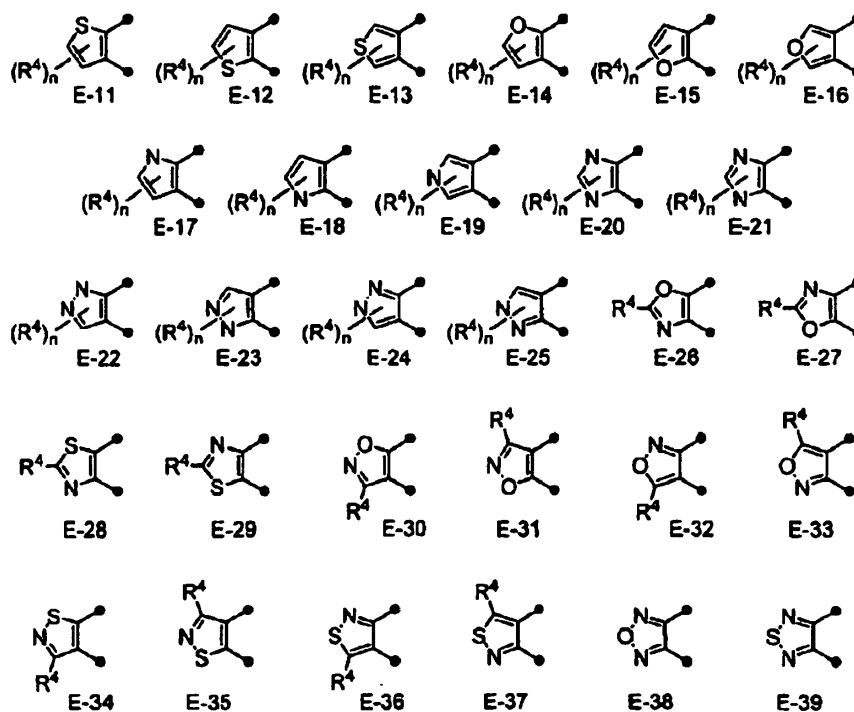
Los compuestos de esta invención incluyen todos los estereoisómeros posibles en términos de enantiómeros y diastereómeros que se pueden formar a partir de la diferente configuración en los centros de asimetría y la diferente configuración del enlace doble de acuerdo con la definición comúnmente aceptada de isómeros conformacionales (Eliel, Ernest L., Wilien, Samuel H., Stereochemistry of Organic Compounds, John Wiley & Son, 1994). Los compuestos de la invención pueden estar presentes en forma de una mezcla de los isómeros anteriormente mencionados, en forma de un solo diastereómero o en una forma ópticamente enriquecida como ingredientes activos. Además, los compuestos de fórmula I de esta invención pueden estar presentes en forma de un N-óxido del mismo o una sal adecuada de mismo desde el punto de vista agrícola. Todos los átomos de nitrógeno disponibles cuyos pares solitarios no son parte del orbital molecular Π aromático de acuerdo con la regla de Hückel se pueden oxidar a sus pares solitarios para formar N-óxidos utilizando métodos conocidos comúnmente. Las sales adecuadas desde el punto de vista agrícola de los compuestos de esta invención se pueden formar mediante adición de un ácido inorgánico u orgánico al compuesto como por ejemplo ácido clorhídrico, bromhídrico, sulfúrico, nítrico y fosfórico así como ácido acético, propiónico, butírico, oxálico, malónico, tartárico, láctico, maleico, fumárico, cítrico, p-toluenosulfónico y salicílico. En caso de que los compuestos contengan radicales ácidos como carboxilo, sulfonilo o fenol, las sales se pueden formar mediante adición de una base inorgánica u orgánica p. ej. los hidróxidos y carbonatos de litio, sodio, potasio, magnesio, calcio y bario o aminas como amoníaco, piridina o trietilamina. Los términos 'aromático' y 'heteroaromático' indican que el sistema anular carbocíclico o heterocíclico está completamente insaturado con un sistema anular planar que permite los orbitales p del sistema anular y opcionalmente orbitales pares solitarios de heteroátomos, que son perpendiculares al plano del anillo para solaparse para formar un orbital molecular Π con $(4n+2)$ electrones Π de acuerdo con la regla de Hückel (n es 0 o un número entero positivo). El término 'no aromático' o 'sistema anular heterocíclico no aromático' hace referencia a un sistema anular, que está completamente o parcialmente saturado o que está completamente insaturado pero no cumple los requerimientos de la regla de Hückel como se ha mencionado anteriormente. El término 'hetero' en 'heteroaromático', 'heterobícíclico' y 'anillo heterocíclico no aromático' indica un sistema anular que contiene al menos uno o más átomos diferentes de carbono, seleccionados del grupo de oxígeno, nitrógeno y azufre. El sistema anular heterocíclico se puede anclar a cualquier átomo de carbono o nitrógeno disponible remplazando el hidrógeno.

Más adelante, se ilustran los ejemplos de los "sustituyentes".

Los ejemplos del sistema anular heteroaromático de 5 o 6 miembros sustituido con $(R^4)_n$ incluyen E-1 a E-39 mostrados más abajo. Los sistemas anulares heteroaromáticos E-1 a E-39 se anclan con su enlace superior derecho de un átomo de carbono disponible al átomo de nitrógeno del radical $-NR^1(C=A^1)$ J. El radical hidrazida $-(C=A^2)_N R^2 N R^3 Q$ se ancla con el átomo de carbono $-(C=A^2)$ a un átomo de carbono disponible en el enlace inferior derecho de los sistemas anulares ilustrados E-1 a E-39.



50

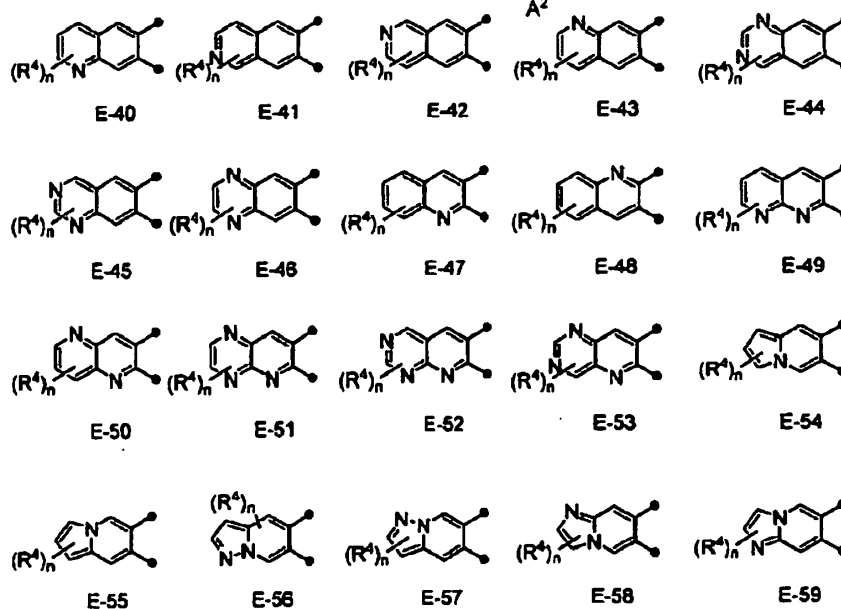
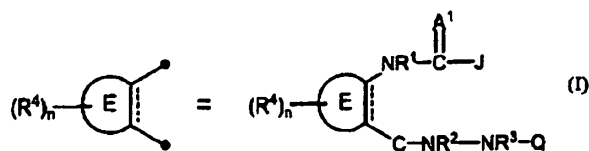


5

10

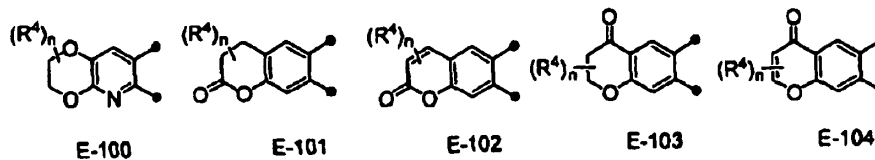
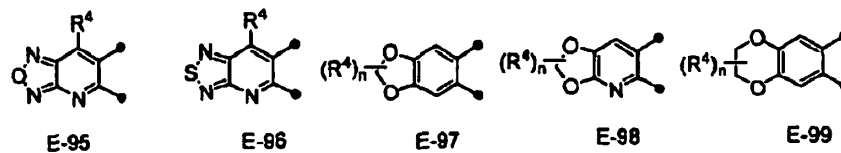
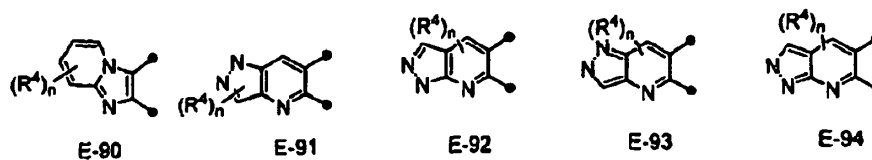
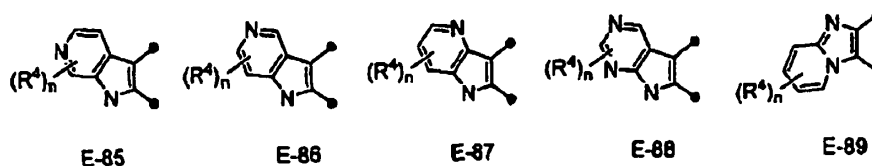
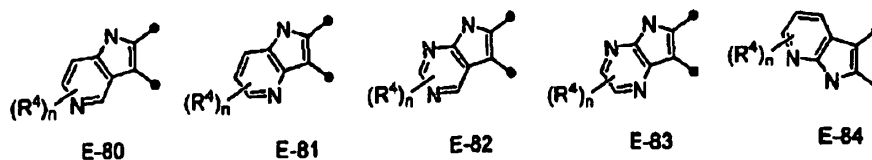
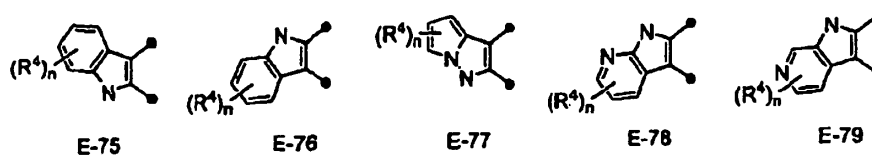
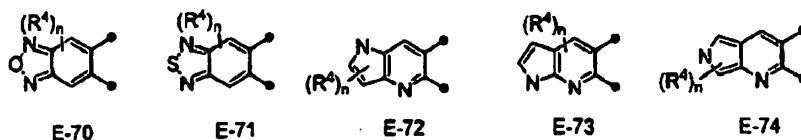
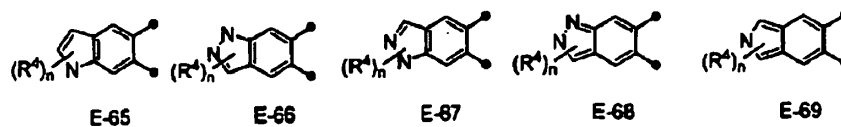
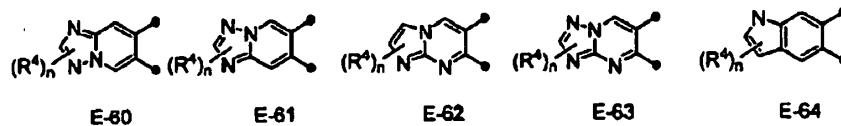
Los ejemplos del sistema anular heterobicclico fusionado de 8, 9 o 10 miembros sustituido con $(R^4)_n$ incluyen E-40 a E-109 mostrados más abajo. La sustitución de dichos sistemas anulares heterobicclicos con sustituyentes R^4 es posible mediante la sustitución de los átomos de H del carbono y el nitrógeno en los sistemas anulares aromáticos así como en los radicales conectores no aromáticos (E-97-101, E-103, E-105, E-107-109). Los sistemas anulares heteroaromáticos E-40 a E-109 están unidos con su enlace superior derecho de un átomo de carbono disponible al átomo de nitrógeno del radical $-NR^1(C=A^1)J$. El radical hidrazida $-(C=A^2)_nR^2NR^3Q$ está unido con el átomo de carbono $-(C=A^2)$ a un átomo de carbono disponible en el enlace inferior derecho de los sistemas anulares ilustrados E-40 a E-109.

15



20

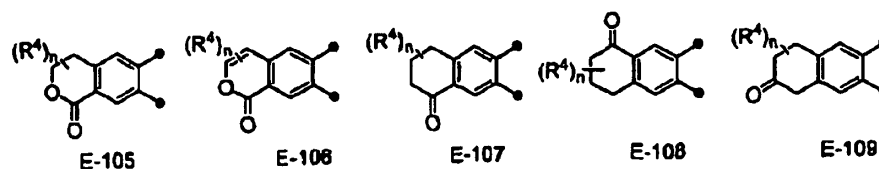
25



5

10

15



Los sistemas anulares preferidos incluyen E-2, E-4, E-7, E-12, E-13, E-22, E-40 y E47; muy preferidos E-2 y E-4.

- 5 Los ejemplos de un átomo de halógeno incluyen un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

Los ejemplos de alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno incluyen metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, pentilo y hexilo así como fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorometilo, diclorometilo, triclorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,1,2,2-tetrafluoroetilo y pentafluoroetilo.

Los ejemplos de alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (3) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (4) alquil(C1-C6)sulfínico sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, y (7) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno incluyen

metilo, trifluorometilo, triclorometilo, clorometilo, diclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, metoximetilo, etoximetilo, metiltiommetilo, etiltiommetilo, metilsulfínico, metilsulfonilmetilo, dimetilaminometilo, ciclopropilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, etilo, pentafluoroetilo, propilo, isopropilo, butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, pentilo y hexilo.

Los ejemplos de cianoalquilo C2-C6 incluyen cianometilo y 2-cianoetilo.

Los ejemplos de C2-C6 cianoalcoxi incluyen cianometoxi y 2-cianoetoxi.

Los ejemplos de hidroxialquilo C1-C6 incluyen hidroximetilo, 1-hidroxietilo, 2-hidroxietilo, 1-hidroxipropilo, 2-hidroxipropilo, 3-hidroxipropilo y 2-hidroxisopropilo.

Los ejemplos de alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno incluyen metoxi, trifluorometoxi, etoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, propiloxi, isopropiloxi, butoxi, isobutiloxi, sec-butoxi, terc-butoxi, pentiloxi y hexiloxi.

Los ejemplos de alcoxi(C2-C6)alquilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno incluyen metoximetilo, etoximetilo, 2-metoxietilo, 2-etoxietilo y 2-isopropiloxietilo.

Los ejemplos de alcoxi(C2-C6)alquilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno incluyen 2-(metoxi)etoxi.

Los ejemplos de alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno incluyen 2-propenilo, 3-cloro-2-propenilo, 2-cloro-2-propenilo, 3,3-dicloro-2-propenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 2-metil-2-propenilo, 3-metil-2-butenilo, 2-pentenilo y 2-hexenilo así como polienos como 1,3-pentadienilo y 2,4-hexadienilo y todos los diastereómeros posibles.

Los ejemplos de alqueno(C2-C6)oxi sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno incluyen 2-propeniloxi, 3,3-dicloro-2-propeniloxi y 2-metil-2-propeniloxi.

Los ejemplos de alquino C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno incluyen 2-propinilo, 3-cloro-2-propinilo, 3-bromo-2-propinilo, 2-butilinilo y 3-butilinilo así como poliinos como 2,5-hexadiinilo.

Los ejemplos de alquino(C2-C6)oxi sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno incluyen 2-propiniloxi, 3-cloro-2-propiniloxi y 2-butiliniloxi.

Los ejemplos de alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno incluyen metiltio, trifluorometiltio, etiltio, propiltio, isopropiltio, butiltio, isobutiltio, sec-butiltio, terc-butiltio, pentiltio y hexiltio.

- Los ejemplos de alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno incluyen metilsulfinilo, trifluorometilsulfinilo, etilsulfinilo, propilsulfinilo, isopropilsulfinilo, butilsulfinilo, isobutilsulfinilo, sec-butilsulfinilo, terc-butilsulfinilo, pentilsulfinilo y hexilsulfinilo. La definición incluye los dos enantiómeros de sulfóxido.
- 5 Los ejemplos de alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno incluyen metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, etilsulfonilo, propilsulfonilo, isopropilsulfonilo, butilsulfonilo, isobutilsulfonilo, sec-butilsulfonilo, terc-butilsulfonilo, pentilsulfonilo y hexilsulfonilo.
- 10 Los ejemplos de alquil(C1-C6)amino incluyen metilamino, etilamino, n-propilamino, isopropilamino, n-butilamino, sec-butilamino, isobutilamino y terc-butilamino.
- 15 Los ejemplos de alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno alquilamino incluyen metilamino, etilamino, n-propilamino, isopropilamino, n-butilamino, sec-butilamino, isobutilamino, terc-butilamino, 2-fluoroetilamino, 2,2,2-trifluoroetilamino, 2,2,3,3,3-pentafluoropropilamino y 2,2,3,3,4,9,9-heptafluoroamino.
- Los ejemplos de dialquil(C2-C8)amino incluyen dimetilamino, dietilamino, etilmetilamino, di-n-propilamino, diisopropilamino y di-n-butilamino.
- 20 Los ejemplos de dialquil(C2-C8)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno incluyen dimetilamino, dietilamino, etilmetilamino, bis(2,2,2-trifluoroetil)amino, di-n-propilamino, diisopropilamino y di-n-butilamino.
- 25 Los ejemplos de cicloalquil(C3-C6)amino incluyen ciclopropilamino, ciclobutilamino, ciclopentilamino y ciclohexilamino.
- Los ejemplos de alquil(C2-C6)carbonilo incluyen acetilo, propionilo, isobutirilo y trimetilacetilo.
- 30 Los ejemplos de alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno incluyen acetilo, trifluoroacetilo, tricloroacetilo, propionilo, pentafluoropropionilo, isobutirilo y trimetilacetilo.
- Los ejemplos de alcoxi(C2-C6)carbonilo incluyen metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo y terc-butoxicarbonilo.
- 35 Los ejemplos de alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno incluyen metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, 2-fluoroetoxicarbonilo, 2,2,2-trifluoroetoxicarbonilo, 2,2,2-tricloroetoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo y terc-butoxicarbonilo.
- 40 Los ejemplos de alquil(C2-C6)aminocarbonilo incluyen metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n-propilaminocarbonilcarbonilo, isopropilaminocarbonilo, n-butilaminocarbonilo, sec-butilaminocarbonilo, isobutilaminocarbonilo y terc-butilaminocarbonilo.
- 45 Los ejemplos de alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno incluyen metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n-propilaminocarbonilo, isopropilaminocarbonilo, n-butilaminocarbonilo, sec-butilaminocarbonilo, isobutilaminocarbonilo, terc-butilaminocarbonilo, 2-fluoroetilaminocarbonilo, 2,2,2-trifluoroetilaminocarbonilo, 2,2,3,3,3-pentafluoropropilaminocarbonilaminocarbonilo y 2,2,3,3,9,4,4-heptafluorobutilaminocarbonilo.
- 50 Los ejemplos de dialquil(C3-C8)aminocarbonilo incluyen dimetilaminocarbonilo y dietilaminocarbonilo.
- Los ejemplos de cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo incluyen ciclopropilaminocarbonilo, ciclobutilaminocarbonilo, ciclopentilaminocarbonilo y ciclohexilaminocarbonilo.
- 55 Los ejemplos de trialquil(C3-C6)sililo incluyen trimetilsililo, trietilsililo y terc-butildimetilsililo.
- Los ejemplos de cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno incluyen ciclopropilo, 2-metilciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo.
- 60 Los ejemplos de fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) hidroxilo, (5) carboxilo, (6) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) hidroxialquilo C1-C6, (8) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) cianoalquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11)

alquenilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alquinilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (14) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (15) alquil(C1-C6)sulfino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (16) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (17) alquil(C1-C6)amino, (18) dialquil(C2-C8)amino, (19) cicloalquil(C3-C6)amino, (20) alquil(C2-C6)carbonilo, (21) alcoxi(C2-C6)carbonilo, (22) alquil(C2-C6)aminocarbonilo, (23) dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, (24) cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo y (25) trialquil(C3-C6)sililo incluyen fenilo, 2-fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 2-clorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 2-bromofenilo, 2-yodofenilo, 2,6-difluorofenilo, 2,6-diclorofenilo, 2-cloro-6-fluorofenilo, 2-cloro-4-fluorofenilo, 2-cianofenilo, 3-cianofenilo, 4-cianofenilo, 2-nitrofenilo, 3-nitrofenilo, 4-nitrofenilo, 2-metilfenilo, 3-metilfenilo, 4-metilfenilo, 2-etilfenilo, 2-isopropilfenilo, 2-terc-butilfenilo, 2-(trifluorometil)fenilo, 3-(trifluorometil)fenilo, 4-(trifluorometil)fenilo, 2-metoxifenilo, 3-metoxifenilo, 4-metoxifenilo, 2-etoxifenilo, 2-(trifluorometoxi)fenilo, 2-(metiltio)fenilo, 2-(metilsulfonil)fenilo y 2-(metilsulfonil)fenilo.

Los ejemplos de bencilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) hidroxilo, (5) carboxilo, (6) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) hidroxialquilo C1-C6, (8) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) cianoalquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) alcóxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquenilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alquinilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (14) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (15) alquil(C1-C6)sulfino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (16) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (17) alquil(C1-C6)amino, (18) dialquil(C2-C8)amino, (19) cicloalquil(C3-C6)amino, (20) alquil(C2-C6)carbonilo (21) alcoxi(C2-C6)carbonilo, (22) alquil(C2-C6)aminocarbonilo, (23) dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, (24) cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo y (25) trialquil(C3-C6)sililo incluyen bencilo, 2-fluorobencilo, 3-fluorobencilo, 4-fluorobencilo, 2-clorobencilo, 3-clorobencilo, 4-clorobencilo, 2-bromobencilo, 2-yodobencilo, 2,6-difluorobencilo, 2,6-diclorobencilo, 2-cloro-6-fluorobencilo, 2-cloro-4-fluorobencilo, 2-cianobencilo, 3-cianobencilo, 4-cianobencilo, 2-nitrobencilo, 3-nitrobencilo, 4-nitrobencilo, 2-metilbencilo, 3-metilbencilo, 4-metilbencilo, 2-etilbencilo, 2-isopropilbencilo, 2-terc-butilbencilo, 2-(trifluorometil)bencilo, 3-(trifluorometil)bencilo, 4-(trifluorometil)bencilo, 2-metoxibencilo, 3-metoxibencilo, 4-metoxibencilo, 2-etoxibencilo, 2-(trifluorometoxi)bencilo, 2-(metiltio)bencilo, 2-(metilsulfonil)bencilo y 2-(metilsulfonil)bencilo.

Los ejemplos de fenilalquilo C7-C9 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) hidroxilo, (5) carboxilo, (6) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) hidroxialquilo C1-C6, (8) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) cianoalquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) alcóxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquenilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alquinilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (14) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (15) alquil(C1-C6)sulfino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (16) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (17) alquil(C1-C6)amino, (18) dialquil(C2-C8)amino, (19) cicloalquil(C3-C6)amino, (20) alquil(C2-C6)carbonilo, (21) alcoxi(C2-C6)carbonilo, (22) alquil(C2-C6)aminocarbonilo, (23) dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, (24) cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo y (25) trialquil(C3-C6)sililo incluyen bencilo, 1-feniletilo, 2-feniletilo, 2-clorobencilo, 3-clorobencilo, 4-clorobencilo, 2-cianobencilo, 3-cianobencilo, 4-cianobencilo, 2-nitrobencilo, 3-nitrobencilo, 4-nitrobencilo, 2-metilbencilo, 3-metilbencilo, 4-metilbencilo, 2-(trifluorometil)bencilo, 3-(trifluorometil)bencilo, 4-(trifluorometil)bencilo, 2-metoxibencilo, 3-metoxibencilo y 4-metoxibencilo.

Los ejemplos de fenoxi sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) hidroxilo, (5) carboxilo, (6) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) hidroxialquilo C1-C6, (8) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) cianoalquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) alcóxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquenilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alquinilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (14) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (15) alquil(C1-C6)sulfino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (16) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (17) alquil(C1-C6)amino, (18) dialquil(C2-C8)amino, (19) cicloalquil(C3-C6)amino, (20) alquil(C2-C6)carbonilo, (21) alcoxi(C2-C6)carbonilo, (22) alquil(C2-C6)aminocarbonilo, (23) dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, (24) cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo y (25) trialquil(C3-C6)sililo incluyen fenoxi, 2-clorofenoxi, 3-clorofenoxi, 4-clorofenoxi, 2-cianofenoxi, 3-cianofenoxi, 4-cianofenoxi, 2-

nitrofenoxi, 3-nitrofenoxi, 4-nitrofenoxi, 2-metilfenoxi, 3-metilfenoxi, 4-metilfenoxi, 2-(trifluorometil)fenoxi, 3-(trifluorometil)fenoxi, 4-(trifluorometil)fenoxi, 2-metoxifenoxi, 3-metoxifenoxi, 4-metoxifenoxi y 4-(trifluorometoxi)fenoxi

Los ejemplos de fenoxialquilo C7-C9 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno incluyen fenoximetilo, fenoxietilo, 2-clorofenoximetilo, 2-clorofenoxietilo, 3-clorofenoximetilo, 3-clorofenoxietilo, 4-clorofenoximetilo, 4-clorofenoxietilo, 2-cianofenoximetilo, 2-cianofenoxietilo, 3-cianofenoximetilo, 3-cianofenoxietilo, 4-cianofenoximetilo, 4-cianofenoxietilo, 2-nitrofenoximetilo, 2-nitrofenoxietilo, 3-nitrofenoximetilo, 3-nitrofenoxietilo, 4-nitrofenoximetilo, 4-nitrofenoxietilo, 2-metilfenoximetilo, 2-metilfenoxietilo, 3-metilfenoximetilo, 3-metilfenoxietilo, 4-metilfenoximetilo, 4-metilfenoxietilo, 2-(trifluorometil)fenoximetilo, 2-(trifluorometil)fenoxietilo, 3-(trifluorometil)fenoximetilo, 3-(trifluorometil)fenoxietilo, 4-(trifluorometil)fenoximetilo, 4-(trifluorometil)fenoxietilo, 2-metoxifenoximetilo, 2-metoxifenoxietilo, 3-metoxifenoximetilo, 3-metoxifenoxietilo, 4-metoxifenoximetilo, 4-metoxifenoxietilo, 4-(trifluorometoxi)fenoximetilo y 4-(trifluorometoxi)fenoxietilo.

Los ejemplos de fenilcarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) hidroxilo, (5) carboxilo, (6) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) hidroxialquilo C1-C6, (8) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) cianoalquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (14) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (15) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (16) alquil(C1-C6)sulfonylo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (17) alquil(C1-C6)amino, (18) dialquil(C2-C8)amino, (19) cicloalquil(C3-C6)amino, (20) alquil(C2-C6)carbonilo, (21) alcoxi(C2-C6)carbonilo, (22) alquil(C2-C6)aminocarbonilo, (23) dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, (24) cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo y (25) trialquil(C3-C6)sililo incluyen benzoilo, 2-fluorobenzoilo, 3-fluorobenzoilo, 4-fluorobenzoilo, 2-clorobenzoilo, 3-clorobenzoilo, 4-clorobenzoilo, 2-bromobenzoilo, 2-yodobenzoilo, 2,6-difluorobenzoilo, 2,6-diclorobenzoilo, 2-cloro-6-fluorobenzoilo, 2-cloro-4-fluorobenzoilo, 2-cianobenzoilo, 3-cianobenzoilo, 4-cianobenzoilo, 2-nitrobenzoilo, 3-nitrobenzoilo, 4-nitrobenzoilo, 2-metilbenzoilo, 3-metilbenzoilo, 4-metilbenzoilo, 2-etilbenzoilo, 2-isopropilbenzoilo, 2-terc-butilbenzoilo, 2-(trifluorometil)benzoilo, 3-(trifluorometil)benzoilo, 4-(trifluorometil)benzoilo, 2-metoxibenzoilo, 3-metoxibenzoilo, 4-metoxibenzoilo, 2-etoxibenzoilo, 2-(trifluorometoxi)benzoilo, 2-(metiltio)benzoilo, 2-(metilsulfinil)benzoilo y 2-(metilsulfonylo)benzoilo.

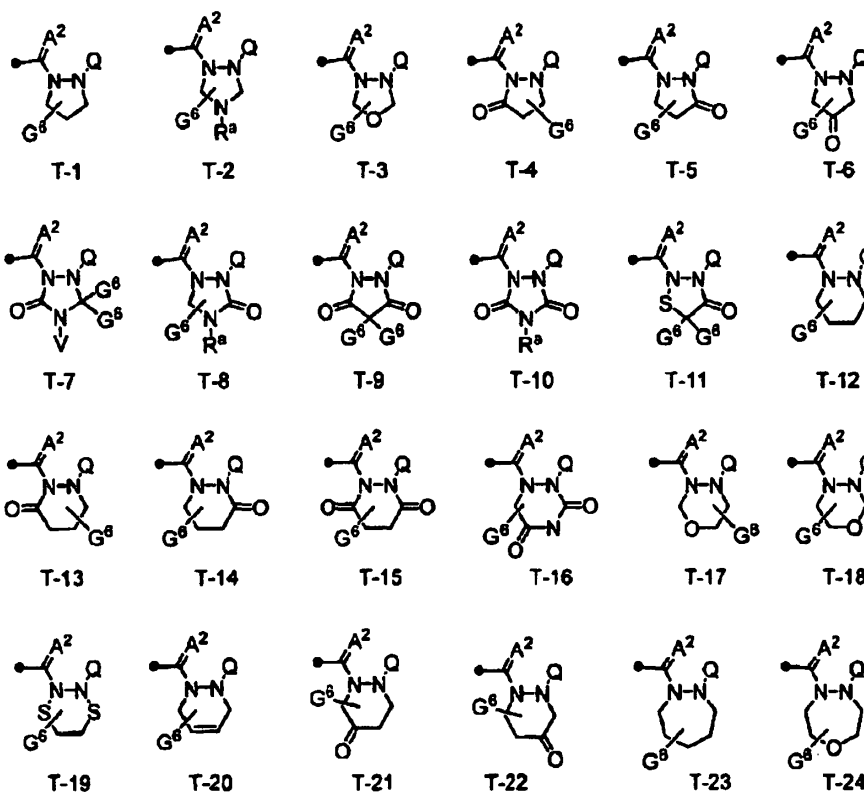
Los ejemplos de naftilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno incluyen 1-naftilo y 2-naftilo.

Los ejemplos del anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) hidroxilo, (5) carboxilo, (6) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) hidroxialquilo C1-C6, (8) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) cianoalquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (14) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (15) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (16) alquil(C1-C6)sulfonylo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (17) alquil(C1-C6)amino, (18) dialquil(C2-C8)amino, (19) cicloalquil(C3-C6)amino, (20) alquil(C2-C6)carbonilo, (21) alcoxi(C2-C6)carbonilo, (22) alquil(C2-C6)aminocarbonilo, (23) dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, (24) cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo y (25) trialquil(C3-C6)sililo incluyen 2-piridinilo, 3-fluoro-2-piridinilo, 3-cloro-2-piridinilo, 3-bromo-2-piridinilo, 3-yodo-2-piridinilo, 3-metil-2-piridinilo, 3-trifluorometil-2-piridinilo, 3-metoxi-2-piridinilo, 3-ciano-2-piridinilo, 3-nitro-2-piridinilo, 3-piridinilo, 2-cloro-3-piridinilo, 4-cloro-3-piridinilo, 4-piridinilo, 3-cloro-4-piridinilo, 3,5-dicloro-4-piridinilo, 2-pirimidinilo, 4-metil-2-pirimidinilo, 4,6-dimetil-2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-cloro-4-pirimidinilo, pirazinilo, 3-metil-2-pirazinilo, 2-tiazolilo, 1-metil-5-pirazolilo, 4-cloro-1-metil-5-pirazolilo, 4-cloro-1,3-dimetil-5-pirazolilo y 4-cloro-5-metil-3-isoxazolilo.

Los ejemplos de un anillo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno incluyen pirrolidin-1-ilo, piperidino, 3,5-dimetilpiperidino, hexametilimin-1-ilo, heptametilimin-1-ilo, morfolino, 2,6-dimetilmorfolino, tiomorfolin-4-ilo, 4-metilpiperazin-1-ilo, 4-(etoxicarbonil)piperazin-1-ilo y 4-fenilpiperazin-1-ilo.

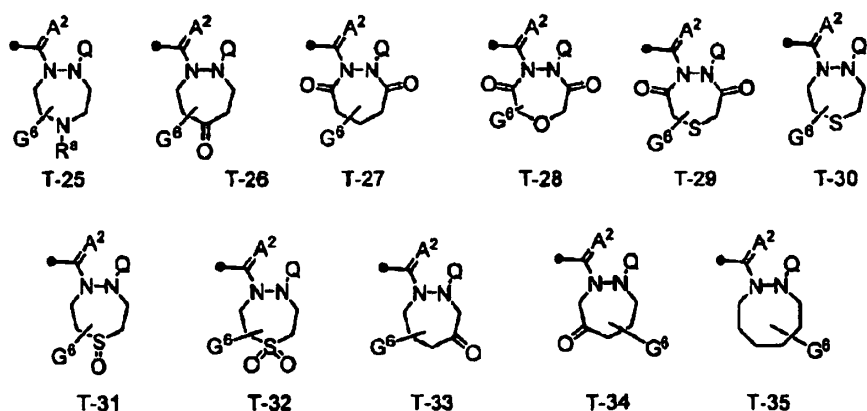
Los ejemplos de piridinilalquilo C7-C9 cuyo anillo de piridina está sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno incluyen 2-piridinilmetilo, 3-piridinilmetilo, 4-piridinilmetilo, 3-cloro-2-piridinilmetilo y 2-cloro-3-piridinilmetilo.

Los ejemplos de R² y R³ se toman junto con los dos átomos de nitrógeno a los que están unidos para formar un anillo de 5 a 8 miembros que contiene dos átomos de nitrógeno, uno o más CH₂ o C(=O), y opcionalmente uno o dos miembros anulares seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de oxígeno, (2) un átomo de azufre, (3) S(=O), (4) S(=O)₂ y (4) NR^a se muestran más abajo como un anillo T. Dicho anillo en los átomos de carbono está sustituido con uno o más G^b independientes, que representan un átomo de halógeno, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, y alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno. Los miembros anulares adicionales del nitrógeno -NR^a (sin incluir los dos átomos de nitrógeno conectores contiguos) con valencias libres pueden estar sustituidos con R^a que se seleccionan del grupo que consiste en alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, o un fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, ciano, nitro, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno.



35

40



5 Dichos sistemas anulares T están conectados con el nitrógeno superior izquierdo de los dos átomos de nitrógeno conectores contiguos a través de un radical $-(C=A^2)-$ al sistema anular E, que representa, un sistema anular heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema anular heterobíciclico fusionado de 8, 9 o 10 miembros.

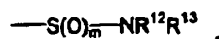
El sustituyente Q representa Q1, Q2, Q3, Q4, Q5 o Q6:

10

- Q1: $-C(=A^{31})-R^6$
- Q2: $-C(=A^{32})-OR^7$
- Q3: $-C(=A^{33})-SR^8$
- Q4: $-C(=A^{34})-NR^9R^{10}$
- Q5:

15

Q6:

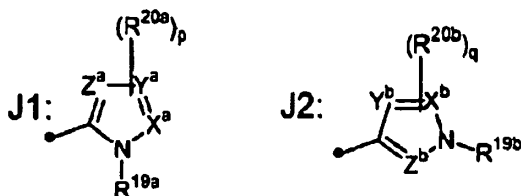


20 A^{31} , A^{32} , A^{33} y A^{34} representan un átomo de oxígeno, o un átomo de azufre; m representa un número entero de 0 a 2. Los sustituyentes R^6 a R^{13} se seleccionan como se ha explicado antes en el compendio de la invención.

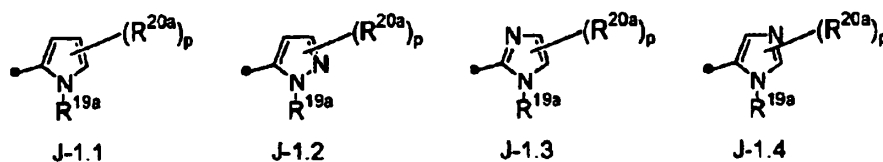
J representa J1 o J2. Los ejemplos para dichos anillos J1 y J2 se muestran más abajo como J-1.1 a J-1.8 y J-2.1 a J-2.8. Los sistemas anulares J-1.1 a J-1.8 y J-2.1 a J-2.8 están conectados a su átomo de carbono más izquierdo a través del grupo $-(C=A^1)-$ del radical $-NR^1(C=A^1)J$ con el sistema anular E, que representa, un sistema anular heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema anular heterobíciclico fusionado de 8, 9 o 10 miembros. Un átomo de nitrógeno está sustituido con R^{19a} (J1) o R^{19b} (J2). Los átomos de carbono anulares están opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes R^{20a} (J1) o R^{20b} (J2) siempre que, cuando estén presentes 2 o 3 sustituyentes R^{20a} (J1) o R^{20b} (J2), dos o más R^{20a} y R^{20b} pueden ser iguales o diferentes. Los sustituyentes R^{19a} (J1), R^{19b} (J2), R^{20a} (J1) y R^{20b} (J2) se seleccionan como se ha explicado anteriormente en el compendio de la invención.

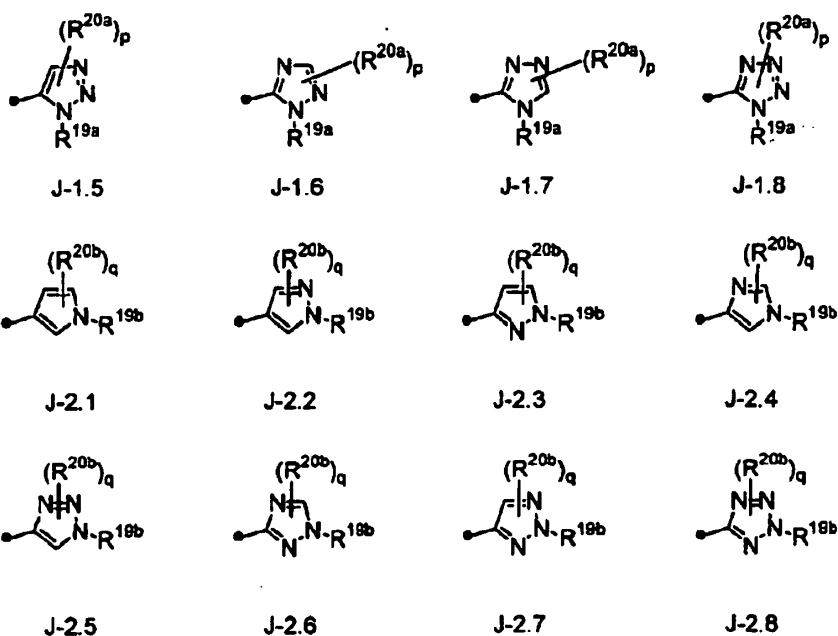
30

Los sistemas anulares preferidos incluyen J-1.1, J-1.2, J-2.1 y J-2.2; muy preferidos J-1.1 y J-1.2.



35





5

Los ejemplos detallados del grupo representado por J1 incluyen 1-fenilpirazol-5-ilo, 1-(2-clorofenil)pirazol-5-ilo, 1-(2-piridinil)pirazol-5-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, a 3-fluoro-1-fenilpirazol-5-ilo, 1-(2-clorofenil)-3-fluoropirazol-5-ilo, 3-fluoro-1-(2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-fluoro-1-(3-cloro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-cloro-1-fenilpirazol-5-ilo, 3-cloro-1-(2-clorofenil)pirazol-5-ilo, 3-cloro-1-(2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-bromo-1-fenilpirazol-5-ilo, 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-bromo-1-(2-clorofenil)pirazol-5-ilo, 3-bromo-1-(2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-yodo-1-fenilpirazol-5-ilo, 3-yodo-1-(2-clorofenil)pirazol-5-ilo, 3-yodo-1-(2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-yodo-1-(3-cloro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-metil-1-fenilpirazol-5-ilo, 1-(2-clorofenil)-3-metilpirazol-5-ilo, 3-metil-1-(2-piridinil)pirazol-5-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metilpirazol-5-ilo, 1-fenil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, 1-(2-clorofenil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, 1-(2-piridinil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, 3-cloro-1-metilpirazol-5-ilo, 3-cloro-1-etilpirazol-5-ilo, 3-cloro-1-isopropilpirazol-5-ilo, 1-terc-butil-3-cloropirazol-5-ilo, 3-cloro-1-(3-fluoro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 1-(3-bromo-2-piridinil)-3-cloropirazol-5-ilo, 3-cloro-1-(3-yodo-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-cloro-1-(3-metil-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-cloro-1-(3-trifluorometil-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-cloro-1-(3-metoxi-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-cloro-1-(3-ciano-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-cloro-1-(3-nitro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-bromo-1-metilpirazol-5-ilo, 3-bromo-1-etilpirazol-5-ilo, 3-bromo-1-isopropilpirazol-5-ilo, 3-bromo-1-terc-butilpirazol-5-ilo, 3-bromo-1-(3-fluoro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-bromo-1-(3-bromo-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-bromo-1-13-yodo-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-bromo-1-(3-metil-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-bromo-1-(3-trifluorometil-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-bromo-1-(3-metoxi-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-bromo-1-(3-ciano-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 3-bromo-1-(3-nitro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, 1-etil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, 1-isopropil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, 1-terc-butil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, 1-(3-fluoro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, 1-(3-bromo-2-piridinil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, 1-(3-yodo-2-piridinil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, 1-(3-metil-2-piridinil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, 1-(3-trifluorometil-2-piridinil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, 1-(3-metoxi-2-piridinil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, 1-(3-ciano-2-piridinil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, 1-(3-nitro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-etilpirazol-5-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-isopropilpirazol-5-ilo, 3-terc-butil-1-(3-cloro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(metiltio)pirazol-5-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(etiltio)pirazol-5-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(isopropiltio)pirazol-5-ilo, 3-terc-butiltio-1-(3-cloro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(metilsulfonil)pirazol-5-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(etilsulfonil)pirazol-5-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(isopropilsulfonil)pirazol-5-ilo, 3-terc-butilsulfonil-1-(3-cloro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(metilsulfonil)pirazol-5-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(etilsulfonil)pirazol-5-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(isopropilsulfonil)pirazol-5-ilo, 3-terc-butilsulfonil-1-(3-cloro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(2,2,2-trifluoroetoxi)pirazol-5-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-cianopirazol-5-ilo, 1-(2-clorofenil)pirrol-2-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)pirrol-2-ilo, 4-cloro-1-(2-clorofenil)pirrol-2-ilo, 4-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)pirrol-2-ilo, 5-cloro-1-(2-clorofenil)pirrol-2-ilo, 5-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)pirrol-2-ilo, 1-(2-clorofenil)-4,5-dicloropirrol-2-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-4,5-dicloropirrol-2-ilo, 4-bromo-1-(2-clorofenil)pirrol-2-ilo, 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)pirrol-2-ilo, 5-bromo-1-(2-clorofenil)pirrol-2-ilo, 5-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)pirrol-2-ilo, 1-(2-clorofenil)-4,5-dibromopirrol-2-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-4,5-dibromopirrol-2-ilo, 1-(2-clorofenil)-4-yodopirrol-2-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-4-yodopirrol-2-ilo, 1-(2-clorofenil)-5-yodopirrol-2-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-5-yodopirrol-2-ilo, 1-(2-clorofenil)-4,5-diyodopirrol-2-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-4,5-diyodopirrol-2-ilo, 1-(2-clorofenil)-4-(trifluorometil)pirrol-2-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-4-(trifluorometil)pirrol-2-ilo, 1-(2-clorofenil)-5-(trifluorometil)pirrol-2-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-5-(trifluorometil)pirrol-2-ilo, 1-(2-clorofenil)imidazol-2-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)imidazol-2-ilo, 4-cloro-1-(2-clorofenil)imidazol-2-ilo, 4-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)imidazol-2-ilo, 4-bromo-1-(2-clorofenil)imidazol-2-ilo, 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)imidazol-2-ilo, 1-(2-

clorofenil)-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo. 1-(2-clorofenil)-1,2,4-triazol-5-ilo, 1-(3-cloro-2-piridinil)-1,2,4-triazol-5-ilo, 3-cloro-1-(2-clorofenil)-1,2,4-triazol-5-ilo, 3-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1,2,4-triazol-5-ilo, 3-bromo-1-(2-clorofenil)-1,2,4-triazol-5-ilo. 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1,2,4-triazol-5-ilo, 1-(2-clorofenil)-3-(trifluorometil)-1,2,4-triazol-5-ilo y 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)-1,2,4-triazol-5-ilo.

Los ejemplos del grupo representado por J2 incluyen 1-metil-3-fenilpirazol-4-ilo, 3-(2-clorofenil)-1-metilpirazol-4-ilo, 1-metil-3-(2-piridinil)pirazol-4-ilo, 3-(13-cloro-2-piridinil)-1-metilpirazol-4-ilo, 1-metil-5-fenilpirazol-4-ilo, 5-(2-clorofenil)-1-metilpirazol-4-ilo, 1-metil-5-(2-piridinil)pirazol-4-ilo, 5-(3-cloro-2-piridinil)-1-metilpirazol-4-ilo, 3-fenil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo, 3-(2-clorofenil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo, 3-(2-piridinil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo, 3-(3-cloro-2-piridinil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo, 5-fenil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo, 5-(2-clorofenil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo, 5-(2-piridinil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo, 5-(3-cloro-2-piridinil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo, 1-(difluorometil)-3-fenilpirazol-4-ilo, 3-(2-clorofenil)-1-(difluorometil)pirazol-4-ilo, 1-(difluorometil)-3-(2-piridinil)pirazol-4-ilo, 3-(3-cloro-2-piridinil)-1-(difluorometil)pirazol-4-ilo, 1-(difluorometil)-5-fenilpirazol-4-ilo, 5-(2-clorofenil)-1-(difluorometil)pirazol-4-ilo, 1-(difluorometil)-5-(2-piridinil)pirazol-4-ilo, 5-(3-cloro-2-piridinil)-1-(difluorometil)pirazol-4-ilo, 3-(2-clorofenil)-1-etilpirazol-4-ilo, 3-(3-cloro-2-piridinil)-1-etilpirazol-4-ilo, 5-(2-clorofenil)-1-etilpirazol-4-ilo, 5-(3-cloro-2-piridinil)-1-etilpirazol-4-ilo, 3-(2-clorofenil)-1-isopropilpirazol-4-ilo, 3-(3-cloro-2-piridinil)-1-isopropilpirazol-4-ilo, 5-(2-clorofenil)-1-isopropilpirazol-4-ilo, 5-(3-cloro-2-piridinil)-1-isopropilpirazol-4-ilo, 3-(2-clorofenil)-1-terc-butilpirazol-4-ilo, 3-(3-cloro-2-piridinil)-1-terc-butilpirazol-4-ilo, 5-(2-clorofenil)-1-terc-butilpirazol-4-ilo y 5-(3-cloro-2-piridinil)-1-terc-butilpirazol-4-ilo.

Más adelante, se ilustran las realizaciones preferidas de la presente invención.

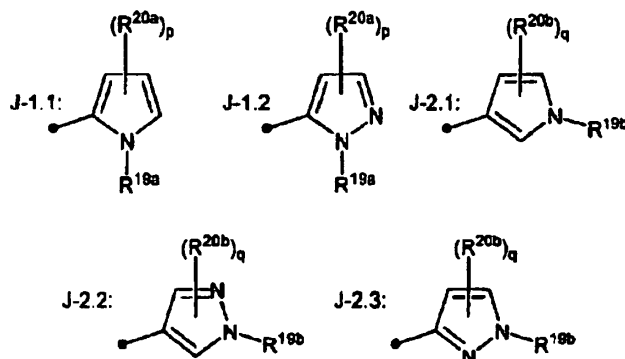
Los compuestos preferidos son:

Compuesto Preferido 1: El compuesto de acuerdo con el presente compuesto, un N-óxido del mismo o una sal adecuada del mismo, donde E es anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros.

Compuesto Preferido 2: El compuesto de acuerdo con el Compuesto Preferido 1, donde A¹ y A² son átomos de oxígeno,

R¹ es un átomo de hidrógeno o alquilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno.

Compuesto Preferido 3: El compuesto de acuerdo con el Compuesto Preferido 2, donde J es J-1.1, J-1.2, J-2.1, J-2.2 o J-2.3:



donde R^{19a} y R^{19b} representan un átomo de hidrógeno; C1-C6 alquilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; R^{20a} y R^{20b} representan un átomo de halógeno, ciano, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cianoalquilo(C2-C6)oxi, alcoxi(C2-C6)alquilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquenoil(C2-C6)oxi sustituido

opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, o

5 fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

10 heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

15 p representa un número entero de 0 a 3, y q representa un número entero de 0 a 3 (siempre que, cuando p es un número entero de 2 o 3, dos o más R^{20a} pueden ser iguales o diferentes y, cuando q es un número entero de 2 o 3, dos o más R^{20b} pueden ser iguales o diferentes).

Compuesto Preferido 4: El compuesto de acuerdo con el presente compuesto, un N-óxido del mismo o una sal adecuada del mismo, donde Q es Q1, A^{31} es oxígeno y

20 R^6 representa un átomo de hidrógeno; alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (3) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (4) alquil(C1-C6)sulfino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, y (7) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

25 cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

30 fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

35 heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

40 heterocíclico aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno

45 o fenilalquilo C7-C9 o fenoxialquilo C7-C9: cada uno de dichos anillos de fenilo sustituidos opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno.

50 Compuesto Preferido 5: El compuesto de acuerdo con el Compuesto Preferido 4, donde A^1 y A^2 son átomos de oxígeno.

Compuesto Preferido 6: El compuesto de acuerdo con el presente compuesto, un N-óxido del mismo o una sal adecuada del mismo, donde Q es Q2, A^{32} es oxígeno y R^7 es C1-C6 alquilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

55 fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

60 heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno o fenilalquilo C7-C9 cuyo radical anular está sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno.

Compuesto Preferido 7: El compuesto de acuerdo con el Compuesto Preferido 6, donde A^1 y A^2 son átomos de oxígeno.

Compuesto Preferido 8: El compuesto de acuerdo con el presente compuesto, un N-óxido del mismo o una sal adecuada del mismo, donde Q es Q_4 , A^{34} es oxígeno y

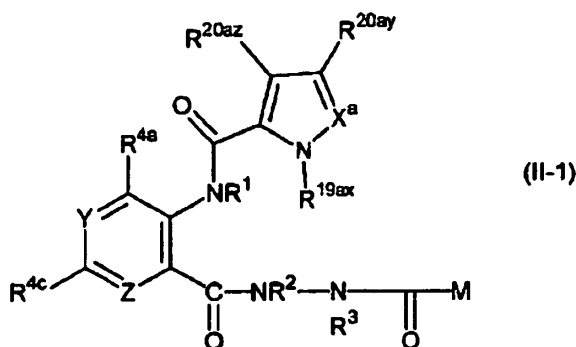
R^9 y R^{10} representan independientemente un átomo de hidrógeno; alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

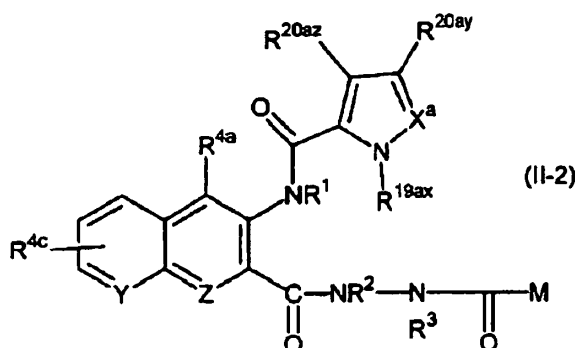
heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno o fenilalquilo C7-C9 cuyo radical anular está sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno.

Compuesto Preferido 9: El compuesto de acuerdo con el Compuesto Preferido 8, donde A^1 y A^2 son átomos de oxígeno.

Compuesto Preferido 10: Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (II-1) o (II-2),



40



donde

X^a representa un átomo de nitrógeno o CR^{20ax} ,

Y y Z representan independientemente un átomo de nitrógeno o CR^{4b} , pero ni Y ni Z son CR^{4b} al mismo tiempo,

R^1 representa un átomo de hidrógeno o alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, R^2 y R^3 representan independientemente un átomo de hidrógeno, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cianoalquilo C2-C6, hidroxialquilo C1-C6, alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquenilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquinilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxi(C2-C6)carbonilo, alquil(C2-C6)aminocarbonilo, dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo, o trialquil(C3-C6)sililo,

o representa fenilo, fenilalquilo C7-C9 o fenilcarbonilo: cada uno de dichos anillos de fenilo sustituidos opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) hidroxilo, (5) carboxilo, (6) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) hidroxialquilo C1-C6, (8) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) cianoalquilo C2-C6, (10) alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquenilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alquinilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (14) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (15) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (16) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (17) alquil(C1-C6)amino, (18) dialquil(C2-C8)amino, (19) cicloalquil(C3-C6)amino, (20) alquil(C2-C6)carbonilo, (21) alcoxi(C2-C6)carbonilo, (22) alquil(C2-C6)aminocarbonilo, (23) C3-CB dialquilaminocarbonilo, (24) cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo y (25) trialquil(C3-C6)sililo o

R^2 y R^3 se toman junto con los dos átomos de nitrógeno a los que están unidos para formar un anillo de 5 a 8 miembros que contiene dos átomos de nitrógeno, uno o más CH_2 o $C(=O)$, y opcionalmente uno o dos miembros anulares seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de oxígeno, (2) un átomo de azufre, (3) $S(=O)$, (4) $S(=O)_2$ y (4) NR^a (donde R^a representa alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, o un fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes de (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

y donde el anillo en los átomos de carbono está sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, y (3) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

R^{4a} , R^{4b} y R^{4c} representan independientemente un átomo de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, carboxilo, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, C2-C6 alcoxi sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cianoalquilo C2-C6, alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquenilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquinilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o

más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)amino, dialquil(C2-C8)amino, cicloalquil(C3-C6)amino, alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxi(C2-C6)carbonilo, alquil(C2-C6)aminocarbonilo, dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, trialquil(C3-C6)sililo;

o representa independientemente fenilo, bencilo, fenoxi, o anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) hidroxilo, (5) carboxilo, (6) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) hidroxialquilo C1-C6, (8) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) cianoalquilo C2-C6, (10) alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquenilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alquinilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (14) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (15) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (16) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (17) alquil(C1-C6)amino, (18) dialquil(C2-C8)amino, (19) cicloalquil(C3-C6)amino, (20) alquil(C2-C6)carbonilo, (21) alcoxi(C2-C6)carbonilo, (22) alquil(C2-C6)aminocarbonilo, (23) dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, (24) cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo y (25) trialquil(C3-C6)sililo;

M es un átomo de hidrógeno; alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (3) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (4) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, y (7) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquil(C1-C6)amino; dialquil(C2-C8)amino;

fenilo, fenilalquilo C7-C9 o fenoxialquilo C7-C9: cada uno de dichos anillos de fenilo sustituidos opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

o un anillo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

R^{19ax} representa un átomo de hidrógeno; alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cianoalquilo C2-C6 ; alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquenilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquinilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino, sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

fenilalquilo C7-C9 cuyo anillo de fenilo está sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

o piridinilalquilo C7-C9 cuyo anillo de piridina está sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

R^{20ax} , R^{20ay} y R^{20a} : representan un átomo de halógeno; ciano; nitro; tiocianato; alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cianoalquilo(C2-C6)oxi; alcoxi(C2-C6)alquiloxi sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alqueni(C2-C6)oxi sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

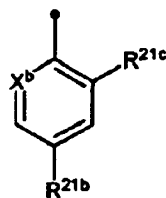
heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; o fenoxi sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno.

Compuesto Preferido 11: El compuesto de acuerdo con el Compuesto Preferido 10, donde R^1 es un átomo de hidrógeno,

R^2 es un átomo de hidrógeno o alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, R^3 es un átomo de hidrógeno, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno o alcoxi(C2-C6)carbonilo,

R^{4a} es un átomo de halógeno o alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, R^{4c} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, ciano o alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno,

R^{19a} es



donde X^b es un átomo de nitrógeno o CR^{21a} , R^{20ax} y R^{20ay} son independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno o alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno,

R^{20as} es un átomo de hidrógeno, R^{21a} , R^{21b} y R^{21c} se seleccionan independientemente del grupo que consiste en un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno.

Compuesto Preferido 12: El compuesto de acuerdo con el Compuesto Preferido 11, donde X^a y X^b son átomos de nitrógeno, Y es CH y

Z es un átomo de nitrógeno.

Compuesto Preferido 13: El compuesto de acuerdo con el Compuesto Preferido 11, donde X^a y X^b son átomos de nitrógeno,

Y es un átomo de nitrógeno

5 Z es CH y.

Compuesto Preferido 14: El compuesto de acuerdo con el Compuesto Preferido 11, donde R^{4b} es un átomo de hidrógeno.

Compuesto Preferido 15: El compuesto de acuerdo con el Compuesto Preferido 14, donde M es un átomo de hidrógeno, alquilo C1-C6, alcoxi C1-C6, amino, alquil(C1-C6)amino o dialquil(C2-C8)amino.

10 Compuesto Preferido 16: El compuesto de acuerdo con el Compuesto Preferido 15, donde

R^2 es un átomo de hidrógeno, metilo o etilo,

R^3 es un átomo de hidrógeno, metilo, etilo o metoxicarbonilo,

R^{4a} es metilo, cloro, bromo o yodo,

R^{4c} es hidrógeno, fluoro, cloro, bromo, yodo o ciano,

15 R^{20ay} es cloro, bromo, yodo, trifluorometilo o pentafluoroetoxi,

R^{22b} es un átomo de hidrógeno,

R^{22c} es cloro o bromo,

M es hidrógeno, metoxi, etoxi, metilamino o dimetilamino.

Compuesto Preferido 17: El compuesto del Compuesto Preferido 16, donde R^2 es un átomo de hidrógeno,

20 R^3 es metilo o etilo y

M es un átomo de hidrógeno.

Compuesto Preferido 18: El compuesto del Compuesto Preferido 17, donde R^2 y R^3 son independientemente hidrógeno, metilo o etilo y

M es metoxi o etoxi.

25 Compuesto Preferido 19: Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (II-1),

x^a , Y, Z, R^1 , R^2 , R^3 , R^{4a} , R^{4c} , M, R^{19ax} , R^{20ax} , R^{20ay} , y R^{20az} se han descrito anteriormente.

Compuesto Preferido 20: El compuesto de acuerdo con el Compuesto Preferido 19, donde R^1 es un átomo de hidrógeno,

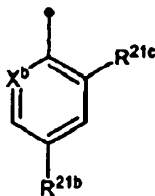
R^2 es un átomo de hidrógeno o alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno,

30 R^3 es un átomo de hidrógeno, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno o alcoxi(C2-C6)carbonilo,

R^{4a} es un átomo de halógeno o alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno,

R^{4c} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, ciano o alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno,

35 R^{19a} es



donde X^b es un átomo de nitrógeno o CR^{21a} ,

R^{20ax} y R^{20ay} son independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos

40 de halógeno o alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno,

R^{20az} es un átomo de hidrógeno,

R^{21a} , R^{21b} y R^{21c} se seleccionan independientemente del grupo que consiste en un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o C1-C6 alquilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno.

Compuesto Preferido 21: El compuesto de acuerdo con el Compuesto Preferido 20, donde X^a y X^b son átomos de nitrógeno,

45 Y es CH y

Z es un átomo de nitrógeno.

Compuesto Preferido 22: El compuesto de acuerdo con el Compuesto Preferido 20, donde X^a y X^b son átomos de nitrógeno,

50 Y es un átomo de nitrógeno

Z es CH y.

Compuesto Preferido 23: El compuesto de acuerdo con el Compuesto Preferido 20, donde R^{4b} es un átomo de hidrógeno.

Compuesto Preferido 24: El compuesto de acuerdo con el Compuesto Preferido 23, donde M es un átomo de hidrógeno, alquilo C1-C6, alcoxi C1-C6, amino, alquil(C1-C6)amino o dialquil(C2-C8)amino.

55 Compuesto Preferido 25: El compuesto de acuerdo con el Compuesto Preferido 24, donde

R^2 es un átomo de hidrógeno, metilo o etilo,

R^3 es un átomo de hidrógeno, metilo, etilo o metoxicarbonilo,

R^{4a} es metilo, cloro, bromo o yodo,
 R^{4c} es hidrógeno, fluoro, cloro, bromo, yodo o ciano,
 R^{20ay} es cloro, bromo, yodo, trifluorometilo o pentafluoroetoxi,
 R^{22b} es un átomo de hidrógeno,
 R^{22c} es cloro o bromo,

5 M es hidrógeno, metoxi, etoxi, metilamino o dimetilamino.
 Compuesto Preferido 26: El compuesto del Compuesto Preferido 25, donde R² es un átomo de hidrógeno,
 R³ es metilo o etilo y
 M es un átomo de hidrógeno.
 10 Compuesto Preferido 27: El compuesto del Compuesto Preferido 26, donde R² y R³ son independientemente
 hidrógeno, metilo o etilo y
 M es metoxi o etoxi.

Esta invención tiene que ver adicionalmente con:

15 Un plaguicida que comprende el presente compuesto o, un N-oxido del mismo o una sal adecuada del mismo como
 ingrediente activo.

20 Un método para controlar una plaga que comprende aplicar el presente compuesto, un N-oxido del mismo o una sal
 adecuada del mismo directamente a una plaga, o al lugar en el que habita la plaga.

El uso del presente compuesto, un N-oxido del mismo o una sal adecuada del mismo para controlar una plaga.

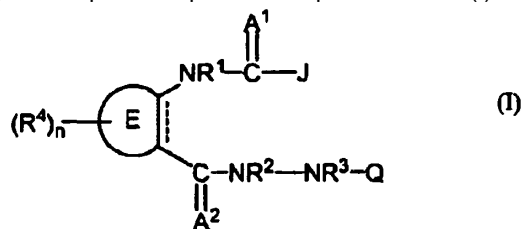
25 El uso del presente compuesto, un N-oxido del mismo o una sal adecuada del mismo para la fabricación de una
 preparación plaguicida.

Más adelante, se explicará un procedimiento para producir el presente compuesto.

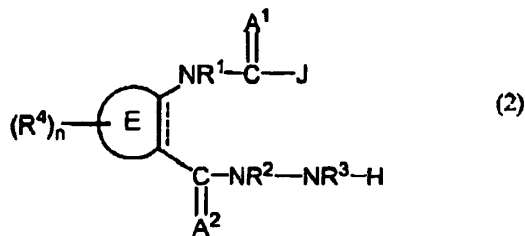
30 El presente compuesto se puede producir, por ejemplo, mediante el siguiente Procedimiento A-1 a Procedimiento C-
 1.

Procedimiento A-1

Entre los presentes compuestos, un compuesto representado por la fórmula (I):



35 donde R¹, R², R³, R⁴, A¹, A², J y n se definen como antes, E representa, junto con los dos átomos de carbono
 40 conectores contiguos, un sistema anular heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema anular heterobifurcado
 fusionado de 8, 9 o 10 miembros, Q' representa a grupo seleccionado del grupo que consiste en Q1 a Q6 (siempre
 que se excluya el compuesto donde Q' es Q4, y R⁸ y R⁹ son un átomo de hidrógeno) (más adelante, referido como el
 compuesto (I)) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (2):



45 donde R¹, R², R³, R⁴, A¹, A², J y n se definen como antes (más adelante, referido como el compuesto (2)), y un
 compuesto representado por la fórmula (3):



donde Q' se define como antes, y L¹ representa un átomo de halógeno o a Q'-O- (siempre que se excluya el caso en el que Q' es Q4, y R⁸ y R⁹ son un átomo de hidrógeno) (más adelante, referido como el compuesto (3)).

La reacción se realiza en presencia o ausencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, éter metil terc-butílico, y similares, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, y similares, hidrocarburos tales como tolueno, benceno, xileno, y similares, nitrilos tales como acetonitrilo y similares, disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido, y similares, y una mezcla de los mismos.

La cantidad del compuesto (3) que se va a utilizar en la reacción es usualmente de 1 a 2 moles por 1 mol del compuesto (2).

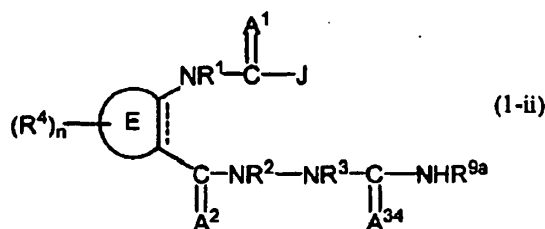
La reacción se realiza en presencia de una base, si fuera necesario. Los ejemplos de la base incluyen compuestos heterocíclicos que contienen nitrógeno tales como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]7-undeceno (DBU), 1,5-diazabicyclo[4,3,0]-5-noneno (DBN), y similares, aminas terciarias tales como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina, y similares, y bases inorgánicas tales como carbonato de potasio, hidruro de sodio, y similares. La cantidad de la base cuando la reacción se realiza en presencia de la base es usualmente de 1 a 2 moles por 1 mol del compuesto (2), mientras que la base se puede utilizar en una cantidad en exceso en caso de que la base utilizada sea líquida en las condiciones de reacción tal como piridina, y similares.

La temperatura de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0 a 100°C, y el tiempo de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0,1 a 24 horas.

Una vez completada la reacción, el compuesto (1-i) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El compuesto aislado(1-i) se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, cromatografía, o similares.

Procedimiento A-2

Entre los presentes compuestos, un compuesto representado por la fórmula (1-ii):



donde R¹, R², R³, R⁴, A¹, A², A³⁴, J y n se definen como antes, y R^{9a} representa alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno; alcoxilquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno; alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno; alquino C3-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno; cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno y (2) alquilo C1-C6 grupo; un fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno (2) un grupo ciano, (3) un grupo nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, (9) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno y (10) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno; heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) un grupo ciano, (3) un grupo nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno; o fenilalquilo C7-C9 cuyo radical anular benceno puede estar sustituido con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) un grupo ciano, (3) un grupo nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno (más adelante, referido como el compuesto (1-ii)) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto (2) con un compuesto representado por la fórmula (4):



donde A³⁴ y R^{9a} se definen como antes (más adelante, referido como el compuesto (4)).

5 La reacción se realiza en presencia o ausencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, éter metil terc-butílico, y similares, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, y similares, hidrocarburos tales como tolueno, benceno, xileno, y similares, nitrilos tales como acetonitrilo, y similares, disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido, y similares, y una mezcla de los mismos.

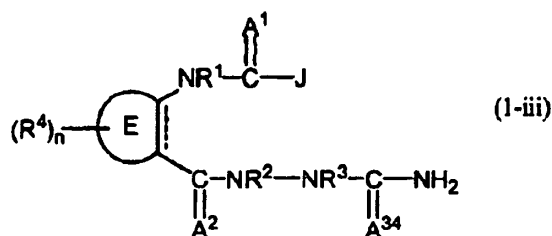
10 La cantidad del compuesto (4) utilizado en la reacción es usualmente de 1 a 2 moles por 1 mol del compuesto (2).

La temperatura de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0 a 100°C, y el tiempo de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0,1 a 24 horas.

15 Una vez completada la reacción, el compuesto (1-ii) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua, y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El compuesto aislado(1-ii) se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, cromatografía, o similares.

Procedimiento A-3

20 Entre los presentes compuestos, un compuesto representado por la fórmula (1-iii):



25 donde R¹, R², R³, R⁴, A¹, A², A³⁴, J y n se definen como antes (más adelante, referido como el compuesto (1-iii)) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto (2) y un cianato o un tiocianato.

30 La reacción se realiza en presencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente utilizado en la reacción incluyen ácidos tales como ácidos orgánicos tales como ácido acético, y similares y ácidos minerales tales como ácido clorhídrico, y similares, así como una mezcla de estos ácidos y agua, cloroformo, o similares.

La cantidad del cianato o del tiocianato utilizados en la reacción es usualmente de 1 a 2 moles por 1 mol del compuesto (2).

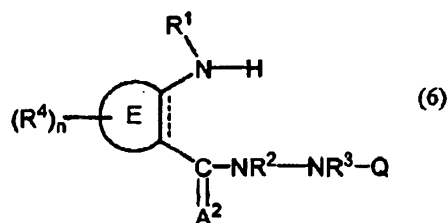
35 La temperatura de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0 a 100°C, y el tiempo de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0,1 a 24 horas.

Los ejemplos del cianato o del tiocianato incluyen cianato de potasio, cianato de sodio, cianato de amonio, tiocianato de potasio, tiocianato de sodio y tiocianato de amonio.

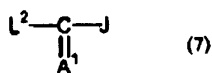
40 Una vez completada la reacción, el compuesto (1-iii) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El Compuesto (1-iii) aislado se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, cromatografía, o similares.

Procedimiento B-1

El presente compuesto se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (6):



donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , A^2 , Q y n se definen como antes (más adelante, referido como Compuesto (6)) y un compuesto representado por la fórmula (7):



5 donde A^1 y J se definen como antes, y L^2 representa un átomo de halógeno (más adelante, referido como el compuesto (7)).

10 La reacción se realiza en presencia o ausencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente utilizado en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, éter metil terc-butílico, y similares, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, y similares, hidrocarburos tales como tolueno, benceno, xileno, y similares, nitrilos tales como acetonitrilo, y similares, disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido, y similares, y una mezcla de los mismos.

15 La cantidad del compuesto (7) utilizado en la reacción es usualmente de 1 a 2 moles por 1 mol del compuesto (6).

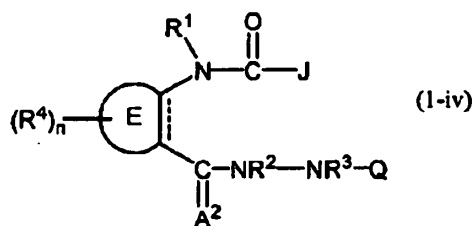
20 La reacción se realiza en presencia de una base, si fuera necesario. Los ejemplos de la base incluyen compuestos heterocíclicos que contienen nitrógeno tales como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo [5,4,0]7-undeceno (DBU), 1,5-diazadicyclo[4,3,0]5-noneno (DBN), y similares, aminas terciarias tales como trietilamina, N,N-diisopropiletamina, y similares, y bases inorgánicas tales como carbonato de potasio, hidruro de sodio, y similares. La cantidad de la base cuando la reacción se realiza en presencia de la base es usualmente de 1 a 2 moles por 1 mol del compuesto (6), mientras que la base se puede utilizar en una cantidad en exceso en caso de que la base utilizada sea líquida en las condiciones de reacción tal como piridina, y similares.

25 La temperatura de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0 a 100°C, y el tiempo de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0,1 a 24 horas.

30 Una vez completada la reacción, el presente compuesto se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua, y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo un precipitado depositado por medio de filtración. El presente compuesto aislado se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, cromatografía, o similares.

Procedimiento B-2

35 Entre los presentes compuestos, un compuesto representado por la fórmula (I-iv):



40 donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , A^2 , J , Q y n se definen como antes (referido más adelante como el compuesto (I-iv)) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto (6) y un compuesto representado por la fórmula (8):



45 donde J se define como antes (más adelante, referido como el compuesto (8)) en presencia de un agente deshidratante.

50 La reacción se realiza en presencia o ausencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, éter metil terc-butílico, y similares, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, y similares, hidrocarburos tales como tolueno, benceno, xileno, y similares, nitrilos tales como acetonitrilo, y similares, disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido, y similares, y una mezcla de los mismos.

La cantidad del compuesto (8) utilizado en la reacción es usualmente de 1 a 2 moles por 1 mol del compuesto (6).

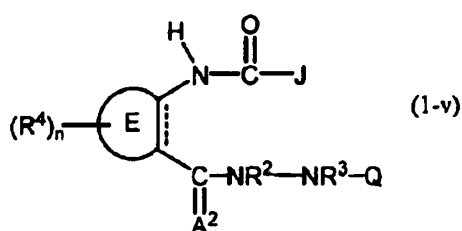
Los ejemplos del agente deshidratante que se va a utilizar en la reacción incluyen carbodiimidias tales como dicitohexilcarbodiimida (DCC), hidrocloreto de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida (WSC), y similares. La cantidad del agente deshidratante que se va a utilizar es usualmente de 1 a 2 moles por 1 mol del compuesto (6).

La temperatura de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0 a 100°C, y el tiempo de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0,1 a 24 horas.

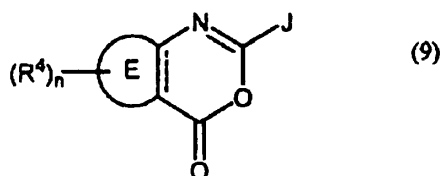
Una vez completada la reacción, el compuesto (1-iv) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua, y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El compuesto aislado(1-iv) se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, cromatografía, o similares.

Procedimiento C-1

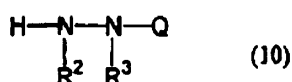
Entre los presentes compuestos, un compuesto representado por la fórmula (1-v):



donde R^2 , R^3 , R^4 , J, Q y n se definen como antes (más adelante, referido como el compuesto (1-v)) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (9) :



donde R^4 , J y n se definen como antes (más adelante, referido como el compuesto (9)) y un compuesto representado por la fórmula (10):



donde R^2 , R^3 y Q se definen como antes (más adelante, referido como el compuesto (10)).

La reacción se realiza en presencia o ausencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente utilizado en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, éter metil terc-butílico, y similares, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, y similares, hidrocarburos tales como tolueno, benceno, xileno, y similares, nitrilos tales como acetonitrilo, y similares, disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido, y similares, y una mezcla de los mismos.

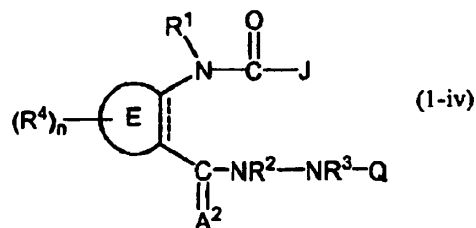
La cantidad del compuesto (10) que se va a utilizar en la reacción es usualmente de 1 a 20 moles por 1 mol del compuesto (9).

La temperatura de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0 a 100°C, y el tiempo de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0,1 a 48 horas.

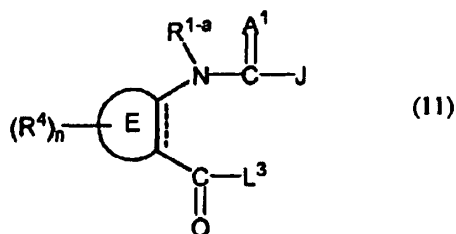
Una vez completada la reacción, el compuesto (1-v) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua, y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El compuesto aislado(1-v) se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, cromatografía, o similares.

Procedimiento C-2

Entre los presentes compuestos, un compuesto representado por la fórmula (1-vi):



- 5 donde R^2 , R^3 , R^4 , A^1 , J , Q y n se definen como antes, R^{1-a} representa alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno; un grupo cianoalquilo C2-C6; alcoxilalquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno; alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno; alquino C3-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno; o fenilalquilo C7-C9 en el que una porción anular del benceno puede estar sustituida con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) un grupo ciano, (3) un grupo nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno (más adelante, referido como el compuesto (1-vi)) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (11):



- 15 donde R^{1-a} , R^4 , A^1 , J y n se definen como antes, y L^3 representa un átomo de halógeno (más adelante, referido como el compuesto (11)) y el compuesto (10).

- 20 La reacción se realiza en presencia o ausencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahydrofurano, éter metil terc-butílico, y similares, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, y similares, hidrocarburos tales como tolueno, benceno, xileno, y similares, nitrilos tales como acetonitrilo, y similares, disolventes polares apróticos tales como N,N-dietilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido, y similares, y una mezcla de los mismos.

- 25 La cantidad del compuesto (10) que se va a utilizar en la reacción es usualmente de 1 a 2 moles por 1 mol del compuesto (11).

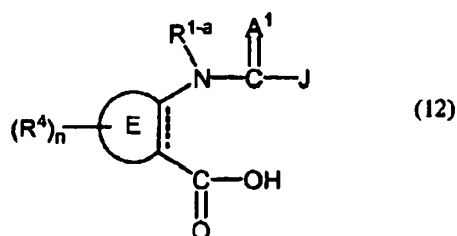
- 30 La reacción se realiza en presencia de una base, si fuera necesario. Los ejemplos de la base incluyen compuestos heterocíclicos que contienen nitrógeno tales como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]7-undeceno (DBU), 1,5-diazabicyclo[4,3,0]5-noneno (DBN), y similares, aminas terciarias tales como trietilamina, N,N-diisopropilamina, y similares, y bases inorgánicas tales como carbonato de potasio, hidruro de sodio, y similares. La cantidad de la base que se va a utilizar cuando la reacción se realiza en presencia de la base es usualmente de 1 a 2 moles por 1 mol del compuesto (11), mientras que la base se puede utilizar en una cantidad en exceso en caso de que la base utilizada sea líquida en las condiciones de reacción tal como piridina y similares.

- 35 La temperatura de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0 a 100°C, y el tiempo de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0,1 a 24 horas.

- 40 Una vez completada la reacción, el compuesto (1-vi) se puede aislar después de verter la mezcla de reacción en agua, y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El compuesto aislado (1-vi) se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, cromatografía o similares.

45 Procedimiento C-3

El compuesto (1-vi) se puede producir también haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (12):



donde R^4 , R^{1-a} , A^1 , J y n se definen como antes (más adelante, referido como Compuesto (12)) y el compuesto (10) en presencia de un agente deshidratante.

5 La reacción se realiza en presencia o ausencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, éter metil terc-butílico, y similares, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, y similares, hidrocarburos tales como tolueno, benceno, xileno, y similares, nitrilos tales como acetonitrilo, y similares, disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido, y similares, y una mezcla de los mismos.

La cantidad del compuesto (10) utilizado en la reacción es usualmente de 1 a 2 moles por 1 mol del compuesto (12).

15 Los ejemplos del agente deshidratante utilizado en la reacción incluyen carbodiimidas tales como dicitclohexilcarbodiimida (DCC), hidrocloreto de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida (WSC), y similares. La cantidad del agente deshidratante que se va a utilizar es usualmente de 1 a 2 moles por 1 mol del compuesto (12).

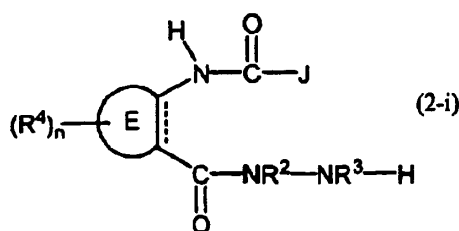
La temperatura de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0 a 100°C, y el tiempo de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0,1 a 24 horas.

Una vez completada la reacción, el compuesto (1-vi) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El compuesto aislado (1-vi) se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, cromatografía, o similares.

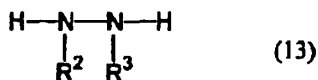
A continuación, se explicará un procedimiento para la producción de los intermedios para producir el presente compuesto.

Procedimiento de Referencia 1

30 Entre los compuestos (2), un compuesto representado por la fórmula (2-i):



35 donde R^2 , R^3 , R^4 , J y n se definen como antes (más adelante, referido como el compuesto (2-i)) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto (9) y un compuesto representado por la fórmula (13):



40 donde R^2 y R^3 se definen como antes (más adelante, referido como el compuesto (13)).

La reacción se realiza en presencia o ausencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente utilizado en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, éter metil terc-butílico, y similares, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno y similares, hidrocarburos tales como tolueno, benceno, xileno y similares, nitrilos tales como acetonitrilo, y similares, disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-

dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido, y similares, alcoholes tales como metanol, etanol, 2-propanol, y similares, y una mezcla de los mismos.

5 La cantidad del compuesto (13) que se va a utilizar en la reacción es usualmente de 1 a 5 moles por 1 mol del compuesto (9).

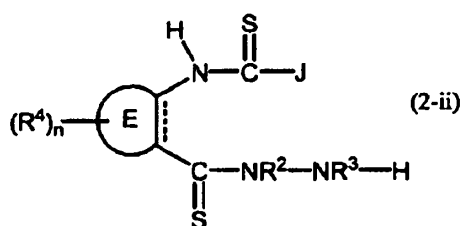
La temperatura de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de -50 a 100°C, y el tiempo de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0,1 a 24 horas.

10 Una vez completada la reacción, el compuesto (2-i) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua, y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El compuesto aislado (2-i) se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, cromatografía, o similares.

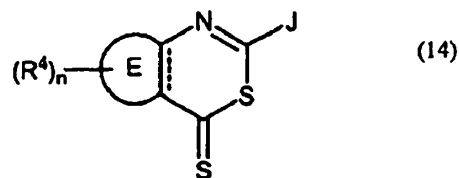
Procedimiento de Referencia 2

15

Entre los compuestos (2), un compuesto representado por la fórmula (2-ii):



20 donde R², R³, R⁴, J y n se definen como antes (más adelante, referido como Compuesto (2-ii)) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (14):



25 donde R⁴, J y n se definen como antes (más adelante, referido como el compuesto (14)) y el compuesto (13).

La reacción se realiza en presencia o ausencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahydrofurano, éter metil terc-butílico, y similares, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno y similares, hidrocarburos tales como tolueno, benceno, xileno, y similares, nitrilos tales como acetonitrilo, y similares, disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido, y similares, alcoholes tales como metanol, etanol, 2-propanol, y similares, y una mezcla de los mismos.

35 La cantidad del compuesto (13) que se va a utilizar en la reacción es usualmente de 1 a 5 moles por 1 mol del compuesto (14).

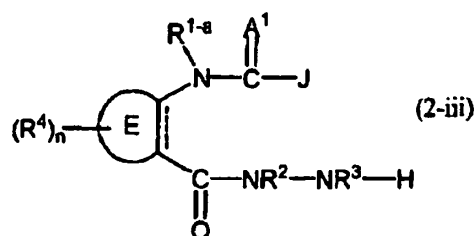
La temperatura de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de -50 a 100°C, y el tiempo de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0,1 a 24 horas.

40

Una vez completada la reacción, el compuesto (2-ii) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua, y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El compuesto aislado(2-ii) se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, cromatografía, o similares.

45 Procedimiento de Referencia 3

Entre los compuestos (2), un compuesto representado por la fórmula (2-iii):



donde R^{1-a} , R^2 , R^3 , R^4 , A^1 , J y n se definen como antes (más adelante, referido como el compuesto (2-iii)) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto (11) y el compuesto (13).

5 La reacción se realiza en presencia o ausencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente utilizado en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, éter metil terc-butílico, y similares, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, y similares, hidrocarburos tales como tolueno, benceno, xileno, y similares, nitrilos tales como acetonitrilo, y similares, disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido, y similares, y una mezcla de los mismos.

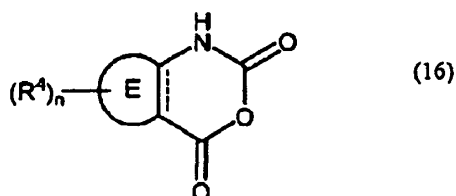
10 La cantidad de Compuesto (13) utilizado en la reacción es usualmente de 2 a 10 moles por 1 mol del compuesto (11).

15 La temperatura de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de -50 a 100°C , y el tiempo de reacción se encuentra en un intervalo de 0,1 a 24 horas.

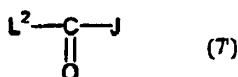
20 Una vez completada la reacción, el compuesto (2-iii) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua, y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El compuesto aislado(2-iii) se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, cromatografía, o similares.

Procedimiento de Referencia 4

25 El compuesto (9) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (16).



30 donde R^4 y n se definen como antes (más adelante, referido como el compuesto (16)) y un compuesto representado por la fórmula (7):



35 donde J y L^2 se definen como antes (más adelante, referido como Compuesto (7')).

40 La reacción se realiza en presencia o ausencia de un disolvente en presencia de una base. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, éter metil terc-butílico, y similares, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, y similares, hidrocarburos tales como tolueno, benceno, xileno, y similares, nitrilos tales como acetonitrilo, y similares, disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido, y similares, y una mezcla de los mismos.

45 La cantidad del compuesto (7') utilizado en la reacción es usualmente de 0,5 a 2 moles por 1 mol del compuesto (16).

Los ejemplos de la base que se va a utilizar en la reacción incluyen compuestos heterocíclicos que contienen nitrógeno tales como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]7-undeceno(DBU), 1,5-diazabicyclo[4,3,0]5-noneno (DBN), y similares, aminas terciarias tales como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina, y similares, y bases

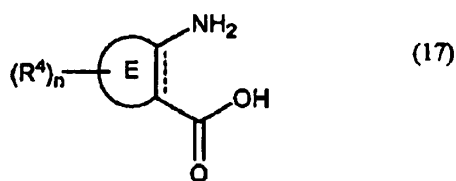
inorgánicas tales como carbonato de potasio, hidruro de sodio, y similares. La cantidad de la base que se va a utilizar es usualmente de 1 a 2 moles por 1 mol del compuesto (16), mientras que la base se puede utilizar en una cantidad en exceso en caso de que la base sea líquida en las condiciones de reacción tal como piridina, y similares.

- 5 La temperatura de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 50 a 150°C, y el tiempo de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 1 a 24 horas.

Una vez completada la reacción, el compuesto (9) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua, y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo los cristales precipitados mediante filtración. El compuesto aislado(9) se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, cromatografía, o similares.

Procedimiento de Referencia 5

15 El compuesto (9) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (17):



donde R^4 y n se definen como antes (más adelante, referido como Compuesto (17)) y el compuesto (7').

- 20 La reacción se realiza en presencia o ausencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, éter metil terc-butílico, y similares, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, y similares, hidrocarburos tales como tolueno, benceno, xileno, y similares, nitrilos tales como acetonitrilo, y similares, disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido, y similares, y una mezcla de los mismos.

El procedimiento comprende la siguiente etapa 5-1 y etapa 5-2.

Etapa 5-1

- 30 Esta etapa se realiza haciendo reaccionar el compuesto (17) y el compuesto (7') en presencia de una base.

35 La cantidad del compuesto (7') que se va a utilizar en esta etapa es usualmente de 1 a 2 moles por 1 mol del compuesto (17). Los ejemplos de la base incluyen compuestos heterocíclicos que contienen nitrógeno tales como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]7-undeceno (DBU), 1,5-diazabicyclo[4,3,0]5-noneno (DBN), y similares, aminas terciarias tales como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina, y similares, y bases inorgánicas tales como carbonato de potasio, hidruro de sodio, y similares. La cantidad de la base que se va a utilizar es usualmente de 1 a 2 moles por 1 mol del compuesto (17).

- 40 La temperatura de reacción de esta etapa se encuentra usualmente en el intervalo de 0 a 50°C, y el tiempo de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0,1 a 24 horas.

Una vez completada esta etapa, usualmente, la mezcla de reacción se utiliza tal cual en la siguiente etapa 5-2.

Etapa 5-2

Esta etapa se realiza haciendo reaccionar la mezcla de reacción en la etapa 5-1 y un haluro de sulfonilo en presencia de una base.

- 50 Los ejemplos del haluro de sulfonilo utilizado en esta etapa incluyen cloruro de metanosulfonilo, cloruro de p-toluenosulfonilo, y trifluorocloruro de metanosulfonilo. La cantidad del haluro de sulfonilo que se va a utilizar en esta etapa es usualmente de 1 a 2 moles por 1 mol del compuesto (17) utilizado en la etapa 5-1.

55 Los ejemplos de la base incluyen las mismas bases que se han descrito con respecto a la etapa 5-1. La cantidad de la base es usualmente de 2 a 4 moles por 1 mol del compuesto (17) utilizado en la etapa 5-1.

La temperatura de reacción de esta etapa se encuentra usualmente en el intervalo de 0 a 50°C, y el tiempo de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0,1 a 24 horas.

Una vez completada esta etapa, el compuesto (9) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua, seguido de extracción convencional con un disolvente orgánico. El compuesto aislado (9) se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, cromatografía, o similares.

5 Procedimiento de Referencia 6

El compuesto (14) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto (9) con un agente de tiocarbonilación.

10 La reacción se realiza en presencia o ausencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, éter metil terc-butílico, diglima, y similares, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, y similares, hidrocarburos tales como tolueno, benceno, xileno, y similares, nitrilos tales como acetonitrilo, y similares, piridinas tales como piridina, picolina, lutidina, y similares, y una mezcla de los mismos.

15 Los ejemplos del agente de tiocarbonilación que se va a utilizar en la reacción incluyen pentasulfuro de difósforo, un reactivo de Lawesson (2,4-disulfuro 2,4-bis-(4-metoxifenil)-1,3-ditia-2,4-difosfetano), y similares.

20 La cantidad del agente de tiocarbonilación que se va a utilizar en la reacción es usualmente de 1 a 3 moles por 1 mol del compuesto (9).

La temperatura de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0°C a 200°C, y el tiempo de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 1 a 24 horas.

25 Una vez completada la reacción, el compuesto (14) se puede aislar recogiendo un precipitado depositado en la mezcla de reacción mediante filtración, o extrayendo la mezcla de reacción con un disolvente orgánico. El compuesto aislado (14) se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, cromatografía, o similares.

30 Procedimiento de Referencia 7

El compuesto (11) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto (12) con un agente halogenante.

35 La reacción se realiza en presencia o ausencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, éter metil terc-butílico, y similares, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, y similares, hidrocarburos tales como tolueno, benceno, xileno, y similares, nitrilos tales como acetonitrilo, y similares, disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido, y similares, y una mezcla de los mismos.

40 Los ejemplos del agente halogenante que se va a utilizar en la reacción incluyen cloruro de tionilo, bromuro de tionilo, oxiclорuro de fósforo, oxibromuro de fósforo, pentacloruro de fósforo, cloruro de oxalilo, y fosgeno.

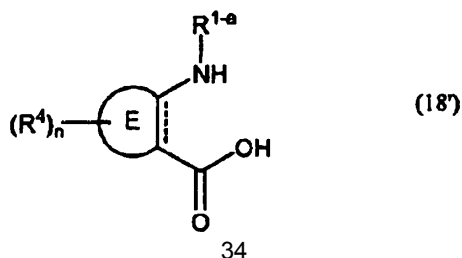
45 La cantidad de agente halogenante que se va a utilizar en la reacción es usualmente de 1 a 2 moles por 1 mol del compuesto (12) y, algunos casos, el agente halogenante se puede utilizar en una cantidad en exceso.

La temperatura de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0°C a 150°C, y el tiempo de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0,1 a 24 horas.

50 Una vez completada la reacción, el compuesto (11) se puede aislar recogiendo un precipitado depositado en la mezcla de reacción, o concentrando la mezcla de reacción. El compuesto aislado(11) se utiliza usualmente tal cual en la siguiente etapa y, si fuera necesario, se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, o similares.

Procedimiento de Referencia 8

55 El compuesto (12) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (18'):



donde R^{1-a} , R^4 y n se definen como antes (más adelante, referido como el compuesto (18')) y el compuesto (7).

5 La reacción se realiza en presencia o ausencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente utilizado en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, éter metil terc-butílico, y similares, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, y similares, hidrocarburos tales como tolueno, benceno, xileno, y similares, nitrilos tales como acetonitrilo, y similares, disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido, y similares, y una mezcla de los mismos.

10 La cantidad del compuesto (7) que se va a utilizar en la reacción es usualmente de 1 a 2 moles por 1 mol del compuesto (18').

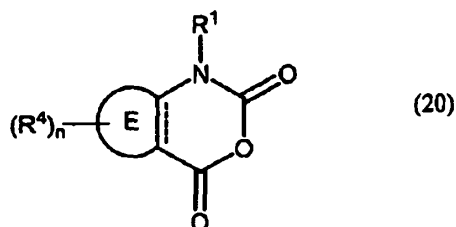
15 La reacción se realiza en presencia de una base. Los ejemplos de la base que se va a utilizar incluyen compuestos heterocíclicos que contienen nitrógeno tales como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]7-undeceno (DBU), 1,5-diazabicyclo[4,3,0]5-noneno (DBN), y similares, aminas terciarias tales como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina, y similares, bases inorgánicas tales como carbonato de potasio, hidruro de sodio, y similares. La cantidad de la base que se va a utilizar es usualmente de 1 a 2 moles por 1 mol del compuesto (18').

20 La temperatura de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0 a 50°C, y el tiempo de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0,1 a 24 horas.

25 Una vez completada la reacción, el compuesto (12) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua, seguido de extracción convencional con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El compuesto aislado(12) se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, cromatografía, o similares.

Procedimiento de Referencia 9

30 El compuesto (6) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (20):



donde R^1 , R^4 y n se definen como antes (más adelante, referido como el compuesto 20)) y el compuesto (10).

35 La reacción se realiza en presencia o ausencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente utilizado en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano, éter metil terc-butílico, y similares, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, y similares, hidrocarburos tales como tolueno, benceno, xileno, y similares, nitrilos tales como acetonitrilo, y similares, disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido, y similares, alcoholes tales como metanol, etanol, isopropilo alcohol, y similares, y una mezcla de los mismos.

40 La cantidad del compuesto (10) que se va a utilizar en la reacción es usualmente de 1 a 2 moles por 1 mol del compuesto (20).

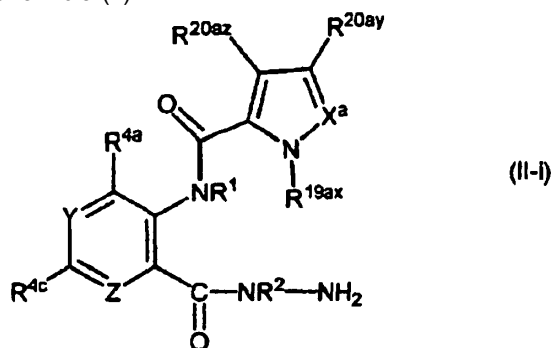
45 La temperatura de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de -20 a 150°C, y el tiempo de reacción se encuentra usualmente en el intervalo de 0,1 a 24 horas.

50 Una vez completada la reacción, el compuesto (20) se puede aislar vertiendo la mezcla de reacción en agua, y extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, o recogiendo el precipitado depositado mediante filtración. El Compuesto (20) aislado se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, cromatografía, o similares.

55 Los compuestos (3), (4) y (13) son compuestos conocidos, o se pueden producir a partir de compuestos conocidos de acuerdo con procedimientos conocidos (p. ej. véanse Organic Functional Group Preparations, 2ª edición, Vol.1, capítulo 12, p. 359-376 (Stanley R. Sandler, Wolf Karo.) u Organic Functional Group Preparations, 2ª edición, Vol.1, capítulo 14, p. 434-465 (Stanley R. Sandler, Wolf Karo.)).

En cuanto a un aspecto del compuesto (2), se menciona el siguiente compuesto:

Un compuesto de hidrazida de la fórmula (II):



5 donde

X^a representa un átomo de nitrógeno o CR^{20ax},

Y y Z representan independientemente un átomo de nitrógeno o CR^{4b}, pero ni Y ni Z son CR^{4b} al mismo tiempo,

R¹ es un átomo de hidrógeno o alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno,

10 R² representan un átomo de hidrógeno, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cianoalquilo C2-C6, hidroxialquilo C1-C6, alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquino C2-C6 sustituido
 15 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido
 20 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C2-C6)carbonilo, alquil(C2-C6)aminocarbonilo, dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo, o trialquil(C3-C6)sililo,

o representa fenilo, fenilalquilo C7-C9 o fenilcarbonilo: cada uno de dichos anillos de fenilo sustituidos opcionalmente
 25 con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) hidroxilo, (5) carboxilo, (6) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) hidroxialquilo C1-C6, (8) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) cianoalquilo C2-C6, (10) alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alqueno C2-C6 sustituido
 30 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alquino C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (14) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (15) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (16) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido
 35 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (17) alquil(C1-C6)amino, (18) dialquil(C2-C8)amino, (19) cicloalquil(C3-C6)amino, (20) alquil(C2-C6)carbonilo, (21) alcoxi(C2-C6)carbonilo, (22) alquil(C2-C6)aminocarbonilo, (23) dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, (24) cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo y (25) trialquil(C3-C6)sililo

R^{4a}, R^{4b} y R^{4c} son independientemente un átomo de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, carboxilo, alquilo C1-C6
 40 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cianoalquilo C2-C6, alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquino C2-C6 sustituido
 45 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido
 50 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)amino, dialquil(C2-C8)amino, cicloalquil(C3-C6)amino, alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxi(C2-C6)carbonilo, alquil(C2-C6)aminocarbonilo, dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, trialquil(C3-C6)sililo o

representa independientemente fenilo, bencilo o fenoxi, cada anillo sustituido opcionalmente con uno o más
 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) hidroxilo,
 (5) carboxilo, (6) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) hidroxialquilo C1-
 C6, (8) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) cianoalquilo C2-C6, (10)
 alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alqueno C2-C6 sustituido
 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alquino C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más
 átomos de halógeno, (13) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (14)
 alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (15) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido
 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (16) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o
 más átomos de halógeno, (17) alquil(C1-C6)amino, (18) dialquil(C2-C8)amino, (19) cicloalquil(C3-C6)amino, (20)
 alquil(C2-C6)carbonilo, (21) alcoxi(C2-C6)carbonilo, (22) alquil(C2-C6)aminocarbonilo, (23) dialquil(C3-
 C8)aminocarbonilo, (24) cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo y (25) trialquil(C3-C6)sililo;

o heteroaromático de 5 o 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) hidroxilo, (5) carboxilo, (6) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) hidroxialquilo C1-C6, (8) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) cianoalquilo C2-C6, (10) alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquenilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alquinilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (14) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (15) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (16) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (17) alquil(C1-C6)amino, (18) dialquil(C2-C8)amino, (19) cicloalquil(C3-C6)amino, (20) alquil(C2-C6)carbonilo, (21) alcoxi(C2-C6)carbonilo, (22) alquil(C2-C6)aminocarbonilo, (23) dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, (24) cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo y (25) trialquil(C3-C6)sililo;

R^{19ax} representan un átomo de hidrógeno; alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cianoalquilo C2-C6 ; alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquenilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquinilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

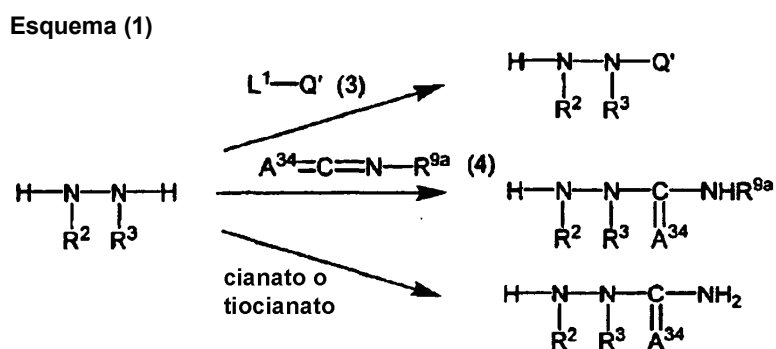
fenilalquilo C7-C9 cuyo anillo de fenilo está sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

o piridinilalquilo C7-C9 cuyo anillo de piridina está sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

R^{20ax}, R^{20ay} y R^{20az} representan un átomo de halógeno; ciano; nitro; tiocianato; alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cianoalquilo(C2-C6)oxi; alcoxi(C2-C6)alquiloxi sustituido opcionalmente con uno o más átomos de

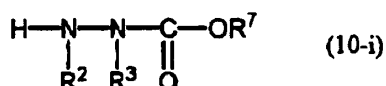
halógeno; alqueniil(C2-C6)oxi sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquiniil(C2-C6)oxi sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; o fenoxi sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno.

15 El compuesto (10) se puede producir, por ejemplo, de acuerdo con el siguiente esquema (1).

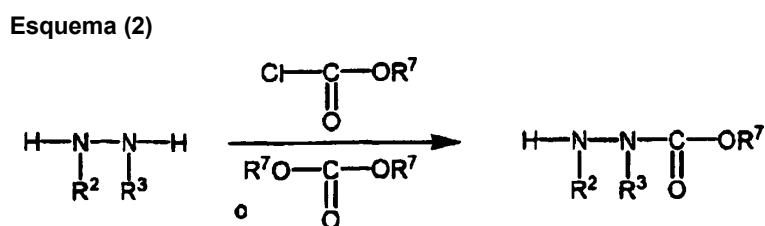


20 En el Esquema (1), A^{34} , L^1 , Q' , R^2 , R^3 y R^{9a} se definen como antes.

Entre los compuestos (10), un compuesto representado por la fórmula (10-i):



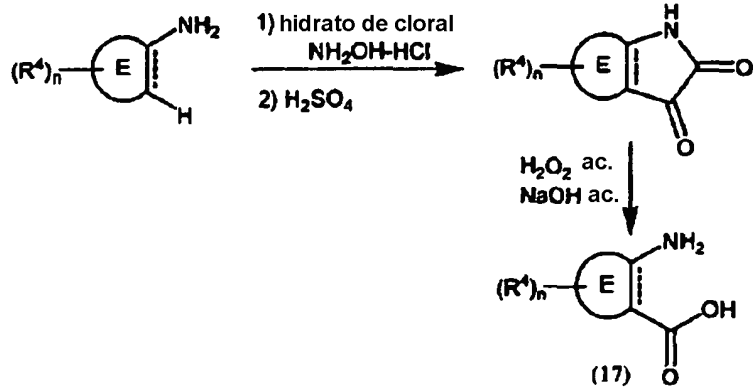
25 donde R^2 , R^3 y R^7 se definen como antes, se puede producir, por ejemplo, de acuerdo con el siguiente esquema (2).



30 En el Esquema (2), R^2 , R^3 y R^7 se definen como antes.

El compuesto (17) se puede producir, por ejemplo, de acuerdo con el siguiente Esquema (3).

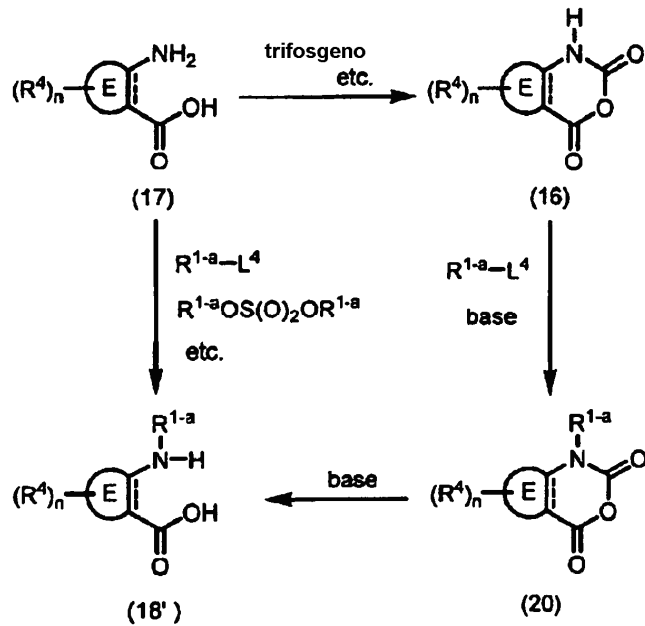
Esquema 3



En el Esquema (3), R^4 y n se definen como antes.

- 5 Los compuestos (16), (18') y (20) se pueden producir, por ejemplo, de acuerdo con el siguiente Esquema (4).

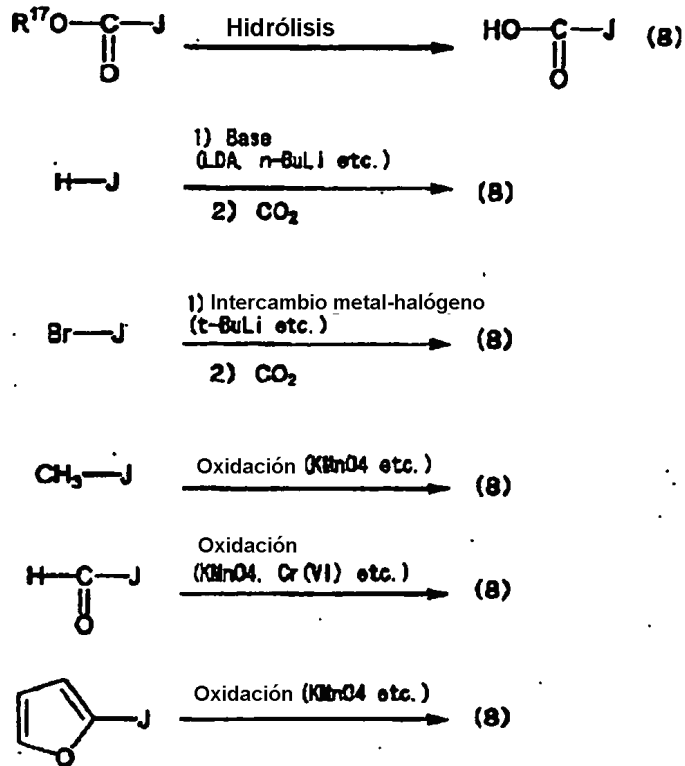
Esquema 4



- 10 En el Esquema (4), R^{1-a} , R^4 y n se definen como antes, y L^4 representa un grupo eliminable (p. ej. un átomo de halógeno, un grupo metanosulfonilo, p-toluenosulfonilo etc.).

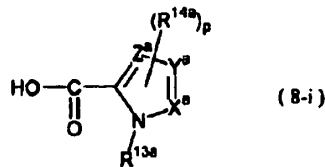
- 15 El compuesto (8) se puede producir, por ejemplo, de acuerdo con el procedimiento mostrado en el siguiente Esquema (7).

Esquema (7)



5 En el Esquema (7), J se define como antes, R¹⁷ representa un grupo metilo o un grupo etilo, LDA representa diisopropilamido de litio, n-BuLi representa butil litio normal, y t-BuLi representa butil litio terciario.

Entre los compuestos (8), un compuesto representado por la fórmula (8-i)

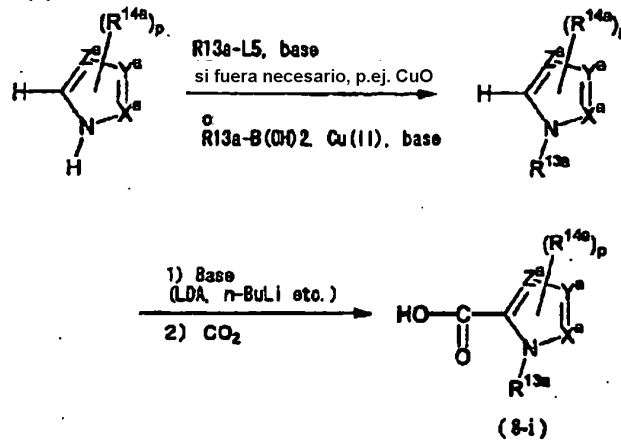


10

donde R^{13a}, R^{14a}, X^a, Y^a, Z^a y p se definen como antes, se puede producir, por ejemplo, de acuerdo con el procedimiento mostrado en el siguiente Esquema (8).

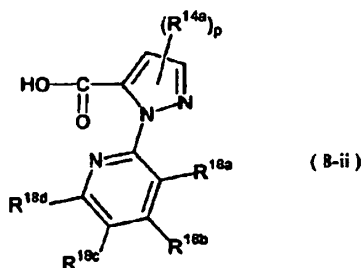
15

Esquema (8)



En el Esquema (8), R^{13a} , R^{14a} , X^a , Y^a , Z^a , p , LDA y $n\text{-BuLi}$ se definen como antes, y L^5 representa un grupo eliminable (p. ej. un átomo de halógeno, un grupo metanosulfonyloxi, a p -toluenosulfonyloxi grupo, a metilsulfonylo etc.).

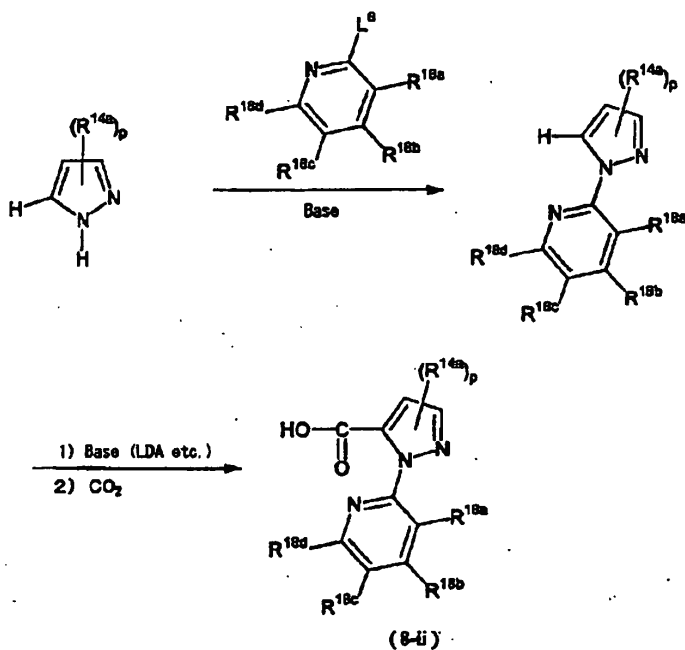
5 Entre los compuestos (8), un compuesto representado por la fórmula (8-ii):



10 donde R^{14a} y p se definen como antes, R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} y R^{18d} , cada uno, independientemente, representan un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, ciano grupo, nitro grupo, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, alquil(C1-C6)sulfonylo sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, o alquil(C1-C6)sulfonylo sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, se puede producir, por ejemplo, de acuerdo con el procedimiento mostrado en el siguiente Esquema (9).

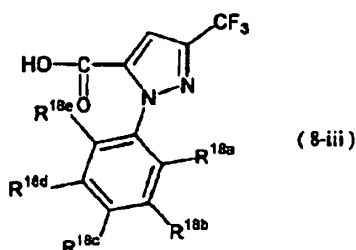
15

Esquema (9)



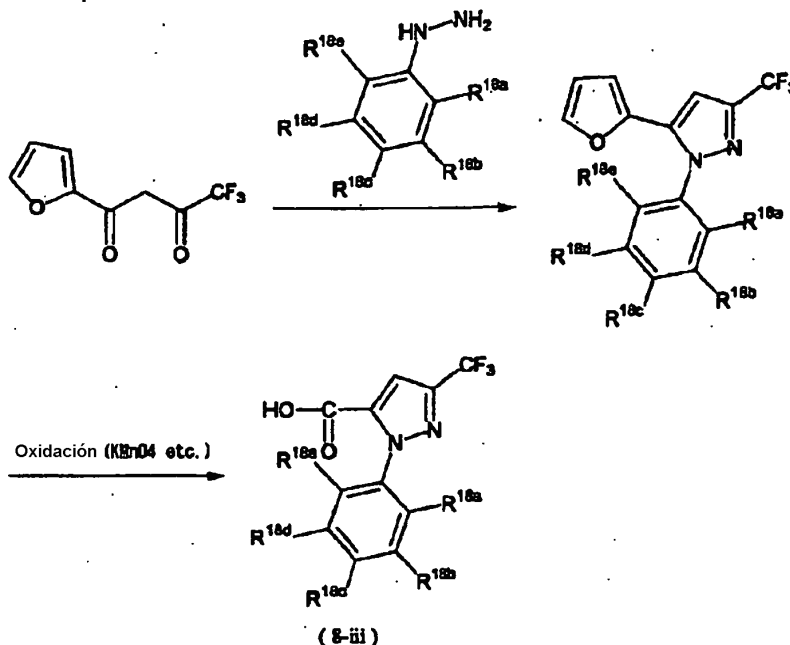
20 En el Esquema (9), R^{14a} , R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} , LDA y p se definen como antes, y L^6 representa un grupo eliminable (p. ej. un átomo de halógeno, metilsulfonylo etc.).

Entre los compuestos (8), un compuesto representado por la fórmula (8-iii):



5 donde R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} y R^{18e} representan independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, ciano grupo, nitro grupo, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, o alquil(C1-C6)sulfonylo sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, se puede producir, por ejemplo, de acuerdo con el procedimiento mostrado en el siguiente Esquema (10).

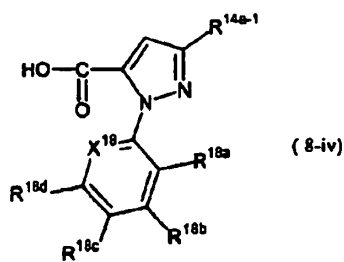
Esquema 10



10

En el Esquema (10), R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} y R^{18e} se definen como antes.

Entre los compuestos (8), un compuesto representado por la fórmula (8-iv):

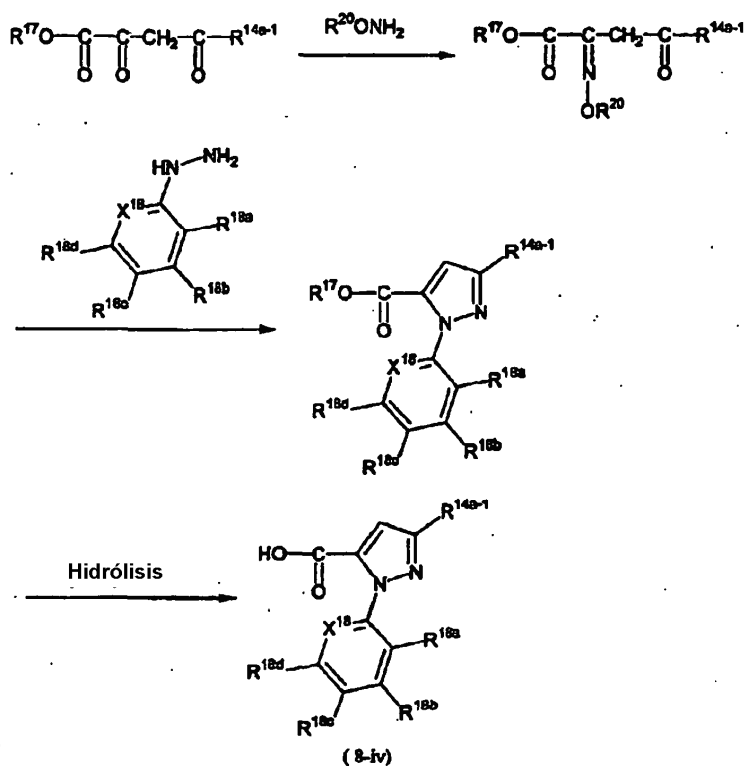


15

donde X^{18} representa $-N=$, o $-CR^{18e}=\text{}$; R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} y R^{18e} se definen como antes, y R^{14a-1} representa alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, se puede producir, por ejemplo, de acuerdo con el procedimiento mostrado en el siguiente Esquema (11).

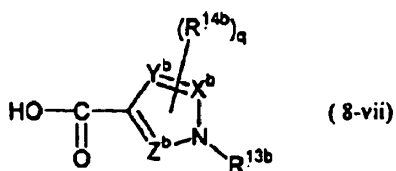
20

Esquema (11)



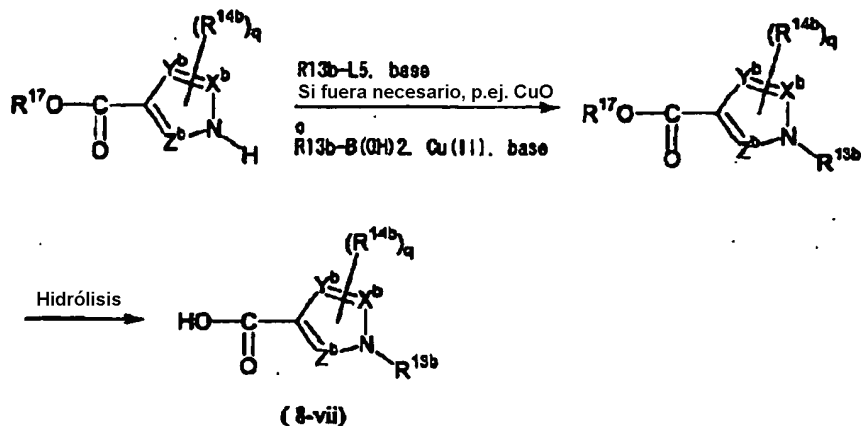
5 En el Esquema (11), R^{14a-1} , R^{17} , R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} y X^{18} se definen como antes, y R^{20} representa un grupo metilo o un grupo etilo.

Entre los compuestos (8), un compuesto representado por la fórmula (8-vii):



10 donde R^{13b} , R^{14b} , X^b , Y^b , Z^b y q se definen como antes, se puede producir, por ejemplo, de acuerdo con el procedimiento mostrado en el siguiente Esquema (14).

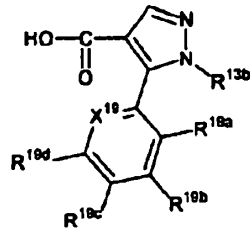
Esquema (14)



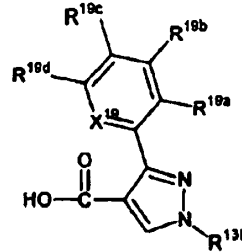
15

En el Esquema (14), R^{13b} , R^{14b} , R^{17} , X^b , Y^b , Z^b , L^5 y q se definen como antes.

Entre los compuestos (8), un compuesto representado por la fórmula (8-viii) y la fórmula (8-ix):



(8-viii)



(8-ix)

5

[donde R^{13b} se define como antes,

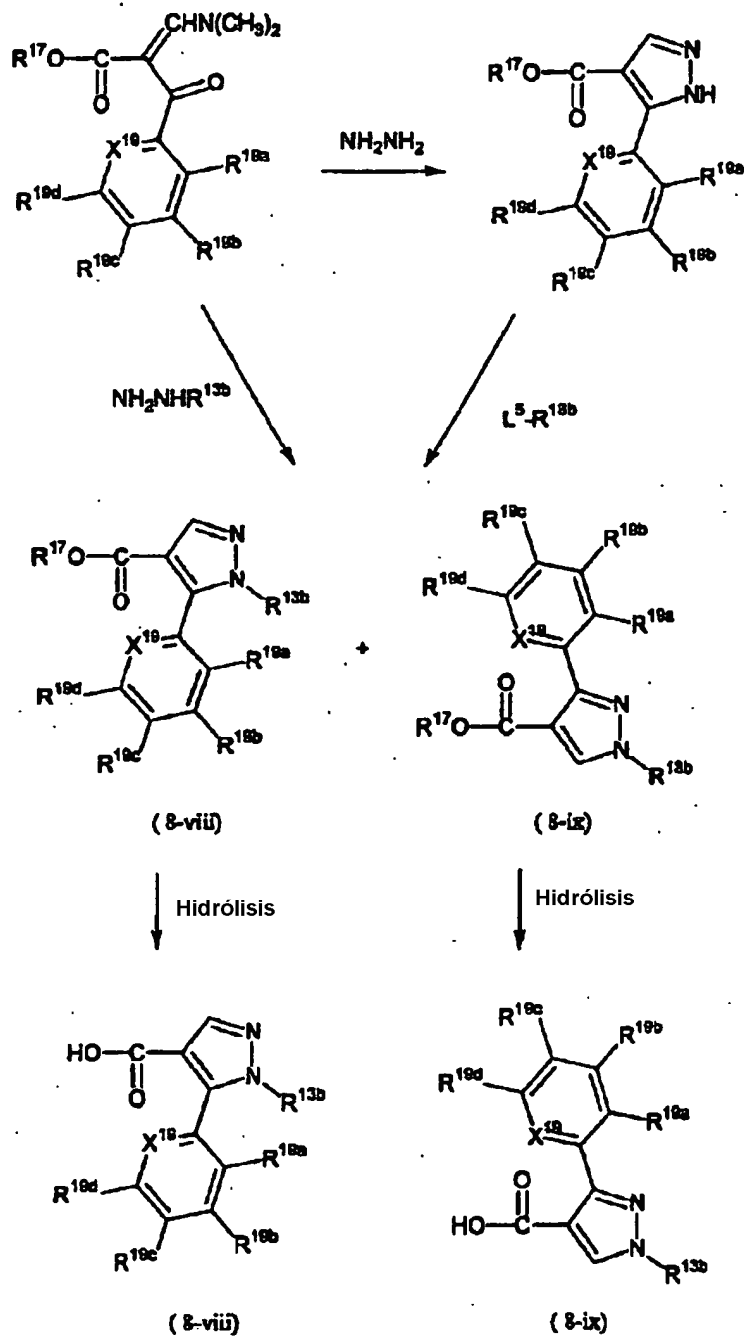
X^{19} representa $-N=$, o $-CR^{19e}=$,

R^{19ab} , R^{19b} , R^{19c} , R^{19d} y R^{19e} , cada uno, independientemente, representan un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, ciano grupo, a nitro grupo, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, o alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno]

10

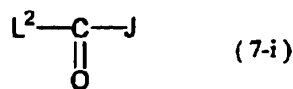
15

Esquema (15)



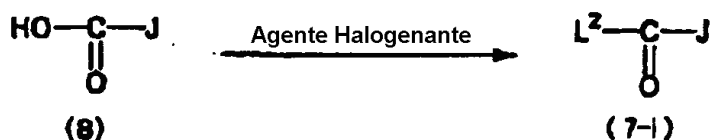
5 En el Esquema (15), R^{13b} , R^{17} , R^{19a} , R^{19b} , R^{19c} , R^{19d} , L^5 y X^{19} se definen como antes.

Entre los compuestos (7), un compuesto representado por la fórmula (7-i):



10 donde L^2 y J se definen como antes, se puede producir, por ejemplo, de acuerdo con el procedimiento mostrado en el siguiente Esquema (16).

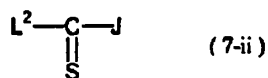
Esquema (16)



En el Esquema (16), L² y J se definen como antes.

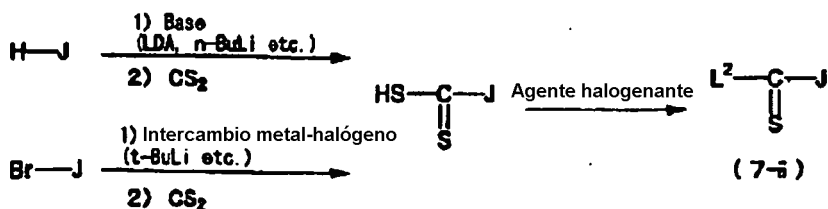
5

Entre los compuestos (7), un compuesto representado por la fórmula (7-ii):



10 donde L² y J se definen como antes, se puede producir, por ejemplo, de acuerdo con el procedimiento mostrado en el siguiente esquema (17).

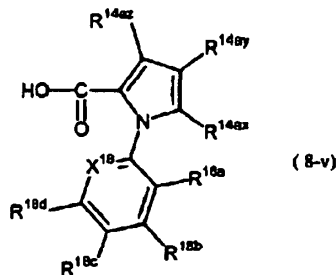
Esquema (17)



15

En el Esquema (17), L² y J se definen como antes, LDA representa diisopropilamido de litio, n-BuLi representa butil litio normal, y t-BuLi representa butil litio terciario.

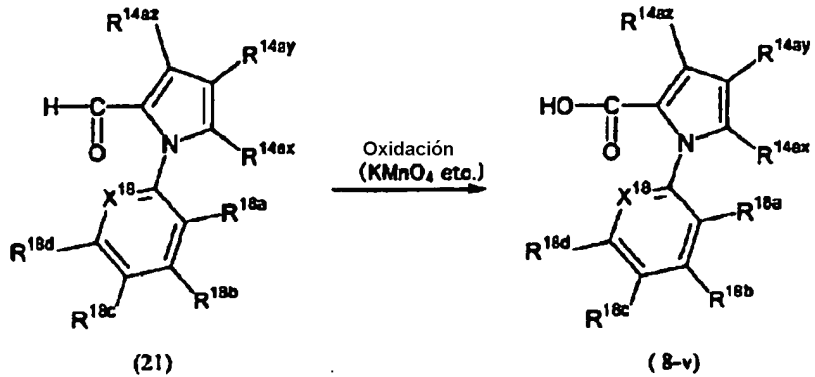
20 Entre los compuestos (8), un compuesto representado por la fórmula (8-v):



25 donde R^{18a}, R^{18b}, R^{18c}, R^{18d} y X¹⁸ se definen como antes, y R^{14ax}, R^{14ay} y X^{14az} representan independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, ciano grupo, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, o alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, se puede producir, por ejemplo, de acuerdo con el procedimiento mostrado en el siguiente Esquema (18).

30

Esquema (18)

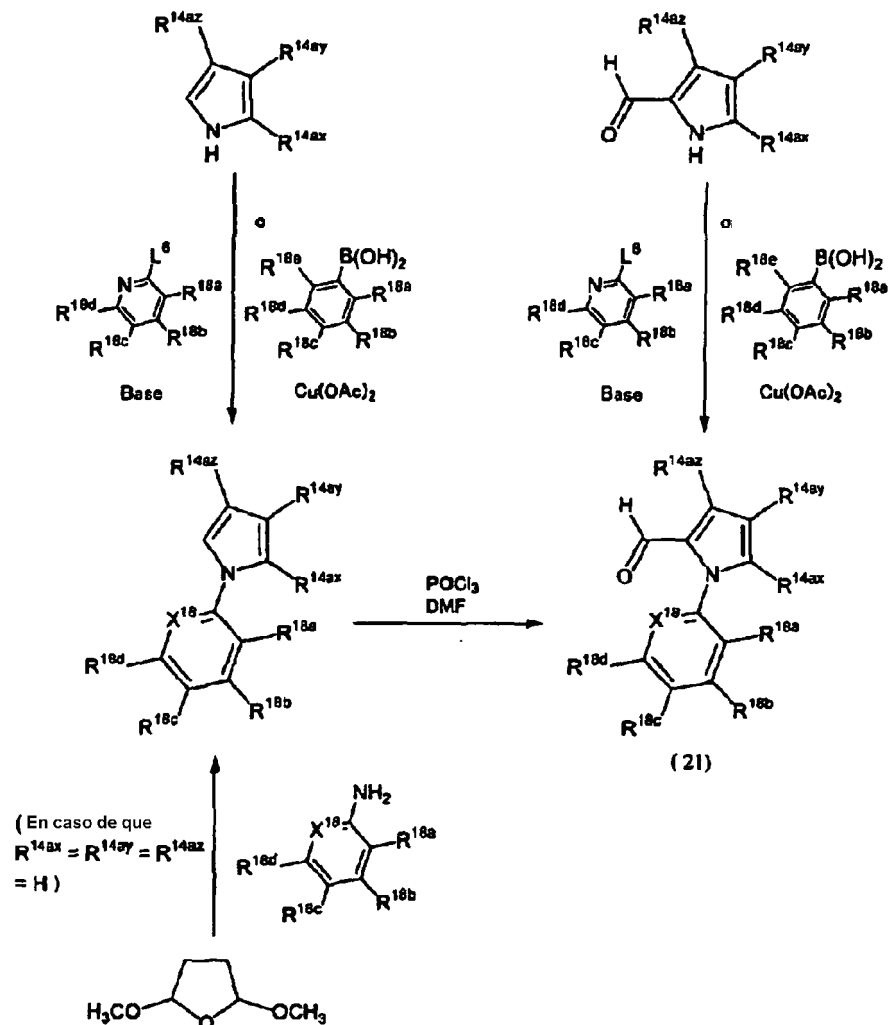


5 En el Esquema (18), R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} , X^{18} , R^{14ax} , R^{14ay} y X^{14az} se definen como antes.

Los compuestos (21) del esquema (18) se pueden producir, por ejemplo, de acuerdo con el procedimiento mostrado en el siguiente Esquema (19).

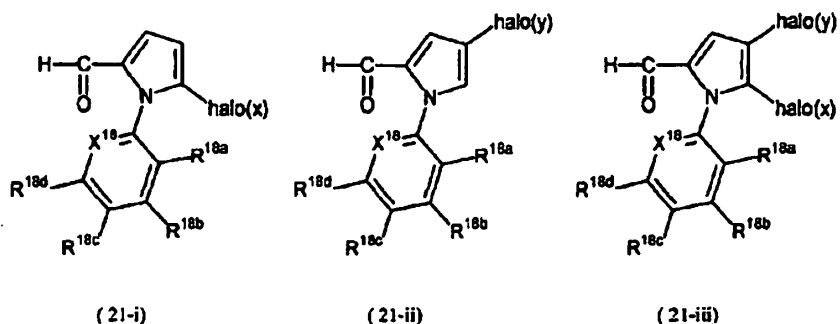
10

Esquema (19)



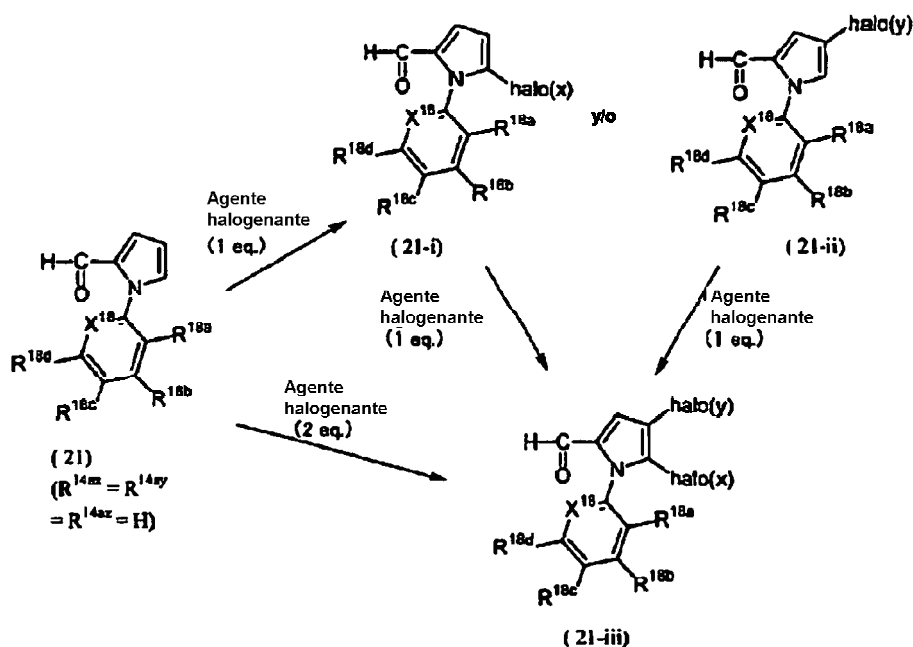
En el Esquema (19), R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} , R^{18e} , X^{18} , R^{14ax} , R^{14ay} , X^{14az} y L^6 se definen como antes.

Entre los compuestos (21) en el esquema (18), un compuesto representado por la fórmula (21-i), la fórmula (21-ii), y la fórmula (21-iii):



5 donde R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} y X^{18} se definen como antes, y halo(x) y halo(y) representan independientemente un átomo de halógeno, se puede producir, por ejemplo, de acuerdo con el procedimiento mostrado en el siguiente Esquema (20).

Esquema 20

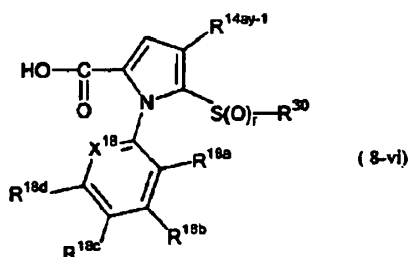


10

En el Esquema (20), R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} , X^{18} , halo(x) y halo(y) se definen como antes.

15

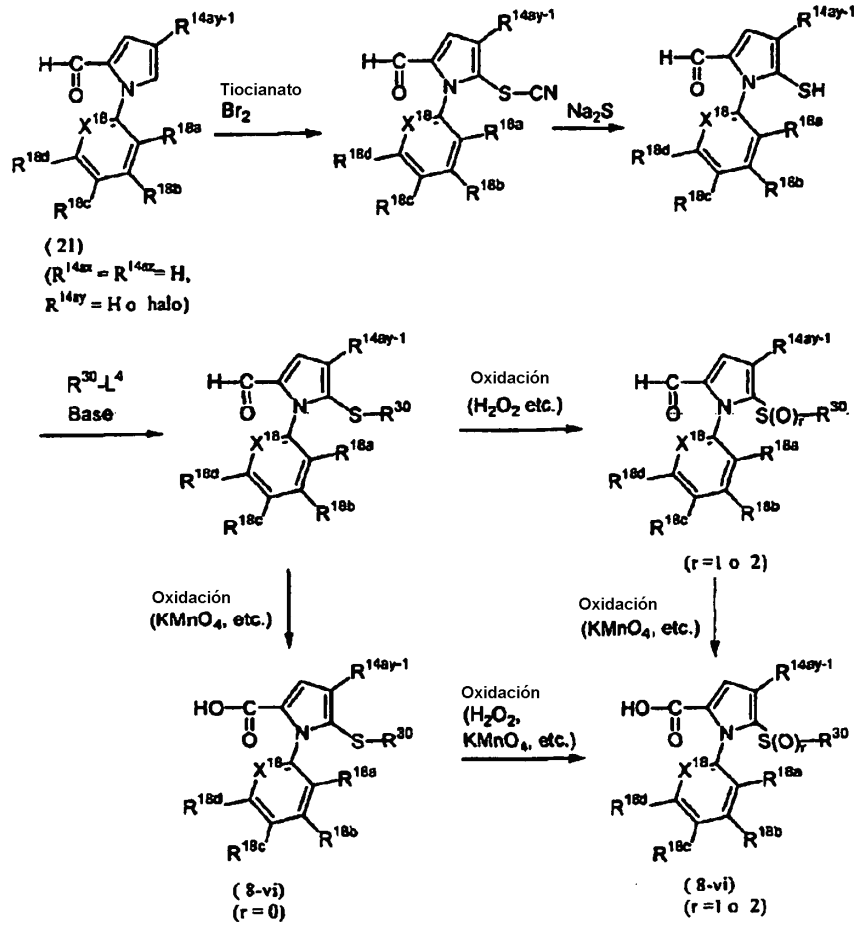
Entre los compuestos (8), un compuesto representado por la fórmula (8-vi):



20

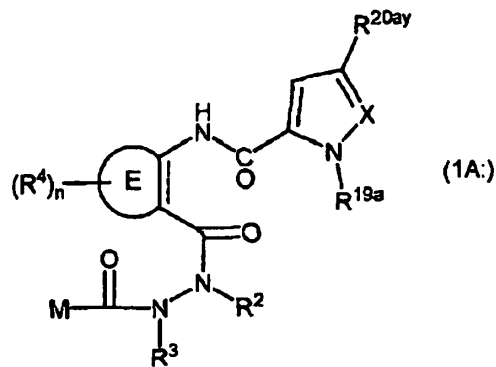
donde R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} y X^{18} se definen como antes, R^{14ay-1} representa un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno, R^{30} representa alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con al menos un átomo de halógeno, y r representa un número entero de 0 a 2, se puede producir, por ejemplo, de acuerdo con el procedimiento mostrado en el siguiente Esquema (21).

Esquema (21)



5 En el Esquema (21), R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} , X^{18} , R^{14ay-1} , R^{30} , r y L^4 se definen como antes.

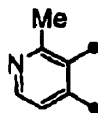
Los ejemplos específicos del presente compuesto se resumen en los siguientes compuestos 1 a 277.



10

Compuesto 1:

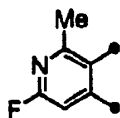
Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M , R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



15

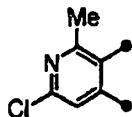
Compuesto 2:

Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



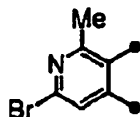
5 **Compuesto 3:**

Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



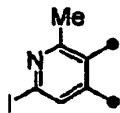
10 **Compuesto 4:**

Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



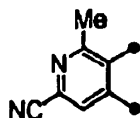
15 **Compuesto 5:**

Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



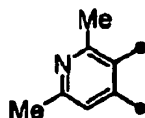
20 **Compuesto 6:**

Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



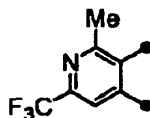
25 **Compuesto 7:**

Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



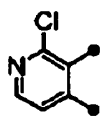
30 **Compuesto 8:**

Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

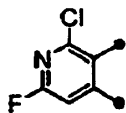


35 **Compuesto 9:**

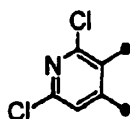
Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 10:**

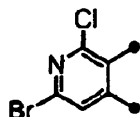
5 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 11:**

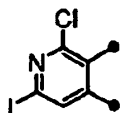
10 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 12:**

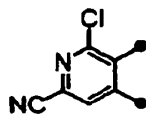
15 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 13:**

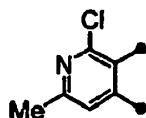
20 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 14:**

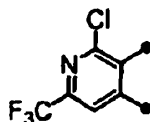
25 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 15:**

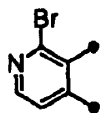
30 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 16:**

35 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

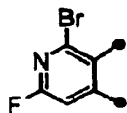
**Compuesto 17:**

Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M , R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



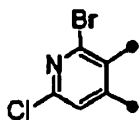
5 **Compuesto 18:**

Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M , R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



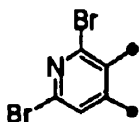
10 **Compuesto 19:**

Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M , R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



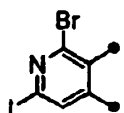
15 **Compuesto 20:**

Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M , R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



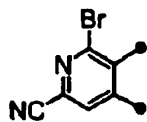
20 **Compuesto 21:**

Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M , R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



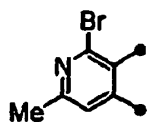
25 **Compuesto 22:**

Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M , R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



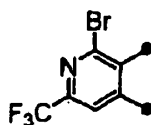
30 **Compuesto 23:**

Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M , R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

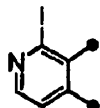


35 **Compuesto 24:**

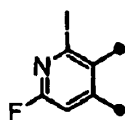
Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M , R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 25:**

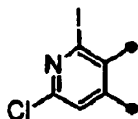
5 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 26:**

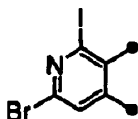
10 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 27:**

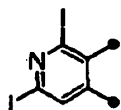
15 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 28:**

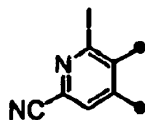
20 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 29:**

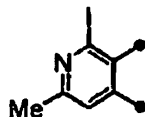
25 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 30:**

30 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

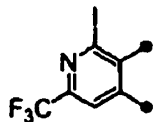
**Compuesto 31:**

35 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



Compuesto 32:

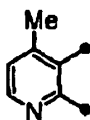
Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



5

Compuesto 33:

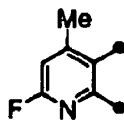
Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



10

Compuesto 34:

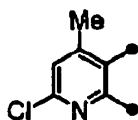
Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



15

Compuesto 35:

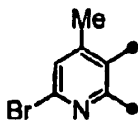
Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



20

Compuesto 36:

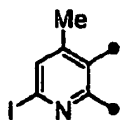
Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



25

Compuesto 37:

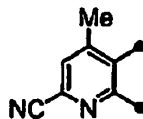
Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



30

Compuesto 38:

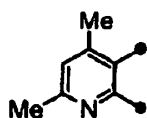
Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



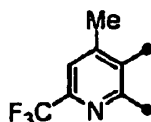
35

Compuesto 39:

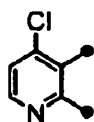
Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 40:**

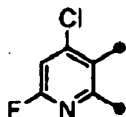
5 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 41:**

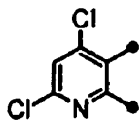
10 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 42:**

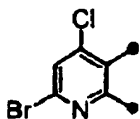
15 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 43:**

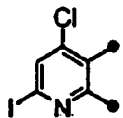
20 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 44:**

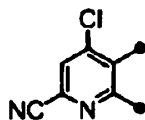
25 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 45:**

30 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

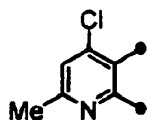
**Compuesto 46:**

35 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



Compuesto 47:

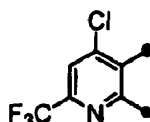
Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



5

Compuesto 48:

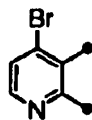
Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



10

Compuesto 49:

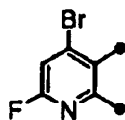
Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



15

Compuesto 50:

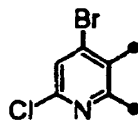
Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



20

Compuesto 51:

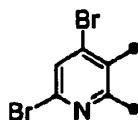
Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



25

Compuesto 52:

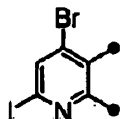
Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



30

Compuesto 53:

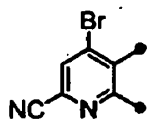
Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



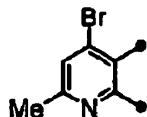
35

Compuesto 54:

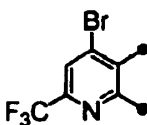
Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 55:**

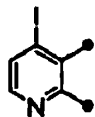
5 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 56:**

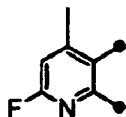
10 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 57:**

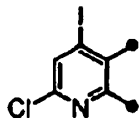
15 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 58:**

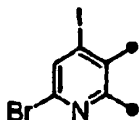
20 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 59:**

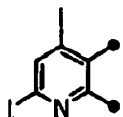
25 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 60:**

30 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

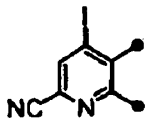
**Compuesto 61:**

35 Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



Compuesto 62:

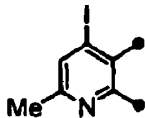
Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



5

Compuesto 63:

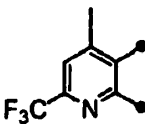
Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



10

Compuesto 64:

Compuestos de fórmula 1A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} , R^{20ay} y X le corresponde una fila en la Tabla A, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



15

Tabla A

Núm.	R ²	R ³	M	R ^{19a}	X	R ^{20ay}
	H	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>n</i> -Pr	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>n</i> -Pr	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Bu	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Bu	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>terc</i> -Bu	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>terc</i> -Bu	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CF ₃	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CN	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ OMe	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ OMe	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CO ₂ Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CH=CH ₂	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CH=CH ₂	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CCH	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CCH	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	CH ₂ CCH	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>cic</i> -Pr	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>cic</i> -Pr	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>sec</i> -Bu	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>sec</i> -Bu	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>cic</i> -Bu	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>cic</i> -Bu	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CF ₃	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CF ₃	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CN	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CN	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	CH ₂ CN	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl

ES 2 380 272 T3

	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH ₂ OMe	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ OMe	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH ₂ SMe	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH ₂ SMe	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CO ₂ Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CO ₂ Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	2-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	3-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	4-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ NHCH ₂ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ NMeCH ₂ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(<i>iso</i> -Pr)CH ₂ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(CHO)CH ₂ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(Ac)CH ₂ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(CO ₂ Me)CH ₂ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(CO ₂ Et)CH ₂ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>n</i> -Pr	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>n</i> -Pr	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>iso</i> -Bu	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Bu	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>terc</i> -Bu	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>terc</i> -Bu	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CF ₃	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CN	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ OMe	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ OMe	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CCH	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CO ₂ Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CH=CH ₂	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CH=CH ₂	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CCH	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CCH	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	CH ₂ CCH	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>cic</i> -Pr	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>cic</i> -Pr	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>iso</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>sec</i> -Bu	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br

ES 2 380 272 T3

	H	<i>sec</i> -Bu	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>cis</i> -Bu	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>cis</i> -Bu	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ - <i>cis</i> -Pr	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ - <i>cis</i> -Pr	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ - <i>cis</i> -Bu	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ - <i>cis</i> -Bu	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CF ₃	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CF ₃	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CN	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CN	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	CH ₂ CN	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH ₂ OMe	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ OMe	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH ₂ SMe	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH ₂ SMe	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CO ₂ Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CO ₂ Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	2-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	3-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	4-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ NHCH ₂ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ NMeCH ₂ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(<i>iso</i> -Pr)CH ₂ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(CHO)CH ₂ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(Ac)CH ₂ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(CO ₂ Me)CH ₂ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(CO ₂ Et)CH ₂ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>n</i> -Pr	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>n</i> -Pr	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Bu	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Bu	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>terc</i> -Bu	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>terc</i> -Bu	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CF ₃	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CN	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ OMe	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ OMe	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃

	H	CO ₂ Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CH=CH ₂	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CH=CH ₂	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CCH	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CCH	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	CH ₂ CCH	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>cic</i> -Pr	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>cic</i> -Pr	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>sec</i> -Bu	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>sec</i> -Bu	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>cic</i> -Bu	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>cic</i> -Bu	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CF ₃	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CF ₃	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CN	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CN	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	CH ₂ CN	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH ₂ OMe	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ OMe	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH ₂ SMe	H	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH ₂ SMe	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CO ₂ Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CO ₂ Me	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ NHCH ₂ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ NMeCH ₂ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(<i>iso</i> -Pr)CH ₂ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(CHO)CH ₂ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(Ac)CH ₂ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(CO ₂ Me)CH ₂ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(CO ₂ Et)CH ₂ -	H	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>n</i> -Pr	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl

	H	<i>n</i> -Pr	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Bu	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Bu	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>terc</i> -Bu	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>terc</i> -Bu	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CF ₃	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CN	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ OMe	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ OMe	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CO ₂ Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CH=CH ₂	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CH=CH ₂	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CCH	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CCH	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	CH ₂ CCH	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>cic</i> -Pr	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>cic</i> -Pr	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>sec</i> -Bu	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>sec</i> -Bu	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>cic</i> -Bu	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>cic</i> -Bu	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CF ₃	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CF ₃	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CN	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CN	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	CH ₂ CN	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH ₂ SMe	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH ₂ SMe	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CO ₂ Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CO ₂ Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	2-piridinilo	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	3-piridinilo	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	4-piridinilo	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl

ES 2 380 272 T3

		-(CH ₂) ₃ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ NHCH ₂ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ NMeCH ₂ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(<i>iso</i> -Pr)CH ₂ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(CHO)CH ₂ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(Ac)CH ₂ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(CO ₂ Me)CH ₂ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(CO ₂ Et)CH ₂ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>n</i> -Pr	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>n</i> -Pr	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>iso</i> -Bu	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Bu	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>terc</i> -Bu	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>terc</i> -Bu	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CF ₃	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CN	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ OMe	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ OMe	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CCH	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CO ₂ Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CH=CH ₂	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CH=CH ₂	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CCH	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CCH	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	CH ₂ CCH	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>cic</i> -Pr	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>cic</i> -Pr	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>iso</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>sec</i> -Bu	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>sec</i> -Bu	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>cic</i> -Bu	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>cic</i> -Bu	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CF ₃	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br

ES 2 380 272 T3

	Et	CH ₂ CF ₃	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CN	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CN	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	CH ₂ CN	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH ₂ SMe	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH ₂ SMe	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CO ₂ Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CO ₂ Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	2-piridinilo	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	3-piridinilo	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	4-piridinilo	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ NHCH ₂ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ NMeCH ₂ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(<i>iso</i> -Pr)CH ₂ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(CHO)CH ₂ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(Ac)CH ₂ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(CO ₂ Me)CH ₂ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(CO ₂ Et)CH ₂ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>n</i> -Pr	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>n</i> -Pr	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Bu	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Bu	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>terc</i> -Bu	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>terc</i> -Bu	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CF ₃	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CN	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ OMe	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ OMe	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CH=CH ₂	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CH=CH ₂	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃

ES 2 380 272 T3

	Me	CH ₂ CCH	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CCH	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	CH ₂ CCH	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>cic</i> -Pr	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>cic</i> -Pr	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>sec</i> -Bu	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>sec</i> -Bu	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>cic</i> -Bu	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>cic</i> -Bu	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CF ₃	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CF ₃	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CN	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CN	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	CH ₂ CN	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH ₂ SMe	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH ₂ SMe	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CO ₂ Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CO ₂ Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ NHCH ₂ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ NMeCH ₂ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(<i>iso</i> -Pr)CH ₂ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(CHO)CH ₂ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(Ac)CH ₂ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(CO ₂ Me)CH ₂ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(CO ₂ Et)CH ₂ -	Me	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>n</i> -Pr	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>n</i> -Pr	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Bu	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Bu	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>terc</i> -Bu	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>terc</i> -Bu	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CF ₃	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl

ES 2 380 272 T3

	H	CH ₂ CN	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ OMe	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ OMe	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CO ₂ Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CCH	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CCH	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	CH ₂ CCH	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>cis</i> -Pr	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>cis</i> -Pr	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>sec</i> -Bu	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>sec</i> -Bu	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>cis</i> -Bu	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>cis</i> -Bu	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ - <i>cis</i> -Pr	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ - <i>cis</i> -Pr	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ - <i>cis</i> -Bu	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ - <i>cis</i> -Bu	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CF ₃	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CF ₃	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CN	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CN	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	CH ₂ CN	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH ₂ OMe	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH ₂ OMe	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ OMe	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH ₂ SMe	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH ₂ SMe	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CO ₂ Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CO ₂ Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	2-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	3-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	4-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ NHCH ₂ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ NMeCH ₂ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(<i>iso</i> -Pr)CH ₂ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(CHO)CH ₂ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(Ac)CH ₂ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(CO ₂ Me)CH ₂ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(CO ₂ Et)CH ₂ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br

ES 2 380 272 T3

	Me	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>n</i> -Pr	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>n</i> -Pr	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>iso</i> -Bu	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Bu	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>terc</i> -Bu	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>terc</i> -Bu	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CF ₃	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CN	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ OMe	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ OMe	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CCH	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CO ₂ Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CCH	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CCH	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	CH ₂ CCH	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>cic</i> -Pr	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>cic</i> -Pr	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>iso</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>sec</i> -Bu	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>sec</i> -Bu	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>cic</i> -Bu	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>cic</i> -Bu	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CF ₃	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CF ₃	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CN	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CN	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	CH ₂ CN	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH ₂ OMe	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH ₂ OMe	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ OMe	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br

ES 2 380 272 T3

	CH ₂ CH ₂ SMe	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH ₂ SMe	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CO ₂ Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CO ₂ Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	2-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	3-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	4-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ NHCH ₂ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ NMeCH ₂ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(<i>iso</i> -Pr)CH ₂ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(CHO)CH ₂ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(Ac)CH ₂ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(CO ₂ Me)CH ₂ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(CO ₂ Et)CH ₂ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>n</i> -Pr	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>n</i> -Pr	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Bu	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Bu	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>terc</i> -Bu	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>terc</i> -Bu	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CF ₃	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CN	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ OMe	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ OMe	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CCH	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CCH	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	CH ₂ CCH	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>cic</i> -Pr	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>cic</i> -Pr	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>sec</i> -Bu	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>sec</i> -Bu	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>cic</i> -Bu	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃

ES 2 380 272 T3

	H	<i>cic</i> -Bu	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CF ₃	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CF ₃	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CN	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CN	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	CH ₂ CN	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH ₂ OMe	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH ₂ OMe	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ OMe	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH ₂ SMe	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH ₂ SMe	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CO ₂ Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CO ₂ Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ NHCH ₂ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ NMeCH ₂ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(<i>iso</i> -Pr)CH ₂ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(CHO)CH ₂ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(Ac)CH ₂ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(CO ₂ Me)CH ₂ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(CO ₂ Et)CH ₂ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>n</i> -Pr	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>n</i> -Pr	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Bu	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Bu	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>terc</i> -Bu	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>terc</i> -Bu	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CF ₃	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CN	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ OMe	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ OMe	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CO ₂ Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl

ES 2 380 272 T3

	Et	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CH=CH ₂	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CH=CH ₂	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CCH	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CCH	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	CH ₂ CCH	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>cis</i> -Pr	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>cis</i> -Pr	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>sec</i> -Bu	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>sec</i> -Bu	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>cis</i> -Bu	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>cis</i> -Bu	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ - <i>cis</i> -Pr	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ - <i>cis</i> -Pr	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ - <i>cis</i> -Bu	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ - <i>cis</i> -Bu	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CF ₃	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CF ₃	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CN	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CN	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	CH ₂ CN	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH ₂ OMe	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH ₂ OMe	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ OMe	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH ₂ SMe	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH ₂ SMe	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CO ₂ Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CO ₂ Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	2-piridinilo	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	3-piridinilo	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	4-piridinilo	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ NHCH ₂ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ NMeCH ₂ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(<i>iso</i> -Pr)CH ₂ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(CHO)CH ₂ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(Ac)CH ₂ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(CO ₂ Me)CH ₂ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(CO ₂ Et)CH ₂ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	OMe	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	OMe	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>n</i> -Pr	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>n</i> -Pr	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br

	H	<i>iso</i> -Pr	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>iso</i> -Bu	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Bu	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>terc</i> -Bu	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>terc</i> -Bu	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CF ₃	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CN	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ OMe	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ OOMe	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CCH	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CO ₂ OMe	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	OMe	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CH=CH ₂	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CH=CH ₂	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	OMe	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CCH	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CCH	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	CH ₂ CCH	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>cic</i> -Pr	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>cic</i> -Pr	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>iso</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>sec</i> -Bu	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>sec</i> -Bu	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>cic</i> -Bu	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>cic</i> -Bu	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CF ₃	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CF ₃	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CN	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CN	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	CH ₂ CN	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH ₂ OMe	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH ₂ OMe	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ OMe	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH ₂ SMe	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH ₂ SMe	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CO ₂ Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CO ₂ Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	2-piridinilo	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	3-piridinilo	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	4-piridinilo	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br

	-CH ₂ NHCH ₂ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br	
	-CH ₂ NMeCH ₂ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br	
	-CH ₂ N(<i>iso</i> -Pr)CH ₂ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br	
	-CH ₂ N(CHO)CH ₂ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br	
	-CH ₂ N(Ac)CH ₂ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br	
	-CH ₂ N(CO ₂ Me)CH ₂ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br	
	-CH ₂ N(CO ₂ Et)CH ₂ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	Br	
	H	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>n</i> -Pr	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>n</i> -Pr	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Bu	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Bu	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>terc</i> -Bu	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>terc</i> -Bu	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CF ₃	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CN	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ OMe	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ OMe	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CH=CH ₂	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CH=CH ₂	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CCH	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CCH	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	CH ₂ CCH	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>cic</i> -Pr	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>cic</i> -Pr	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>sec</i> -Bu	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>sec</i> -Bu	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>cic</i> -Bu	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>cic</i> -Bu	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CF ₃	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CF ₃	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃

ES 2 380 272 T3

	CH ₂ CN	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CN	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CN	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	CH ₂ CN	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH ₂ OMe	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH ₂ OMe	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ OMe	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH ₂ SMe	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH ₂ SMe	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CO ₂ Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CO ₂ Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ NHCH ₂ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ NMeCH ₂ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(<i>iso</i> -Pr)CH ₂ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(CHO)CH ₂ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(Ac)CH ₂ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(CO ₂ Me)CH ₂ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(CO ₂ Et)CH ₂ -	OEt	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>n</i> -Pr	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>n</i> -Pr	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Bu	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Bu	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>terc</i> -Bu	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>terc</i> -Bu	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CF ₃	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CN	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ OMe	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ OMe	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CO ₂ Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CH=CH ₂	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CH=CH ₂	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CCH	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CCH	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl

ES 2 380 272 T3

	CH ₂ CCH	CH ₂ CCH	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>cic</i> -Pr	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>cic</i> -Pr	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>sec</i> -Bu	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>sec</i> -Bu	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>cic</i> -Bu	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>cic</i> -Bu	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CF ₃	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CF ₃	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CN	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CN	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	CH ₂ CN	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH ₂ OMe	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH ₂ OMe	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ OMe	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH ₂ SMe	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH ₂ SMe	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CO ₂ Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CO ₂ Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	2-piridinilo	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	3-piridinilo	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	4-piridinilo	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ NHCH ₂ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ NMeCH ₂ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(<i>iso</i> -Pr)CH ₂ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(CHO)CH ₂ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(Ac)CH ₂ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(CO ₂ Me)CH ₂ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(CO ₂ Et)CH ₂ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>n</i> -Pr	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>n</i> -Pr	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>iso</i> -Bu	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Bu	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>terc</i> -Bu	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>terc</i> -Bu	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CF ₃	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CN	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ OMe	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br

	H	CH ₂ OMe	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CCH	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CO ₂ Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CH=CH ₂	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CH=CH ₂	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CCH	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CCH	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	CH ₂ CCH	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>cic</i> -Pr	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>cic</i> -Pr	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>iso</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>sec</i> -Bu	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>sec</i> -Bu	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>cic</i> -Bu	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>cic</i> -Bu	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CF ₃	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CF ₃	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CN	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CN	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	CH ₂ CN	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH ₂ OMe	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH ₂ OMe	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ OMe	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH ₂ SMe	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH ₂ SMe	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CO ₂ Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CO ₂ Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	2-piridinilo	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	3-piridinilo	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	4-piridinilo	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ NHCH ₂ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ NMeCH ₂ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(<i>iso</i> -Pr)CH ₂ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(CHO)CH ₂ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(Ac)CH ₂ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(CO ₂ Me)CH ₂ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(CO ₂ Et)CH ₂ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃

ES 2 380 272 T3

	Me	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>n</i> -Pr	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>n</i> -Pr	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Bu	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Bu	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>terc</i> -Bu	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>terc</i> -Bu	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CF ₃	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CN	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ OMe	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ OMe	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CH=CH ₂	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CH=CH ₂	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CCH	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CCH	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	CH ₂ CCH	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>cic</i> -Pr	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>cic</i> -Pr	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>sec</i> -Bu	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>sec</i> -Bu	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>cic</i> -Bu	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>cic</i> -Bu	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CF ₃	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CF ₃	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CN	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CN	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	CH ₂ CN	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH ₂ OMe	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH ₂ OMe	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ OMe	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH ₂ SMe	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH ₂ SMe	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃

ES 2 380 272 T3

	Me	CO ₂ Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CO ₂ Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ NHCH ₂ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ NMeCH ₂ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(<i>iso</i> -Pr)CH ₂ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(CHO)CH ₂ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(Ac)CH ₂ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(CO ₂ Me)CH ₂ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(CO ₂ Et)CH ₂ -	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>n</i> -Pr	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>n</i> -Pr	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Bu	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Bu	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>terc</i> -Bu	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>terc</i> -Bu	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CF ₃	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CN	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ OMe	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ OMe	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CO ₂ Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CCH	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CCH	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	CH ₂ CCH	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>cic</i> -Pr	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>cic</i> -Pr	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>sec</i> -Bu	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>sec</i> -Bu	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>cic</i> -Bu	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>cic</i> -Bu	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl

ES 2 380 272 T3

	CH ₂ - <i>cis</i> -Bu	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ - <i>cis</i> -Bu	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CF ₃	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CF ₃	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CN	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CN	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	CH ₂ CN	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH ₂ OMe	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH ₂ OMe	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ OMe	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH ₂ SMe	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH ₂ SMe	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CO ₂ Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CO ₂ Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	2-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	3-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	4-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ NHCH ₂ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ NMeCH ₂ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(<i>iso</i> -Pr)CH ₂ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(CHO)CH ₂ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(Ac)CH ₂ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(CO ₂ Me)CH ₂ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(CO ₂ Et)CH ₂ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>n</i> -Pr	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>n</i> -Pr	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>iso</i> -Bu	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Bu	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>terc</i> -Bu	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>terc</i> -Bu	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CF ₃	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CN	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ OMe	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ OMe	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CCH	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CO ₂ Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br

	Me	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CCH	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CCH	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	CH ₂ CCH	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>cic</i> -Pr	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>cic</i> -Pr	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>iso</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>sec</i> -Bu	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>sec</i> -Bu	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>cic</i> -Bu	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>cic</i> -Bu	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CF ₃	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CF ₃	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CN	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CN	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	CH ₂ CN	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH ₂ OMe	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH ₂ OMe	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ OMe	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH ₂ SMe	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH ₂ SMe	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CO ₂ Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CO ₂ Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	2-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	3-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	4-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ NHCH ₂ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ NMeCH ₂ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(<i>iso</i> -Pr)CH ₂ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(CHO)CH ₂ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(Ac)CH ₂ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(CO ₂ Me)CH ₂ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(CO ₂ Et)CH ₂ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>n</i> -Pr	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>n</i> -Pr	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	NH ₂	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Bu	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Bu	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃

ES 2 380 272 T3

	<i>terc</i> -Bu	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>terc</i> -Bu	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CF ₃	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CN	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ OMe	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ OMe	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CCH	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CCH	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	CH ₂ CCH	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>cic</i> -Pr	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>cic</i> -Pr	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>sec</i> -Bu	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>sec</i> -Bu	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>cic</i> -Bu	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>cic</i> -Bu	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CF ₃	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CF ₃	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CN	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CN	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	CH ₂ CN	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH ₂ OMe	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH ₂ OMe	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ OMe	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH ₂ SMe	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH ₂ SMe	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CO ₂ Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CO ₂ Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ NHCH ₂ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ NMeCH ₂ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(<i>iso</i> -Pr)CH ₂ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃

	-CH ₂ N(CHO)CH ₂ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃	
	-CH ₂ N(Ac)CH ₂ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃	
	-CH ₂ N(CO ₂ Me)CH ₂ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃	
	-CH ₂ N(CO ₂ Et)CH ₂ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃	
	H	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>n</i> -Pr	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>n</i> -Pr	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Bu	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Bu	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>terc</i> -Bu	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>terc</i> -Bu	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CF ₃	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CN	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ OMe	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ OMe	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CCH	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CCH	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	CH ₂ CCH	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>cic</i> -Pr	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>cic</i> -Pr	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>sec</i> -Bu	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>sec</i> -Bu	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>cic</i> -Bu	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>cic</i> -Bu	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CF ₃	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CH ₂ CF ₃	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CH ₂ CN	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl

ES 2 380 272 T3

	Et	CH ₂ CN	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CN	CH ₂ CN	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH ₂ OMe	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH ₂ OMe	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ OMe	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH ₂ SMe	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH ₂ SMe	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	CO ₂ Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	CO ₂ Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	2-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	3-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	4-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ NHCH ₂ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ NMeCH ₂ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(<i>iso</i> -Pr)CH ₂ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(CHO)CH ₂ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(Ac)CH ₂ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(CO ₂ Me)CH ₂ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-CH ₂ N(CO ₂ Et)CH ₂ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>n</i> -Pr	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>n</i> -Pr	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>iso</i> -Bu	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Bu	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>terc</i> -Bu	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>terc</i> -Bu	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CF ₃	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CN	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ OMe	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ OMe	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CCH	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CCH	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	CH ₂ CCH	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>cic</i> -Pr	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>cic</i> -Pr	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br

ES 2 380 272 T3

	<i>iso</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>sec</i> -Bu	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>sec</i> -Bu	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>cis</i> -Bu	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>cis</i> -Bu	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ - <i>cis</i> -Pr	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ - <i>cis</i> -Pr	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ - <i>cis</i> -Bu	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ - <i>cis</i> -Bu	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CF ₃	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CF ₃	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CH ₂ CN	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CH ₂ CN	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CN	CH ₂ CN	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH ₂ OMe	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH ₂ OMe	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ OMe	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH ₂ SMe	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH ₂ SMe	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	CO ₂ Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	CO ₂ Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	2-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	3-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	4-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ NHCH ₂ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ NMeCH ₂ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(<i>iso</i> -Pr)CH ₂ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(CHO)CH ₂ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(Ac)CH ₂ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(CO ₂ Me)CH ₂ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-CH ₂ N(CO ₂ Et)CH ₂ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>n</i> -Pr	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>n</i> -Pr	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Bu	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Bu	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>terc</i> -Bu	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>terc</i> -Bu	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CF ₃	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CN	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ OMe	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ OMe	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃

ES 2 380 272 T3

	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CCH	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CCH	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	CH ₂ CCH	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>cic</i> -Pr	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>cic</i> -Pr	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>sec</i> -Bu	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>sec</i> -Bu	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>cic</i> -Bu	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>cic</i> -Bu	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Pr	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ - <i>cic</i> -Bu	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CF ₃	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CF ₃	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CH ₂ CN	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CH ₂ CN	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CN	CH ₂ CN	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH ₂ OMe	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH ₂ OMe	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ OMe	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH ₂ SMe	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH ₂ SMe	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	CO ₂ Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	CO ₂ Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ NHCH ₂ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ NMeCH ₂ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(<i>iso</i> -Pr)CH ₂ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(CHO)CH ₂ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(Ac)CH ₂ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(CO ₂ Me)CH ₂ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-CH ₂ N(CO ₂ Et)CH ₂ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	H	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	H	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	Me	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	Me	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	H	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	Et	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl

ES 2 380 272 T3

	Et	Et	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CO ₂ Me	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Me	Et	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	Et	Me	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	2-piridinilo	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	3-piridinilo	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	4-piridinilo	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Cl
	H	H	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	H	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	Me	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	Me	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	H	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	Et	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	Et	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CO ₂ Me	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Me	Et	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	Et	Me	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	CH ₂ CCH	H	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	CH ₂ CCH	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	2-piridinilo	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	3-piridinilo	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	4-piridinilo	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	Br
	H	H	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	H	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	Me	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	Me	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	H	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	Et	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	Et	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Me	Et	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	Et	Me	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	SMe	3-cloro-2-piridinilo	N	CF ₃
	H	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Me	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Me	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl

ES 2 380 272 T3

	Et	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Et	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	CO ₂ Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Me	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Et	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	CH ₂ CCH	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	CH ₂ CCH	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	2-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	3-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	4-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Me	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Me	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Et	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Et	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	CO ₂ Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Me	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Et	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	CH ₂ CCH	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	CH ₂ CCH	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	2-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	3-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	4-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Me	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Me	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Et	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Et	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Me	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Et	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	2-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	3-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	4-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Me	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl

ES 2 380 272 T3

	H	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Me	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Et	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Et	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	CO ₂ Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Me	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	Et	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	CH ₂ CCH	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	CH ₂ CCH	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	2-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	3-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	4-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Cl
	H	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Me	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Me	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Et	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Et	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	CO ₂ Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Me	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Et	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	CH ₂ CCH	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	CH ₂ CCH	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	<i>iso</i> -Pr	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	<i>iso</i> -Pr	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	2-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	3-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	4-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
		-(CH ₂) ₃ -	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
		-(CH ₂) ₄ -	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Me	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Me	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Et	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Et	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	CO ₂ Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Me	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Et	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	CH ₂ CCH	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	CH ₂ CCH	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	2-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	3-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	4-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H

ES 2 380 272 T3

	H	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Me	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Me	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Et	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Et	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Me	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Et	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	<i>iso</i> -Pr	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	<i>iso</i> -Pr	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	2-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	3-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	4-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Me	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Me	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Et	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Et	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	CO ₂ Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Me	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	Et	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	CH ₂ CCH	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	CH ₂ CCH	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	<i>iso</i> -Pr	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	<i>iso</i> -Pr	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	2-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	3-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	4-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	H
	H	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Me	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Me	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Et	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Et	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	CO ₂ Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Me	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Et	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	CH ₂ CCH	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	CH ₂ CCH	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	2-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	3-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	4-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl

ES 2 380 272 T3

	-(CH ₂) ₃ -		H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	-(CH ₂) ₄ -		H	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Me	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Me	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Et	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Et	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	CO ₂ Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Me	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Et	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	CH ₂ CCH	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	CH ₂ CCH	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	2-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	3-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	4-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	-(CH ₂) ₃ -		OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	-(CH ₂) ₄ -		OMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Me	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Me	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Et	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Et	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Me	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Et	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	2-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	3-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	4-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	-(CH ₂) ₃ -		NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	-(CH ₂) ₄ -		NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Me	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Me	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Et	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Et	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	CO ₂ Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Me	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	Et	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	CH ₂ CCH	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	CH ₂ CCH	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	2-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl

ES 2 380 272 T3

	H	3-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	4-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CCl	Cl
	H	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Me	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Me	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Et	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Et	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	CO ₂ Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Me	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Et	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	CH ₂ CCH	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	CH ₂ CCH	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	2-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	3-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	4-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
		-(CH ₂) ₃ -	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
		-(CH ₂) ₄ -	H	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Me	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Me	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Et	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Et	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	CO ₂ Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Me	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Et	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	CH ₂ CCH	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	CH ₂ CCH	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	2-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	3-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	4-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Me	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Me	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Et	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Et	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Me	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Et	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br

ES 2 380 272 T3

	H	<i>iso</i> -Pr	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	2-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	3-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	4-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Me	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Me	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Et	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Et	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	CO ₂ Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Me	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	Et	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	CH ₂ CCH	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	CH ₂ CCH	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	2-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	3-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	4-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CH	Br
	H	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Me	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Me	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Et	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Et	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	CO ₂ Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Me	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Et	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	CH ₂ CCH	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	CH ₂ CCH	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	<i>iso</i> -Pr	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	<i>iso</i> -Pr	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	2-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	3-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	4-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
		-(CH ₂) ₃ -	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
		-(CH ₂) ₄ -	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Me	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Me	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Et	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Et	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	CO ₂ Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Me	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Et	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	CH ₂ CCH	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H

ES 2 380 272 T3

	H	CH ₂ CCH	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	2-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	3-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	4-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Me	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Me	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Et	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Et	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Me	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Et	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	<i>iso</i> -Pr	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	<i>iso</i> -Pr	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	2-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	3-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	4-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Me	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Me	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Et	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Et	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	CO ₂ Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Me	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	Et	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	CH ₂ CCH	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	CH ₂ CCH	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	<i>iso</i> -Pr	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	<i>iso</i> -Pr	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	2-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	3-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	4-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	H
	H	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Me	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Me	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Et	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Et	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	CO ₂ Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Me	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Et	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br

ES 2 380 272 T3

	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	CH ₂ CCH	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	CH ₂ CCH	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	2-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	3-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	4-piridinilo	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
		-(CH ₂) ₃ -	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
		-(CH ₂) ₄ -	H	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Me	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Me	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Et	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Et	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	CO ₂ Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Me	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Et	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	CH ₂ CCH	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	CH ₂ CCH	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	2-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	3-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	4-piridinilo	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Me	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Me	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Et	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Et	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Me	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Et	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	2-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	3-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	4-piridinilo	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Me	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Me	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Et	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Et	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	CO ₂ Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	Me	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br

ES 2 380 272 T3

	Et	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	CH ₂ CCH	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	CH ₂ CCH	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	2-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	3-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	4-piridinilo	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CBr	Br
	H	H	H	2-clorofenilo	N	Cl
	Me	H	H	2-clorofenilo	N	Cl
	H	Me	H	2-clorofenilo	N	Cl
	Me	Me	H	2-clorofenilo	N	Cl
	Et	H	H	2-clorofenilo	N	Cl
	H	Et	H	2-clorofenilo	N	Cl
	Et	Et	H	2-clorofenilo	N	Cl
	H	CO ₂ Me	H	2-clorofenilo	N	Cl
	Me	Et	H	2-clorofenilo	N	Cl
	Et	Me	H	2-clorofenilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	2-clorofenilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	2-clorofenilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	H	2-clorofenilo	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	H	2-clorofenilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	H	2-clorofenilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	H	2-clorofenilo	N	Cl
	H	2-piridinilo	H	2-clorofenilo	N	Cl
	H	3-piridinilo	H	2-clorofenilo	N	Cl
	H	4-piridinilo	H	2-clorofenilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	H	2-clorofenilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	H	2-clorofenilo	N	Cl
	H	H	H	2-clorofenilo	N	Br
	Me	H	H	2-clorofenilo	N	Br
	H	Me	H	2-clorofenilo	N	Br
	Me	Me	H	2-clorofenilo	N	Br
	Et	H	H	2-clorofenilo	N	Br
	H	Et	H	2-clorofenilo	N	Br
	Et	Et	H	2-clorofenilo	N	Br
	H	CO ₂ Me	H	2-clorofenilo	N	Br
	Me	Et	H	2-clorofenilo	N	Br
	Et	Me	H	2-clorofenilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	2-clorofenilo	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	2-clorofenilo	N	Br
	CH ₂ CCH	H	H	2-clorofenilo	N	Br
	H	CH ₂ CCH	H	2-clorofenilo	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	H	2-clorofenilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	H	2-clorofenilo	N	Br
	H	2-piridinilo	H	2-clorofenilo	N	Br
	H	3-piridinilo	H	2-clorofenilo	N	Br
	H	4-piridinilo	H	2-clorofenilo	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	H	2-clorofenilo	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	H	2-clorofenilo	N	Br
	H	H	H	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Me	H	H	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	Me	H	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Me	Me	H	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Et	H	H	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	Et	H	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Et	Et	H	2-clorofenilo	N	CF ₃

ES 2 380 272 T3

	H	CO ₂ Me	H	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Me	Et	H	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Et	Me	H	2-clorofenilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	2-clorofenilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	H	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	H	2-clorofenilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	H	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	H	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	H	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	H	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	H	2-clorofenilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	H	2-clorofenilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	H	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	H	OMe	2-clorofenilo	N	Cl
	Me	H	OMe	2-clorofenilo	N	Cl
	H	Me	OMe	2-clorofenilo	N	Cl
	Me	Me	OMe	2-clorofenilo	N	Cl
	Et	H	OMe	2-clorofenilo	N	Cl
	H	Et	OMe	2-clorofenilo	N	Cl
	Et	Et	OMe	2-clorofenilo	N	Cl
	H	CO ₂ Me	OMe	2-clorofenilo	N	Cl
	Me	Et	OMe	2-clorofenilo	N	Cl
	Et	Me	OMe	2-clorofenilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	2-clorofenilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	2-clorofenilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	OMe	2-clorofenilo	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	OMe	2-clorofenilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	2-clorofenilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	2-clorofenilo	N	Cl
	H	2-piridinilo	OMe	2-clorofenilo	N	Cl
	H	3-piridinilo	OMe	2-clorofenilo	N	Cl
	H	4-piridinilo	OMe	2-clorofenilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	2-clorofenilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	2-clorofenilo	N	Cl
	H	H	OMe	2-clorofenilo	N	Br
	Me	H	OMe	2-clorofenilo	N	Br
	H	Me	OMe	2-clorofenilo	N	Br
	Me	Me	OMe	2-clorofenilo	N	Br
	Et	H	OMe	2-clorofenilo	N	Br
	H	Et	OMe	2-clorofenilo	N	Br
	Et	Et	OMe	2-clorofenilo	N	Br
	H	CO ₂ Me	OMe	2-clorofenilo	N	Br
	Me	Et	OMe	2-clorofenilo	N	Br
	Et	Me	OMe	2-clorofenilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	2-clorofenilo	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	2-clorofenilo	N	Br
	CH ₂ CCH	H	OMe	2-clorofenilo	N	Br
	H	CH ₂ CCH	OMe	2-clorofenilo	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	2-clorofenilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	2-clorofenilo	N	Br
	H	2-piridinilo	OMe	2-clorofenilo	N	Br
	H	3-piridinilo	OMe	2-clorofenilo	N	Br
	H	4-piridinilo	OMe	2-clorofenilo	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	2-clorofenilo	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	2-clorofenilo	N	Br
	H	H	OMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Me	H	OMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	Me	OMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Me	Me	OMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Et	H	OMe	2-clorofenilo	N	CF ₃

ES 2 380 272 T3

	H	Et	OMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Et	Et	OMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	OMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Me	Et	OMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Et	Me	OMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	OMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	OMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	OMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	OMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	OMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	H	NHMe	2-clorofenilo	N	Cl
	Me	H	NHMe	2-clorofenilo	N	Cl
	H	Me	NHMe	2-clorofenilo	N	Cl
	Me	Me	NHMe	2-clorofenilo	N	Cl
	Et	H	NHMe	2-clorofenilo	N	Cl
	H	Et	NHMe	2-clorofenilo	N	Cl
	Et	Et	NHMe	2-clorofenilo	N	Cl
	H	CO ₂ Me	NHMe	2-clorofenilo	N	Cl
	Me	Et	NHMe	2-clorofenilo	N	Cl
	Et	Me	NHMe	2-clorofenilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	2-clorofenilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	2-clorofenilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	NHMe	2-clorofenilo	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	NHMe	2-clorofenilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	NHMe	2-clorofenilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	NHMe	2-clorofenilo	N	Cl
	H	2-piridinilo	NHMe	2-clorofenilo	N	Cl
	H	3-piridinilo	NHMe	2-clorofenilo	N	Cl
	H	4-piridinilo	NHMe	2-clorofenilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	2-clorofenilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	2-clorofenilo	N	Cl
	H	H	NHMe	2-clorofenilo	N	Br
	Me	H	NHMe	2-clorofenilo	N	Br
	H	Me	NHMe	2-clorofenilo	N	Br
	Me	Me	NHMe	2-clorofenilo	N	Br
	Et	H	NHMe	2-clorofenilo	N	Br
	H	Et	NHMe	2-clorofenilo	N	Br
	Et	Et	NHMe	2-clorofenilo	N	Br
	H	CO ₂ Me	NHMe	2-clorofenilo	N	Br
	Me	Et	NHMe	2-clorofenilo	N	Br
	Et	Me	NHMe	2-clorofenilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	2-clorofenilo	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	2-clorofenilo	N	Br
	CH ₂ CCH	H	NHMe	2-clorofenilo	N	Br
	H	CH ₂ CCH	NHMe	2-clorofenilo	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	NHMe	2-clorofenilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	NHMe	2-clorofenilo	N	Br
	H	2-piridinilo	NHMe	2-clorofenilo	N	Br
	H	3-piridinilo	NHMe	2-clorofenilo	N	Br
	H	4-piridinilo	NHMe	2-clorofenilo	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	2-clorofenilo	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	2-clorofenilo	N	Br
	H	H	NHMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Me	H	NHMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	Me	NHMe	2-clorofenilo	N	CF ₃

ES 2 380 272 T3

	Me	Me	NHMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Et	H	NHMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	Et	NHMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Et	Et	NHMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	NHMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Me	Et	NHMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Et	Me	NHMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	NHMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	NHMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	NHMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	NHMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	NHMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	NHMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	NHMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	H	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Cl
	Me	H	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Cl
	H	Me	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Cl
	Me	Me	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Cl
	Et	H	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Cl
	H	Et	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Cl
	Et	Et	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Cl
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Cl
	Me	Et	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Cl
	Et	Me	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Cl
	H	2-piridinilo	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Cl
	H	3-piridinilo	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Cl
	H	4-piridinilo	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Cl
	H	H	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Br
	Me	H	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Br
	H	Me	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Br
	Me	Me	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Br
	Et	H	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Br
	H	Et	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Br
	Et	Et	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Br
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Br
	Me	Et	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Br
	Et	Me	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Br
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Br
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Br
	H	2-piridinilo	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Br
	H	3-piridinilo	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Br
	H	4-piridinilo	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	2-clorofenilo	N	Br
	H	H	NMe ₂	2-clorofenilo	N	CF ₃

ES 2 380 272 T3

	Me	H	NMe ₂	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	Me	NMe ₂	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Me	Me	NMe ₂	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Et	H	NMe ₂	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	Et	NMe ₂	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Et	Et	NMe ₂	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Me	Et	NMe ₂	2-clorofenilo	N	CF ₃
	Et	Me	NMe ₂	2-clorofenilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	2-clorofenilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	2-clorofenilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	NMe ₂	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	NMe ₂	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	NMe ₂	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	NMe ₂	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	NMe ₂	2-clorofenilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	2-clorofenilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	2-clorofenilo	N	CF ₃
	H	H	H	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Me	H	H	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	Me	H	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Me	Me	H	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Et	H	H	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	Et	H	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Et	Et	H	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	CO ₂ Me	H	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Me	Et	H	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Et	Me	H	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	H	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	H	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	H	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	H	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	2-piridinilo	H	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	3-piridinilo	H	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	4-piridinilo	H	2,6-diclorofenilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	H	2,6-diclorofenilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	H	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	H	H	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Me	H	H	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	Me	H	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Me	Me	H	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Et	H	H	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	Et	H	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Et	Et	H	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	CO ₂ Me	H	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Me	Et	H	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Et	Me	H	2,6-diclorofenilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	2,6-diclorofenilo	N	Br
	CH ₂ CCH	H	H	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	CH ₂ CCH	H	2,6-diclorofenilo	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	H	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	H	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	2-piridinilo	H	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	3-piridinilo	H	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	4-piridinilo	H	2,6-diclorofenilo	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	H	2,6-diclorofenilo	N	Br

		-(CH ₂) ₄ -	H	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	H	H	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Me	H	H	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	Me	H	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Me	Me	H	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Et	H	H	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	Et	H	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Et	Et	H	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	H	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Me	Et	H	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Et	Me	H	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	H	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	H	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	H	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	H	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	H	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	H	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	H	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	H	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	H	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	H	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Me	H	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	Me	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Me	Me	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Et	H	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	Et	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Et	Et	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	CO ₂ Me	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Me	Et	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Et	Me	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	2-piridinilo	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	3-piridinilo	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	4-piridinilo	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	H	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Me	H	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	Me	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Me	Me	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Et	H	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	Et	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Et	Et	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	CO ₂ Me	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Me	Et	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Et	Me	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	CH ₂ CCH	H	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	CH ₂ CCH	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	2-piridinilo	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	3-piridinilo	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Br

ES 2 380 272 T3

	H	4-piridinilo	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	H	OMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Me	H	OMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	Me	OMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Me	Me	OMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Et	H	OMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	Et	OMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Et	Et	OMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	OMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Me	Et	OMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Et	Me	OMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	OMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	OMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	OMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	OMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	OMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	H	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Me	H	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	Me	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Me	Me	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Et	H	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	Et	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Et	Et	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	CO ₂ Me	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Me	Et	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Et	Me	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	2-piridinilo	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	3-piridinilo	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	4-piridinilo	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	H	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Me	H	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	Me	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Me	Me	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Et	H	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	Et	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Et	Et	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	CO ₂ Me	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Me	Et	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Et	Me	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	CH ₂ CCH	H	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	CH ₂ CCH	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Br

ES 2 380 272 T3

	H	2-piridinilo	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	3-piridinilo	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	4-piridinilo	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	H	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Me	H	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	Me	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Me	Me	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Et	H	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	Et	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Et	Et	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Me	Et	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Et	Me	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	H	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Me	H	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	Me	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Me	Me	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Et	H	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	Et	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Et	Et	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Me	Et	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	Et	Me	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	2-piridinilo	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	3-piridinilo	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	4-piridinilo	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Cl
	H	H	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Me	H	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	Me	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Me	Me	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Et	H	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	Et	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Et	Et	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Me	Et	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Br
	Et	Me	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Br
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Br

ES 2 380 272 T3

	<i>iso</i> -Pr	H	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	2-piridinilo	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	3-piridinilo	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	4-piridinilo	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	Br
	H	H	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Me	H	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	Me	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Me	Me	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Et	H	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	Et	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Et	Et	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Me	Et	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	Et	Me	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	2,6-diclorofenilo	N	CF ₃
	H	H	H	Me	N	Cl
	Me	H	H	Me	N	Cl
	H	Me	H	Me	N	Cl
	Me	Me	H	Me	N	Cl
	Et	H	H	Me	N	Cl
	H	Et	H	Me	N	Cl
	Et	Et	H	Me	N	Cl
	H	CO ₂ Me	H	Me	N	Cl
	Me	Et	H	Me	N	Cl
	Et	Me	H	Me	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	Me	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	Me	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	H	Me	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	H	Me	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	H	Me	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	H	Me	N	Cl
	H	2-piridinilo	H	Me	N	Cl
	H	3-piridinilo	H	Me	N	Cl
	H	4-piridinilo	H	Me	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	H	Me	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	H	Me	N	Cl
	H	H	H	Me	N	Br
	Me	H	H	Me	N	Br
	H	Me	H	Me	N	Br
	Me	Me	H	Me	N	Br
	Et	H	H	Me	N	Br
	H	Et	H	Me	N	Br
	Et	Et	H	Me	N	Br
	H	CO ₂ Me	H	Me	N	Br
	Me	Et	H	Me	N	Br
	Et	Me	H	Me	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	Me	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	Me	N	Br

ES 2 380 272 T3

	CH ₂ CCH	H	H	Me	N	Br
	H	CH ₂ CCH	H	Me	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	H	Me	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	H	Me	N	Br
	H	2-piridinilo	H	Me	N	Br
	H	3-piridinilo	H	Me	N	Br
	H	4-piridinilo	H	Me	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	H	Me	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	H	Me	N	Br
	H	H	H	Me	N	CF ₃
	Me	H	H	Me	N	CF ₃
	H	Me	H	Me	N	CF ₃
	Me	Me	H	Me	N	CF ₃
	Et	H	H	Me	N	CF ₃
	H	Et	H	Me	N	CF ₃
	Et	Et	H	Me	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	H	Me	N	CF ₃
	Me	Et	H	Me	N	CF ₃
	Et	Me	H	Me	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	Me	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	Me	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	H	Me	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	H	Me	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	H	Me	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	H	Me	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	H	Me	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	H	Me	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	H	Me	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	H	Me	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	H	Me	N	CF ₃
	H	H	OMe	Me	N	Cl
	Me	H	OMe	Me	N	Cl
	H	Me	OMe	Me	N	Cl
	Me	Me	OMe	Me	N	Cl
	Et	H	OMe	Me	N	Cl
	H	Et	OMe	Me	N	Cl
	Et	Et	OMe	Me	N	Cl
	H	CO ₂ Me	OMe	Me	N	Cl
	Me	Et	OMe	Me	N	Cl
	Et	Me	OMe	Me	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	Me	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	Me	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	OMe	Me	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	OMe	Me	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	Me	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	Me	N	Cl
	H	2-piridinilo	OMe	Me	N	Cl
	H	3-piridinilo	OMe	Me	N	Cl
	H	4-piridinilo	OMe	Me	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	Me	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	Me	N	Cl
	H	H	OMe	Me	N	Br
	Me	H	OMe	Me	N	Br
	H	Me	OMe	Me	N	Br
	Me	Me	OMe	Me	N	Br
	Et	H	OMe	Me	N	Br
	H	Et	OMe	Me	N	Br
	Et	Et	OMe	Me	N	Br
	H	CO ₂ Me	OMe	Me	N	Br
	Me	Et	OMe	Me	N	Br
	Et	Me	OMe	Me	N	Br

	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	Me	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	Me	N	Br
	CH ₂ CCH	H	OMe	Me	N	Br
	H	CH ₂ CCH	OMe	Me	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	Me	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	Me	N	Br
	H	2-piridinilo	OMe	Me	N	Br
	H	3-piridinilo	OMe	Me	N	Br
	H	4-piridinilo	OMe	Me	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	Me	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	Me	N	Br
	H	H	OMe	Me	N	CF ₃
	Me	H	OMe	Me	N	CF ₃
	H	Me	OMe	Me	N	CF ₃
	Me	Me	OMe	Me	N	CF ₃
	Et	H	OMe	Me	N	CF ₃
	H	Et	OMe	Me	N	CF ₃
	Et	Et	OMe	Me	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	OMe	Me	N	CF ₃
	Me	Et	OMe	Me	N	CF ₃
	Et	Me	OMe	Me	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	Me	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	Me	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	OMe	Me	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	OMe	Me	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	Me	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	Me	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	OMe	Me	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	OMe	Me	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	OMe	Me	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	Me	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	Me	N	CF ₃
	H	H	NHMe	Me	N	Cl
	Me	H	NHMe	Me	N	Cl
	H	Me	NHMe	Me	N	Cl
	Me	Me	NHMe	Me	N	Cl
	Et	H	NHMe	Me	N	Cl
	H	Et	NHMe	Me	N	Cl
	Et	Et	NHMe	Me	N	Cl
	H	CO ₂ Me	NHMe	Me	N	Cl
	Me	Et	NHMe	Me	N	Cl
	Et	Me	NHMe	Me	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	Me	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	Me	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	NHMe	Me	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	NHMe	Me	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	NHMe	Me	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	NHMe	Me	N	Cl
	H	2-piridinilo	NHMe	Me	N	Cl
	H	3-piridinilo	NHMe	Me	N	Cl
	H	4-piridinilo	NHMe	Me	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	Me	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	Me	N	Cl
	H	H	NHMe	Me	N	Br
	Me	H	NHMe	Me	N	Br
	H	Me	NHMe	Me	N	Br
	Me	Me	NHMe	Me	N	Br
	Et	H	NHMe	Me	N	Br
	H	Et	NHMe	Me	N	Br
	Et	Et	NHMe	Me	N	Br
	H	CO ₂ Me	NHMe	Me	N	Br

ES 2 380 272 T3

	Me	Et	NHMe	Me	N	Br
	Et	Me	NHMe	Me	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	Me	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	Me	N	Br
	CH ₂ CCH	H	NHMe	Me	N	Br
	H	CH ₂ CCH	NHMe	Me	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	NHMe	Me	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	NHMe	Me	N	Br
	H	2-piridinilo	NHMe	Me	N	Br
	H	3-piridinilo	NHMe	Me	N	Br
	H	4-piridinilo	NHMe	Me	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	Me	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	Me	N	Br
	H	H	NHMe	Me	N	CF ₃
	Me	H	NHMe	Me	N	CF ₃
	H	Me	NHMe	Me	N	CF ₃
	Me	Me	NHMe	Me	N	CF ₃
	Et	H	NHMe	Me	N	CF ₃
	H	Et	NHMe	Me	N	CF ₃
	Et	Et	NHMe	Me	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	NHMe	Me	N	CF ₃
	Me	Et	NHMe	Me	N	CF ₃
	Et	Me	NHMe	Me	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	Me	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	Me	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	NHMe	Me	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	NHMe	Me	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	NHMe	Me	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	NHMe	Me	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	NHMe	Me	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	NHMe	Me	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	NHMe	Me	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	Me	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	Me	N	CF ₃
	H	H	NMe ₂	Me	N	Cl
	Me	H	NMe ₂	Me	N	Cl
	H	Me	NMe ₂	Me	N	Cl
	Me	Me	NMe ₂	Me	N	Cl
	Et	H	NMe ₂	Me	N	Cl
	H	Et	NMe ₂	Me	N	Cl
	Et	Et	NMe ₂	Me	N	Cl
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	Me	N	Cl
	Me	Et	NMe ₂	Me	N	Cl
	Et	Me	NMe ₂	Me	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	Me	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	Me	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	Me	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	Me	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	NMe ₂	Me	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	NMe ₂	Me	N	Cl
	H	2-piridinilo	NMe ₂	Me	N	Cl
	H	3-piridinilo	NMe ₂	Me	N	Cl
	H	4-piridinilo	NMe ₂	Me	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	Me	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	Me	N	Cl
	H	H	NMe ₂	Me	N	Br
	Me	H	NMe ₂	Me	N	Br
	H	Me	NMe ₂	Me	N	Br
	Me	Me	NMe ₂	Me	N	Br
	Et	H	NMe ₂	Me	N	Br
	H	Et	NMe ₂	Me	N	Br

ES 2 380 272 T3

	Et	Et	NMe ₂	Me	N	Br
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	Me	N	Br
	Me	Et	NMe ₂	Me	N	Br
	Et	Me	NMe ₂	Me	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	Me	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	Me	N	Br
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	Me	N	Br
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	Me	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	NMe ₂	Me	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	NMe ₂	Me	N	Br
	H	2-piridinilo	NMe ₂	Me	N	Br
	H	3-piridinilo	NMe ₂	Me	N	Br
	H	4-piridinilo	NMe ₂	Me	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	Me	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	Me	N	Br
	H	H	NMe ₂	Me	N	CF ₃
	Me	H	NMe ₂	Me	N	CF ₃
	H	Me	NMe ₂	Me	N	CF ₃
	Me	Me	NMe ₂	Me	N	CF ₃
	Et	H	NMe ₂	Me	N	CF ₃
	H	Et	NMe ₂	Me	N	CF ₃
	Et	Et	NMe ₂	Me	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	Me	N	CF ₃
	Me	Et	NMe ₂	Me	N	CF ₃
	Et	Me	NMe ₂	Me	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	Me	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	Me	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	Me	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	Me	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	NMe ₂	Me	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	NMe ₂	Me	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	NMe ₂	Me	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	NMe ₂	Me	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	NMe ₂	Me	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	Me	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	Me	N	CF ₃
	H	H	H	Et	N	Cl
	Me	H	H	Et	N	Cl
	H	Me	H	Et	N	Cl
	Me	Me	H	Et	N	Cl
	Et	H	H	Et	N	Cl
	H	Et	H	Et	N	Cl
	Et	Et	H	Et	N	Cl
	H	CO ₂ Me	H	Et	N	Cl
	Me	Et	H	Et	N	Cl
	Et	Me	H	Et	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	Et	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	Et	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	H	Et	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	H	Et	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	H	Et	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	H	Et	N	Cl
	H	2-piridinilo	H	Et	N	Cl
	H	3-piridinilo	H	Et	N	Cl
	H	4-piridinilo	H	Et	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	H	Et	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	H	Et	N	Cl
	H	H	H	Et	N	Br
	Me	H	H	Et	N	Br
	H	Me	H	Et	N	Br
	Me	Me	H	Et	N	Br

ES 2 380 272 T3

	Et	H	H	Et	N	Br
	H	Et	H	Et	N	Br
	Et	Et	H	Et	N	Br
	H	CO ₂ Me	H	Et	N	Br
	Me	Et	H	Et	N	Br
	Et	Me	H	Et	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	Et	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	Et	N	Br
	CH ₂ CCH	H	H	Et	N	Br
	H	CH ₂ CCH	H	Et	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	H	Et	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	H	Et	N	Br
	H	2-piridinilo	H	Et	N	Br
	H	3-piridinilo	H	Et	N	Br
	H	4-piridinilo	H	Et	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	H	Et	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	H	Et	N	Br
	H	H	H	Et	N	CF ₃
	Me	H	H	Et	N	CF ₃
	H	Me	H	Et	N	CF ₃
	Me	Me	H	Et	N	CF ₃
	Et	H	H	Et	N	CF ₃
	H	Et	H	Et	N	CF ₃
	Et	Et	H	Et	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	H	Et	N	CF ₃
	Me	Et	H	Et	N	CF ₃
	Et	Me	H	Et	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	Et	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	Et	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	H	Et	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	H	Et	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	H	Et	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	H	Et	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	H	Et	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	H	Et	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	H	Et	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	H	Et	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	H	Et	N	CF ₃
	H	H	OMe	Et	N	Cl
	Me	H	OMe	Et	N	Cl
	H	Me	OMe	Et	N	Cl
	Me	Me	OMe	Et	N	Cl
	Et	H	OMe	Et	N	Cl
	H	Et	OMe	Et	N	Cl
	Et	Et	OMe	Et	N	Cl
	H	CO ₂ Me	OMe	Et	N	Cl
	Me	Et	OMe	Et	N	Cl
	Et	Me	OMe	Et	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	Et	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	Et	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	OMe	Et	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	OMe	Et	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	Et	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	Et	N	Cl
	H	2-piridinilo	OMe	Et	N	Cl
	H	3-piridinilo	OMe	Et	N	Cl
	H	4-piridinilo	OMe	Et	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	Et	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	Et	N	Cl
	H	H	OMe	Et	N	Br
	Me	H	OMe	Et	N	Br

ES 2 380 272 T3

	H	Me	OMe	Et	N	Br
	Me	Me	OMe	Et	N	Br
	Et	H	OMe	Et	N	Br
	H	Et	OMe	Et	N	Br
	Et	Et	OMe	Et	N	Br
	H	CO ₂ Me	OMe	Et	N	Br
	Me	Et	OMe	Et	N	Br
	Et	Me	OMe	Et	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	Et	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	Et	N	Br
	CH ₂ CCH	H	OMe	Et	N	Br
	H	CH ₂ CCH	OMe	Et	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	Et	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	Et	N	Br
	H	2-piridinilo	OMe	Et	N	Br
	H	3-piridinilo	OMe	Et	N	Br
	H	4-piridinilo	OMe	Et	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	Et	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	Et	N	Br
	H	H	OMe	Et	N	CF ₃
	Me	H	OMe	Et	N	CF ₃
	H	Me	OMe	Et	N	CF ₃
	Me	Me	OMe	Et	N	CF ₃
	Et	H	OMe	Et	N	CF ₃
	H	Et	OMe	Et	N	CF ₃
	Et	Et	OMe	Et	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	OMe	Et	N	CF ₃
	Me	Et	OMe	Et	N	CF ₃
	Et	Me	OMe	Et	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	Et	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	Et	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	OMe	Et	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	OMe	Et	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	Et	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	Et	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	OMe	Et	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	OMe	Et	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	OMe	Et	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	Et	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	Et	N	CF ₃
	H	H	NHMe	Et	N	Cl
	Me	H	NHMe	Et	N	Cl
	H	Me	NHMe	Et	N	Cl
	Me	Me	NHMe	Et	N	Cl
	Et	H	NHMe	Et	N	Cl
	H	Et	NHMe	Et	N	Cl
	Et	Et	NHMe	Et	N	Cl
	H	CO ₂ Me	NHMe	Et	N	Cl
	Me	Et	NHMe	Et	N	Cl
	Et	Me	NHMe	Et	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	Et	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	Et	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	NHMe	Et	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	NHMe	Et	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	NHMe	Et	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	NHMe	Et	N	Cl
	H	2-piridinilo	NHMe	Et	N	Cl
	H	3-piridinilo	NHMe	Et	N	Cl
	H	4-piridinilo	NHMe	Et	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	Et	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	Et	N	Cl

ES 2 380 272 T3

	H	H	NHMe	Et	N	Br
	Me	H	NHMe	Et	N	Br
	H	Me	NHMe	Et	N	Br
	Me	Me	NHMe	Et	N	Br
	Et	H	NHMe	Et	N	Br
	H	Et	NHMe	Et	N	Br
	Et	Et	NHMe	Et	N	Br
	H	CO ₂ Me	NHMe	Et	N	Br
	Me	Et	NHMe	Et	N	Br
	Et	Me	NHMe	Et	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	Et	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	Et	N	Br
	CH ₂ CCH	H	NHMe	Et	N	Br
	H	CH ₂ CCH	NHMe	Et	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	NHMe	Et	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	NHMe	Et	N	Br
	H	2-piridinilo	NHMe	Et	N	Br
	H	3-piridinilo	NHMe	Et	N	Br
	H	4-piridinilo	NHMe	Et	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	Et	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	Et	N	Br
	H	H	NHMe	Et	N	CF ₃
	Me	H	NHMe	Et	N	CF ₃
	H	Me	NHMe	Et	N	CF ₃
	Me	Me	NHMe	Et	N	CF ₃
	Et	H	NHMe	Et	N	CF ₃
	H	Et	NHMe	Et	N	CF ₃
	Et	Et	NHMe	Et	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	NHMe	Et	N	CF ₃
	Me	Et	NHMe	Et	N	CF ₃
	Et	Me	NHMe	Et	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	Et	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	Et	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	NHMe	Et	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	NHMe	Et	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	NHMe	Et	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	NHMe	Et	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	NHMe	Et	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	NHMe	Et	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	NHMe	Et	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	Et	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	Et	N	CF ₃
	H	H	NMe ₂	Et	N	Cl
	Me	H	NMe ₂	Et	N	Cl
	H	Me	NMe ₂	Et	N	Cl
	Me	Me	NMe ₂	Et	N	Cl
	Et	H	NMe ₂	Et	N	Cl
	H	Et	NMe ₂	Et	N	Cl
	Et	Et	NMe ₂	Et	N	Cl
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	Et	N	Cl
	Me	Et	NMe ₂	Et	N	Cl
	Et	Me	NMe ₂	Et	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	Et	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	Et	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	Et	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	Et	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	NMe ₂	Et	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	NMe ₂	Et	N	Cl
	H	2-piridinilo	NMe ₂	Et	N	Cl
	H	3-piridinilo	NMe ₂	Et	N	Cl
	H	4-piridinilo	NMe ₂	Et	N	Cl

ES 2 380 272 T3

		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	Et	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	Et	N	Cl
	H	H	NMe ₂	Et	N	Br
	Me	H	NMe ₂	Et	N	Br
	H	Me	NMe ₂	Et	N	Br
	Me	Me	NMe ₂	Et	N	Br
	Et	H	NMe ₂	Et	N	Br
	H	Et	NMe ₂	Et	N	Br
	Et	Et	NMe ₂	Et	N	Br
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	Et	N	Br
	Me	Et	NMe ₂	Et	N	Br
	Et	Me	NMe ₂	Et	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	Et	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	Et	N	Br
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	Et	N	Br
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	Et	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	NMe ₂	Et	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	NMe ₂	Et	N	Br
	H	2-piridinilo	NMe ₂	Et	N	Br
	H	3-piridinilo	NMe ₂	Et	N	Br
	H	4-piridinilo	NMe ₂	Et	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	Et	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	Et	N	Br
	H	H	NMe ₂	Et	N	CF ₃
	Me	H	NMe ₂	Et	N	CF ₃
	H	Me	NMe ₂	Et	N	CF ₃
	Me	Me	NMe ₂	Et	N	CF ₃
	Et	H	NMe ₂	Et	N	CF ₃
	H	Et	NMe ₂	Et	N	CF ₃
	Et	Et	NMe ₂	Et	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	Et	N	CF ₃
	Me	Et	NMe ₂	Et	N	CF ₃
	Et	Me	NMe ₂	Et	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	Et	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	Et	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	Et	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	Et	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	NMe ₂	Et	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	NMe ₂	Et	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	NMe ₂	Et	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	NMe ₂	Et	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	NMe ₂	Et	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	Et	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	Et	N	CF ₃
	H	H	H	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	Me	H	H	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	H	Me	H	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	Me	Me	H	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	Et	H	H	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	H	Et	H	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	Et	Et	H	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	H	CO ₂ Me	H	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	Me	Et	H	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	Et	Me	H	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	H	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	H	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	<i>iso</i> -Pr	H	H	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	H	<i>iso</i> -Pr	H	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	H	2-piridinilo	H	<i>iso</i> -Pr	N	Cl

ES 2 380 272 T3

	H	3-piridinilo	H	iso-Pr	N	Cl
	H	4-piridinilo	H	iso-Pr	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	H	iso-Pr	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	H	iso-Pr	N	Cl
	H	H	H	iso-Pr	N	Br
	Me	H	H	iso-Pr	N	Br
	H	Me	H	iso-Pr	N	Br
	Me	Me	H	iso-Pr	N	Br
	Et	H	H	iso-Pr	N	Br
	H	Et	H	iso-Pr	N	Br
	Et	Et	H	iso-Pr	N	Br
	H	CO ₂ Me	H	iso-Pr	N	Br
	Me	Et	H	iso-Pr	N	Br
	Et	Me	H	iso-Pr	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	iso-Pr	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	iso-Pr	N	Br
	CH ₂ CCH	H	H	iso-Pr	N	Br
	H	CH ₂ CCH	H	iso-Pr	N	Br
	iso-Pr	H	H	iso-Pr	N	Br
	H	iso-Pr	H	iso-Pr	N	Br
	H	2-piridinilo	H	iso-Pr	N	Br
	H	3-piridinilo	H	iso-Pr	N	Br
	H	4-piridinilo	H	iso-Pr	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	H	iso-Pr	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	H	iso-Pr	N	Br
	H	H	H	iso-Pr	N	CF ₃
	Me	H	H	iso-Pr	N	CF ₃
	H	Me	H	iso-Pr	N	CF ₃
	Me	Me	H	iso-Pr	N	CF ₃
	Et	H	H	iso-Pr	N	CF ₃
	H	Et	H	iso-Pr	N	CF ₃
	Et	Et	H	iso-Pr	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	H	iso-Pr	N	CF ₃
	Me	Et	H	iso-Pr	N	CF ₃
	Et	Me	H	iso-Pr	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	iso-Pr	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	iso-Pr	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	H	iso-Pr	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	H	iso-Pr	N	CF ₃
	iso-Pr	H	H	iso-Pr	N	CF ₃
	H	iso-Pr	H	iso-Pr	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	H	iso-Pr	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	H	iso-Pr	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	H	iso-Pr	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	H	iso-Pr	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	H	iso-Pr	N	CF ₃
	H	H	OMe	iso-Pr	N	Cl
	Me	H	OMe	iso-Pr	N	Cl
	H	Me	OMe	iso-Pr	N	Cl
	Me	Me	OMe	iso-Pr	N	Cl
	Et	H	OMe	iso-Pr	N	Cl
	H	Et	OMe	iso-Pr	N	Cl
	Et	Et	OMe	iso-Pr	N	Cl
	H	CO ₂ Me	OMe	iso-Pr	N	Cl
	Me	Et	OMe	iso-Pr	N	Cl
	Et	Me	OMe	iso-Pr	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	iso-Pr	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	iso-Pr	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	OMe	iso-Pr	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	OMe	iso-Pr	N	Cl
	iso-Pr	H	OMe	iso-Pr	N	Cl

ES 2 380 272 T3

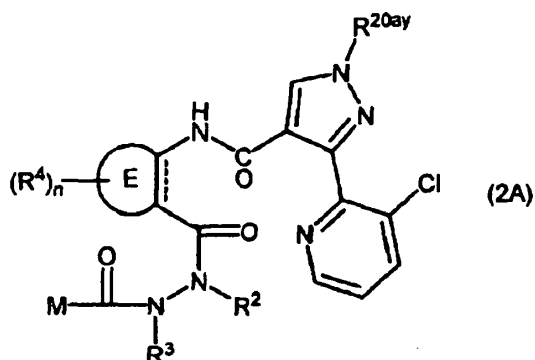
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	H	2-piridinilo	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	H	3-piridinilo	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	H	4-piridinilo	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	H	H	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Br
	Me	H	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Br
	H	Me	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Br
	Me	Me	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Br
	Et	H	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Br
	H	Et	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Br
	Et	Et	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Br
	H	CO ₂ Me	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Br
	Me	Et	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Br
	Et	Me	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Br
	CH ₂ CCH	H	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Br
	H	CH ₂ CCH	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Br
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Br
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Br
	H	2-piridinilo	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Br
	H	3-piridinilo	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Br
	H	4-piridinilo	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	Br
	H	H	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	CF ₃
	Me	H	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	CF ₃
	H	Me	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	CF ₃
	Me	Me	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	CF ₃
	Et	H	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	CF ₃
	H	Et	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	CF ₃
	Et	Et	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	CF ₃
	Me	Et	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	CF ₃
	Et	Me	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	CF ₃
	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	CF ₃
	H	<i>iso</i> -Pr	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	OMe	<i>iso</i> -Pr	N	CF ₃
	H	H	NHMe	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	Me	H	NHMe	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	H	Me	NHMe	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	Me	Me	NHMe	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	Et	H	NHMe	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	H	Et	NHMe	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	Et	Et	NHMe	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	H	CO ₂ Me	NHMe	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	Me	Et	NHMe	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	Et	Me	NHMe	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	<i>iso</i> -Pr	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	NHMe	<i>iso</i> -Pr	N	Cl

ES 2 380 272 T3

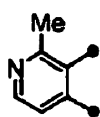
	H	CH ₂ CCH	NHMe	iso-Pr	N	Cl
	iso-Pr	H	NHMe	iso-Pr	N	Cl
	H	iso-Pr	NHMe	iso-Pr	N	Cl
	H	2-piridinilo	NHMe	iso-Pr	N	Cl
	H	3-piridinilo	NHMe	iso-Pr	N	Cl
	H	4-piridinilo	NHMe	iso-Pr	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	iso-Pr	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	iso-Pr	N	Cl
	H	H	NHMe	iso-Pr	N	Br
	Me	H	NHMe	iso-Pr	N	Br
	H	Me	NHMe	iso-Pr	N	Br
	Me	Me	NHMe	iso-Pr	N	Br
	Et	H	NHMe	iso-Pr	N	Br
	H	Et	NHMe	iso-Pr	N	Br
	Et	Et	NHMe	iso-Pr	N	Br
	H	CO ₂ Me	NHMe	iso-Pr	N	Br
	Me	Et	NHMe	iso-Pr	N	Br
	Et	Me	NHMe	iso-Pr	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	iso-Pr	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	iso-Pr	N	Br
	CH ₂ CCH	H	NHMe	iso-Pr	N	Br
	H	CH ₂ CCH	NHMe	iso-Pr	N	Br
	iso-Pr	H	NHMe	iso-Pr	N	Br
	H	iso-Pr	NHMe	iso-Pr	N	Br
	H	2-piridinilo	NHMe	iso-Pr	N	Br
	H	3-piridinilo	NHMe	iso-Pr	N	Br
	H	4-piridinilo	NHMe	iso-Pr	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	iso-Pr	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	iso-Pr	N	Br
	H	H	NHMe	iso-Pr	N	CF ₃
	Me	H	NHMe	iso-Pr	N	CF ₃
	H	Me	NHMe	iso-Pr	N	CF ₃
	Me	Me	NHMe	iso-Pr	N	CF ₃
	Et	H	NHMe	iso-Pr	N	CF ₃
	H	Et	NHMe	iso-Pr	N	CF ₃
	Et	Et	NHMe	iso-Pr	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	NHMe	iso-Pr	N	CF ₃
	Me	Et	NHMe	iso-Pr	N	CF ₃
	Et	Me	NHMe	iso-Pr	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NHMe	iso-Pr	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NHMe	iso-Pr	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	NHMe	iso-Pr	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	NHMe	iso-Pr	N	CF ₃
	iso-Pr	H	NHMe	iso-Pr	N	CF ₃
	H	iso-Pr	NHMe	iso-Pr	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	NHMe	iso-Pr	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	NHMe	iso-Pr	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	NHMe	iso-Pr	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	NHMe	iso-Pr	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	NHMe	iso-Pr	N	CF ₃
	H	H	NMe ₂	iso-Pr	N	Cl
	Me	H	NMe ₂	iso-Pr	N	Cl
	H	Me	NMe ₂	iso-Pr	N	Cl
	Me	Me	NMe ₂	iso-Pr	N	Cl
	Et	H	NMe ₂	iso-Pr	N	Cl
	H	Et	NMe ₂	iso-Pr	N	Cl
	Et	Et	NMe ₂	iso-Pr	N	Cl
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	iso-Pr	N	Cl
	Me	Et	NMe ₂	iso-Pr	N	Cl
	Et	Me	NMe ₂	iso-Pr	N	Cl
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	iso-Pr	N	Cl

ES 2 380 272 T3

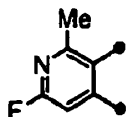
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	iso-Pr	N	Cl
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	iso-Pr	N	Cl
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	iso-Pr	N	Cl
	iso-Pr	H	NMe ₂	iso-Pr	N	Cl
	H	iso-Pr	NMe ₂	iso-Pr	N	Cl
	H	2-piridinilo	NMe ₂	iso-Pr	N	Cl
	H	3-piridinilo	NMe ₂	iso-Pr	N	Cl
	H	4-piridinilo	NMe ₂	iso-Pr	N	Cl
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	iso-Pr	N	Cl
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	iso-Pr	N	Cl
	H	H	NMe ₂	iso-Pr	N	Br
	Me	H	NMe ₂	iso-Pr	N	Br
	H	Me	NMe ₂	iso-Pr	N	Br
	Me	Me	NMe ₂	iso-Pr	N	Br
	Et	H	NMe ₂	iso-Pr	N	Br
	H	Et	NMe ₂	iso-Pr	N	Br
	Et	Et	NMe ₂	iso-Pr	N	Br
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	iso-Pr	N	Br
	Me	Et	NMe ₂	iso-Pr	N	Br
	Et	Me	NMe ₂	iso-Pr	N	Br
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	iso-Pr	N	Br
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	iso-Pr	N	Br
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	iso-Pr	N	Br
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	iso-Pr	N	Br
	iso-Pr	H	NMe ₂	iso-Pr	N	Br
	H	iso-Pr	NMe ₂	iso-Pr	N	Br
	H	2-piridinilo	NMe ₂	iso-Pr	N	Br
	H	3-piridinilo	NMe ₂	iso-Pr	N	Br
	H	4-piridinilo	NMe ₂	iso-Pr	N	Br
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	iso-Pr	N	Br
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	iso-Pr	N	Br
	H	H	NMe ₂	iso-Pr	N	CF ₃
	Me	H	NMe ₂	iso-Pr	N	CF ₃
	H	Me	NMe ₂	iso-Pr	N	CF ₃
	Me	Me	NMe ₂	iso-Pr	N	CF ₃
	Et	H	NMe ₂	iso-Pr	N	CF ₃
	H	Et	NMe ₂	iso-Pr	N	CF ₃
	Et	Et	NMe ₂	iso-Pr	N	CF ₃
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	iso-Pr	N	CF ₃
	Me	Et	NMe ₂	iso-Pr	N	CF ₃
	Et	Me	NMe ₂	iso-Pr	N	CF ₃
	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe ₂	iso-Pr	N	CF ₃
	H	CH ₂ CH=CH ₂	NMe ₂	iso-Pr	N	CF ₃
	CH ₂ CCH	H	NMe ₂	iso-Pr	N	CF ₃
	H	CH ₂ CCH	NMe ₂	iso-Pr	N	CF ₃
	iso-Pr	H	NMe ₂	iso-Pr	N	CF ₃
	H	iso-Pr	NMe ₂	iso-Pr	N	CF ₃
	H	2-piridinilo	NMe ₂	iso-Pr	N	CF ₃
	H	3-piridinilo	NMe ₂	iso-Pr	N	CF ₃
	H	4-piridinilo	NMe ₂	iso-Pr	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₃ -	NMe ₂	iso-Pr	N	CF ₃
		-(CH ₂) ₄ -	NMe ₂	iso-Pr	N	CF ₃

**Compuesto 65:**

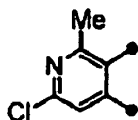
5 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 66:**

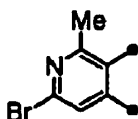
10 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 67:**

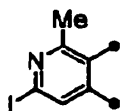
15 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 68:**

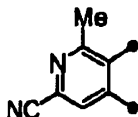
20 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 69:**

25 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

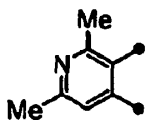
**Compuesto 70:**

30 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



Compuesto 71:

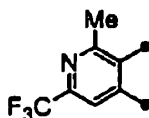
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



5

Compuesto 72:

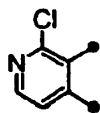
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



10

Compuesto 73:

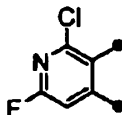
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



15

Compuesto 74:

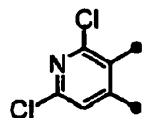
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



20

Compuesto 75:

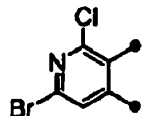
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



25

Compuesto 76:

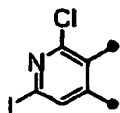
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



30

Compuesto 77:

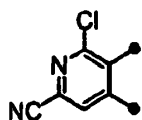
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



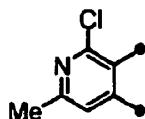
35

Compuesto 78:

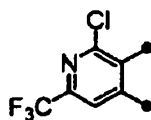
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 79:**

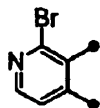
5 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 80:**

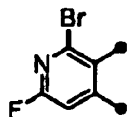
10 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 81:**

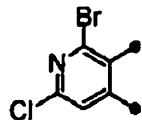
15 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 82:**

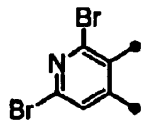
20 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 83:**

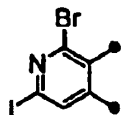
25 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 84:**

30 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

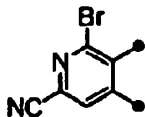
**Compuesto 85:**

35 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



Compuesto 86:

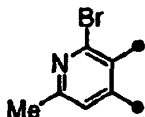
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



5

Compuesto 87:

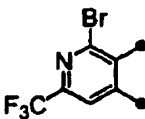
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



10

Compuesto 88:

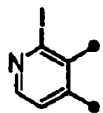
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



15

Compuesto 89:

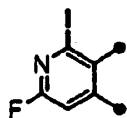
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



20

Compuesto 90:

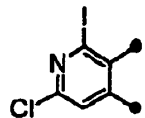
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



25

Compuesto 91:

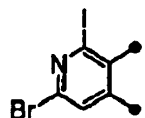
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



30

Compuesto 92:

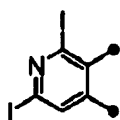
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



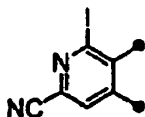
35

Compuesto 93:

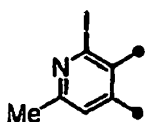
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 94:**

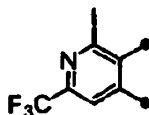
5 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 95:**

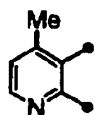
10 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 96:**

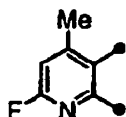
15 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 97:**

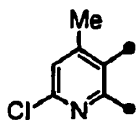
20 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 98:**

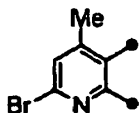
25 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 99:**

30 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

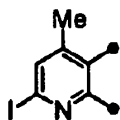
**Compuesto 100:**

35 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



Compuesto 101:

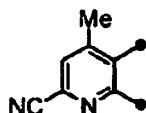
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



5

Compuesto 102:

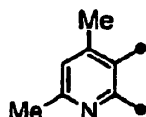
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



10

Compuesto 103:

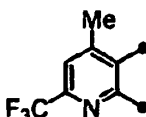
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



15

Compuesto 104:

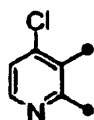
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



20

Compuesto 105:

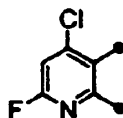
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



25

Compuesto 106:

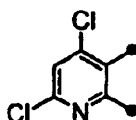
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



30

Compuesto 107:

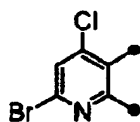
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



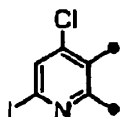
35

Compuesto 108:

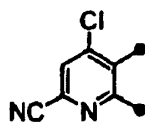
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 109:**

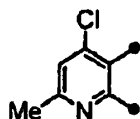
5 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 110:**

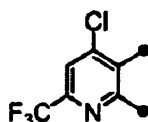
10 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 111:**

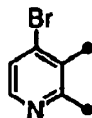
15 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 112:**

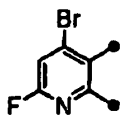
20 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 113:**

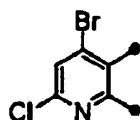
25 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 114:**

30 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

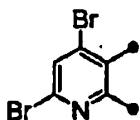
**Compuesto 115:**

35 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



Compuesto 116:

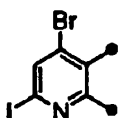
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



5

Compuesto 117:

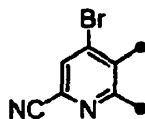
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



10

Compuesto 118:

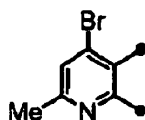
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



15

Compuesto 119:

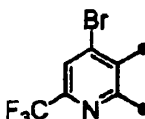
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



20

Compuesto 120:

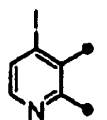
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



25

Compuesto 121:

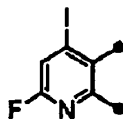
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



30

Compuesto 122:

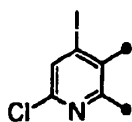
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



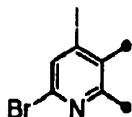
35

Compuesto 123:

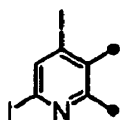
Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 124:**

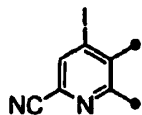
5 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 125:**

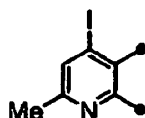
10 C Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 126:**

15 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 127:**

20 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 128:**

25 Compuestos de formula 2A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla B, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

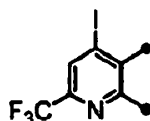


Tabla B

Núm.	R^2	R^3	M	R^{20ay}
	H	H	H	CHF ₂
	Me	H	H	CHF ₂
	H	Me	H	CHF ₂
	Me	Me	H	CHF ₂
	Et	H	H	CHF ₂
	H	Et	H	CHF ₂
	Et	Et	H	CHF ₂
	H	CO ₂ Me	H	CHF ₂
	H	H	OMe	CHF ₂

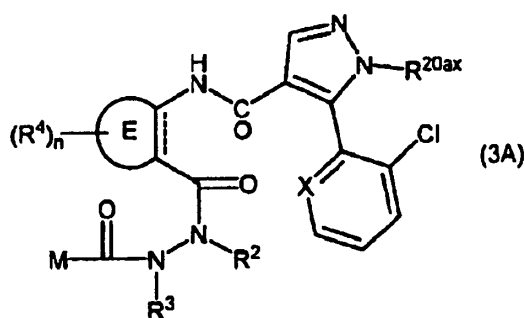
ES 2 380 272 T3

Núm.	R ²	R ³	M	R ^{20ay}
	Me	H	OMe	CHF ₂
	H	Me	OMe	CHF ₂
	Me	Me	OMe	CHF ₂
	Et	H	OMe	CHF ₂
	H	Et	OMe	CHF ₂
	Et	Et	OMe	CHF ₂
	H	CO ₂ Me	OMe	CHF ₂
	H	H	NMe ₂	CHF ₂
	Me	H	NMe ₂	CHF ₂
	H	Me	NMe ₂	CHF ₂
	Me	Me	NMe ₂	CHF ₂
	Et	H	NMe ₂	CHF ₂
	H		NMe ₂	CHF ₂
	Et	Et	NMe ₂	CHF ₂
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	CHF ₂
	H	H	NHMe	CHF ₂
	Me	H	NHMe	CHF ₂
	H	Me	NHMe	CHF ₂
	Me	Me	NHMe	CHF ₂
	Et	H	NHMe	CHF ₂
	H	Et	NHMe	CHF ₂
	Et	Et	NHMe	CHF ₂
	H	CO ₂ Me	NHMe	CHF ₂
	H	H	Et	CBrF ₂
	Me	H	H	CBrF ₂
	H	Me	H	CBrF ₂
	Me	Me	H	CBrF ₂
	Et	H	H	CBrF ₂
	H	Et	H	CBrF ₂
	Et	Et	H	CBrF ₂
	H	CO ₂ Me	H	CBrF ₂
	H	H	OMe	CBrF ₂
	Me	H	OMe	CBrF ₂
	H	Me	OMe	CBrF ₂
	Me	Me	OMe	CBrF ₂
	Et	H	OMe	CBrF ₂
	H	Et	OMe	CBrF ₂
	Et	Et	OMe	CBrF ₂
	H	CO ₂ Me	OMe	CBrF ₂

ES 2 380 272 T3

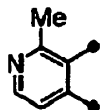
Núm.	R ²	R ³	M	R ^{20ay}
	H	H	NMe ₂	CBrF ₂
	Me	H	NMe ₂	CBrF ₂
	H	Me	NMe ₂	CBrF ₂
	Me	Me	NMe ₂	CBrF ₂
	Et	H	NMe ₂	CBrF ₂
	H	Et	NMe ₂	CBrF ₂
	Et	Et	NMe ₂	CBrF ₂
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	CBrF ₂
	H	H	NHMe	CBrF ₂
	Me	H	NHMe	CBrF ₂
	H	Me	NHMe	CBrF ₂
	Me	Me	NHMe	CBrF ₂
	Et	H	NHMe	CBrF ₂
	H	Et	NHMe	CBrF ₂
	Et	Et	NHMe	CBrF ₂
	H	CO ₂ Me	NHMe	CBrF ₂
	H	H	H	CH ₂ CF ₂
	Me	H	H	CH ₂ CF ₂
	H	Me	H	CH ₂ CF ₂
	Me	Me	H	CH ₂ CF ₂
	Et	H	H	CH ₂ CF ₂
	H	Et	H	CH ₂ CF ₂
	Et	Et	H	CH ₂ CF ₂
	H	CO ₂ Me	H	CH ₂ CF ₂
	H	H	OMe	CH ₂ CF ₂
	Me	H	OMe	CH ₂ CF ₂
	H	Me	OMe	CH ₂ CF ₂
	Me	Me	OMe	CH ₂ CF ₂
	Et	H	OMe	CH ₂ CF ₂
	H	Et	OMe	CH ₂ CF ₂
	Et	Et	OMe	CH ₂ CF ₂
	H	CO ₂ Me	OMe	CH ₂ CF ₂
	H	H	NMe ₂	CH ₂ CF ₂
	Me	H	NMe ₂	CH ₂ CF ₂
	H	Me	NMe ₂	CH ₂ CF ₂
	Me	Me	NMe ₂	CH ₂ CF ₂
	Et	H	NMe ₂	CH ₂ CF ₂
	H	Et	NMe ₂	CH ₂ CF ₂
	Et	Et	NMe ₂	CH ₂ CF ₂

Núm.	R ²	R ³	M	R ^{20ay}
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	CH ₂ CF ₂
	H	H	NHMe	CH ₂ CF ₂
	Me	H	NHMe	CH ₂ CF ₂
	H	Me	NHMe	CH ₂ CF ₂
	Me	Me	NHMe	CH ₂ CF ₂
	Et	H	NHMe	CH ₂ CF ₂
	H	Et	NHMe	CH ₂ CF ₂
	Et	Et	NHMe	CH ₂ CF ₂
	H	CO ₂ Me	NHMe	CH ₂ CF ₂



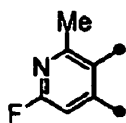
Compuesto 129:

- 5 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R², R³, M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con (R⁴)_n es:



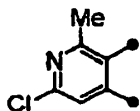
Compuesto 130:

- 10 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R², R³, M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con (R⁴)_n es:



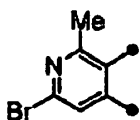
Compuesto 131:

- 15 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R², R³, M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con (R⁴)_n es:



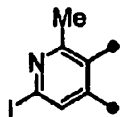
Compuesto 132:

- 20 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R², R³, M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con (R⁴)_n es:



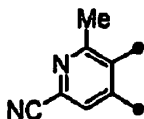
Compuesto 133:

Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



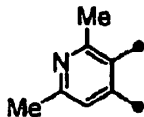
Compuesto 134:

5 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



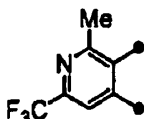
Compuesto 135:

10 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



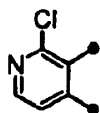
Compuesto 136:

15 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



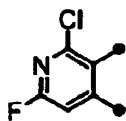
Compuesto 137:

20 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



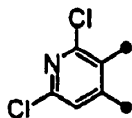
Compuesto 138:

25 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



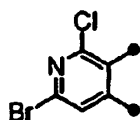
Compuesto 139:

30 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

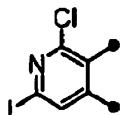


Compuesto 140:

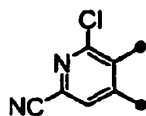
35 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 141:**

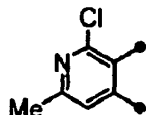
5 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 142:**

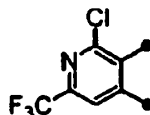
10 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 143:**

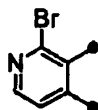
15 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 144:**

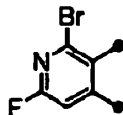
20 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 145:**

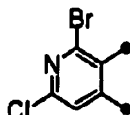
25 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 146:**

30 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

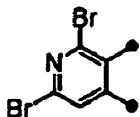
**Compuesto 147:**

35 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



Compuesto 148:

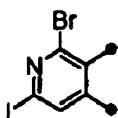
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



5

Compuesto 149:

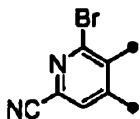
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



10

Compuesto 150:

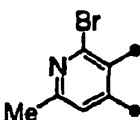
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



15

Compuesto 151:

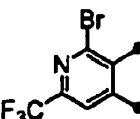
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



20

Compuesto 152:

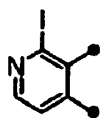
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



25

Compuesto 153:

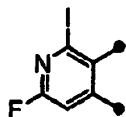
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



30

Compuesto 154:

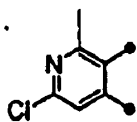
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



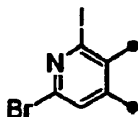
35

Compuesto 155:

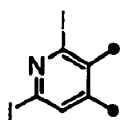
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 156:**

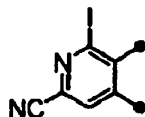
5 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 157:**

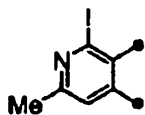
10 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 158:**

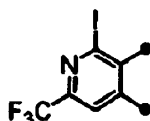
15 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 159:**

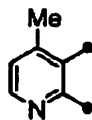
20 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 160:**

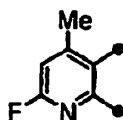
25 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 161:**

30 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

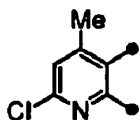
**Compuesto 162:**

35 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



Compuesto 163:

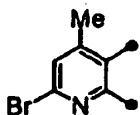
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



5

Compuesto 164:

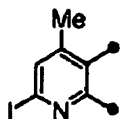
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



10

Compuesto 165:

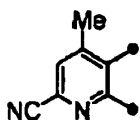
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



15

Compuesto 166:

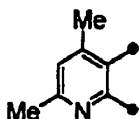
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



20

Compuesto 167:

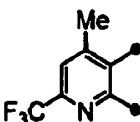
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



25

Compuesto 168:

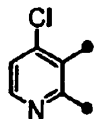
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



30

Compuesto 169:

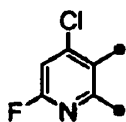
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



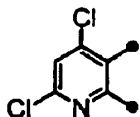
35

Compuesto 170:

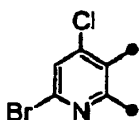
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 171:**

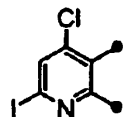
5 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 172:**

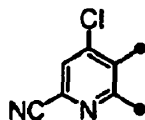
10 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 173:**

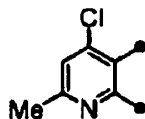
15 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 174:**

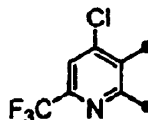
20 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 175:**

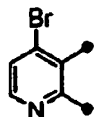
25 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 176:**

30 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

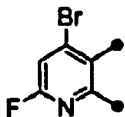
**Compuesto 177:**

35 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



Compuesto 178:

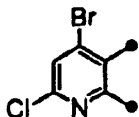
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



5

Compuesto 179:

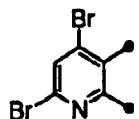
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



10

Compuesto 180:

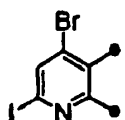
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



15

Compuesto 181:

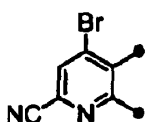
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



20

Compuesto 182:

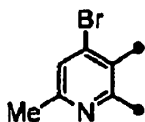
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



25

Compuesto 183:

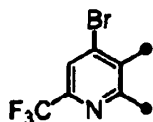
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



30

Compuesto 184:

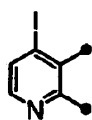
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



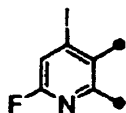
35

Compuesto 185:

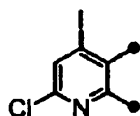
Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 186:**

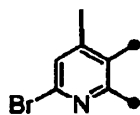
5 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 187:**

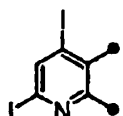
10 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 188:**

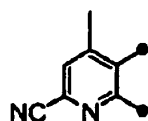
15 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 189:**

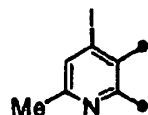
20 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 190:**

25 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 191:**

30 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 192:**

35 Compuestos de formula 3A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ax} le corresponde una fila en la Tabla C, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

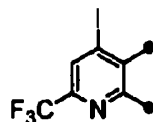


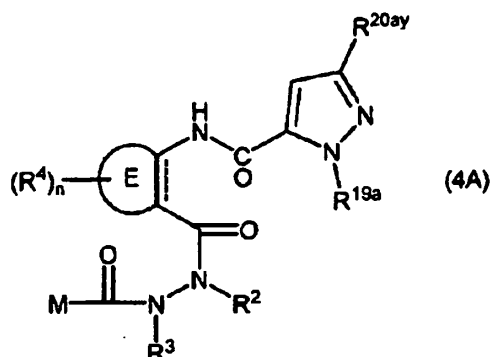
Tabla C:

Núm.	R ²	R ³ H	M	R ^{20ax}
	H	H	H	CHF ₂
	Me	H	H	CHF ₂
	H	Me	H	CHF ₂
	Me	Me	H	CHF ₂
	Et	H	H	CHF ₂
	H	Et	H	CHF ₂
	Et	Et	H	CHF ₂
	H	CO ₂ Me	H	CHF ₂
	H	H	OMe	CHF ₂
	Me	H	OMe	CHF ₂
	H	Me	OMe	CHF ₂
	Me	Me	OMe	CHF ₂
	Et	H	OMe	CHF ₂
	H	Et	OMe	CHF ₂
	Et	Et	OMe	CHF ₂
	H	CO ₂ Me	OMe	CHF ₂
	H	H	NMe ₂	CHF ₂
	Me	H	NMe ₂	CHF ₂
	H	Me	NMe ₂	CHF ₂
	Me	Me	NMe ₂	CHF ₂
	Et	H	NMe ₂	CHF ₂
	H	Et	NMe ₂	CHF ₂
	Et	Et	NMe ₂	CHF ₂
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	CHF ₂
	H	H	NHMe	CHF ₂
	Me	H	NHMe	CHF ₂
	H	Me	NHMe	CHF ₂
	Me	Me	NHMe	CHF ₂
	Et	H	NHMe	CHF ₂
	H	Et	NHMe	CHF ₂
	Et	Et	NHMe	CHF ₂
	H	CO ₂ Me	NHMe	CHF ₂
	H	H	H	CBrF ₂
	Me	H	H	CBrF ₂
	H	Me	H	CBrF ₂
	Me	Me	H	CBrF ₂
	Et	H	H	CBrF ₂
	H	Et	H	CBrF ₂
	Et	Et	H	CBrF ₂

ES 2 380 272 T3

Núm.	R ²	R ³ H	M	R ^{2uax}
	H	CO ₂ Me	H	CBrF ₂
	H	H	OMe	CBrF ₂
	Me	H	OMe	CBrF ₂
	H	Me	OMe	CBrF ₂
	Me	Me	OMe	CBrF ₂
	Et	H	OMe	CBrF ₂
	H	Et	OMe	CBrF ₂
	Et	Et	OMe	CBrF ₂
	H	CO ₂ Me	OMe	CBrF ₂
	H	H	NMe ₂	CBrF ₂
	Me	H	NMe ₂	CBrF ₂
	H	Me	NMe ₂	CBrF ₂
	Me	Me	NMe ₂	CBrF ₂
	Et	H	NMe ₂	CBrF ₂
	H	Et	NMe ₂	CBrF ₂
	Et	Et	NMe ₂	CBrF ₂
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	CBrF ₂
	H	H	NHMe	CBrF ₂
	Me	H	NHMe	CBrF ₂
	H	Me	NHMe	CBrF ₂
	Me	Me	NHMe	CBrF ₂
	Et	H	NHMe	CBrF ₂
	H	Et	NHMe	CBrF ₂
	Et	Et	NHMe	CBrF ₂
	H	CO ₂ Me	NHMe	CBrF ₂
	H	H	H	CH ₂ CF ₂
	Me	H	H	CH ₂ CF ₂
	H	Me	H	CH ₂ CF ₂
	Me	Me	H	CH ₂ CF ₂
	Et	H	H	CH ₂ CF ₂
	H	Et	H	CH ₂ CF ₂
	Et	Et	H	CH ₂ CF ₂
	H	CO ₂ Me	H	CH ₂ CF ₂
	H	H	OMe	CH ₂ CF ₂
	Me	H	OMe	CH ₂ CF ₂
	H	Me	OMe	CH ₂ CF ₂
	Me	Me	OMe	CH ₂ CF ₂
	Et	H	OMe	CH ₂ CF ₂
	H	Et	OMe	CH ₂ CF ₂

Núm.	R ²	R ³ H	M	R ^{20ax}
	Et	Et	OMe	CH ₂ CF ₂
	H	CO ₂ Me	OMe	CH ₂ CF ₂
	H	H	NMe ₂	CH ₂ CF ₂
	Me	H	NMe ₂	CH ₂ CF ₂
	H	Me	NMe ₂	CH ₂ CF ₂
	Me	Me	NMe ₂	CH ₂ CF ₂
	Et	H	NMe ₂	CH ₂ CF ₂
	H	Et	NMe ₂	CH ₂ CF ₂
	Et	Et	NMe ₂	CH ₂ CF ₂
	H	CO ₂ Me	NMe ₂	CH ₂ CF ₂
	H	H	NHMe	CH ₂ CF ₂
	Me	H	NHMe	CH ₂ CF ₂
	H	Me	NHMe	CH ₂ CF ₂
	Me	Me	NHMe	CH ₂ CF ₂
	Et	H	NHMe	CH ₂ CF ₂
	H	Et	NHMe	CH ₂ CF ₂
	Et	Et	NHMe	CH ₂ CF ₂
	H	CO ₂ Me	NHMe	CH ₂ CF ₂



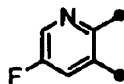
Compuesto 193:

- 5 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R², R³, M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con (R⁴)_n es:



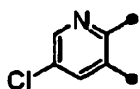
Compuesto 194:

- 10 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R², R³, M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con (R⁴)_n es:

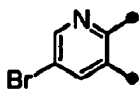


Compuesto 195:

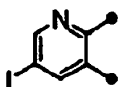
- 15 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R², R³, M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con (R⁴)_n es:

**Compuesto 196:**

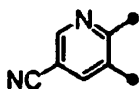
5 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 197:**

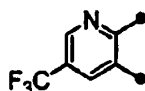
10 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 198:**

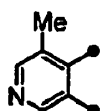
15 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 199:**

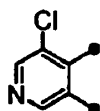
20 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 200:**

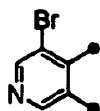
25 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 201:**

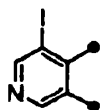
30 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 202:**

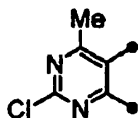
35 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 203:**

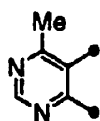
40 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 204:**

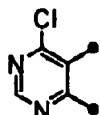
5 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 205**

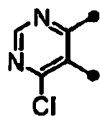
10 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 206:**

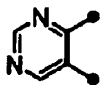
15 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 207:**

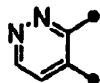
20 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 208:**

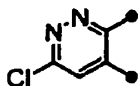
25 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 209:**

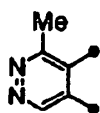
30 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 210:**

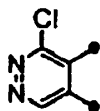
35 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 211:**

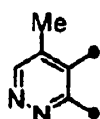
40 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 212:**

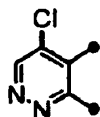
5 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 213:**

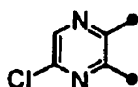
10 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 214:**

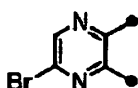
15 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 215:**

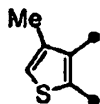
20 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 216:**

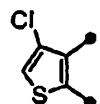
25 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 217:**

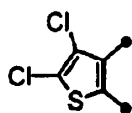
30 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 218:**

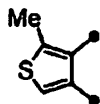
35 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 219:**

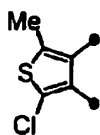
40 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 220:**

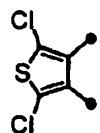
5 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 221:**

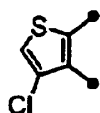
10 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 222:**

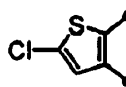
15 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 223:**

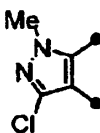
20 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 224:**

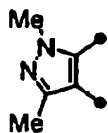
25 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 225:**

30 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

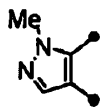
**Compuesto 226:**

35 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



Compuesto 227:

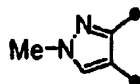
Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



5

Compuesto 228:

Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



10

Compuesto 229:

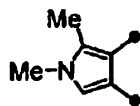
Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



15

Compuesto 230:

Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



20

Compuesto 231:

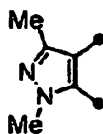
Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



25

Compuesto 232:

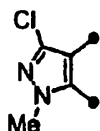
Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



30

Compuesto 233:

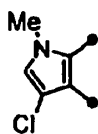
Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



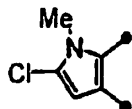
35

Compuesto 234:

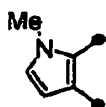
Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 235:**

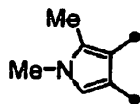
5 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 236:**

10 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 237:**

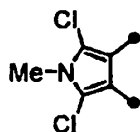
15 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 238:**

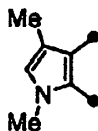
20 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 239:**

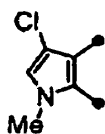
25 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 240:**

30 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

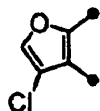
**Compuesto 241:**

35 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



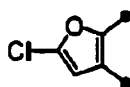
Compuesto 242:

5 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



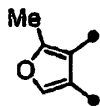
Compuesto 243:

10 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



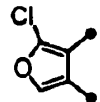
Compuesto 244:

15 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



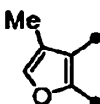
Compuesto 245:

20 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



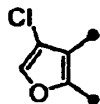
Compuesto 246:

25 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



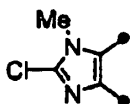
Compuesto 247:

30 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



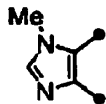
Compuesto 248:

35 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



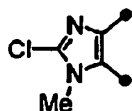
Compuesto 249:

Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



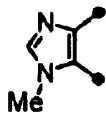
Compuesto 250:

5 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



Compuesto 251:

10 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



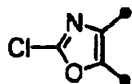
Compuesto 252:

15 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



Compuesto 253:

20 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



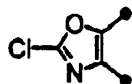
Compuesto 254:

25 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



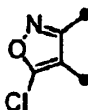
Compuesto 255:

30 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



Compuesto 256:

35 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

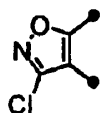


Compuesto 257:

40 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 258:**

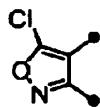
5 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 259:**

10 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 260:**

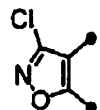
15 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 261:**

20 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 262:**

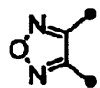
25 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 263:**

30 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 264:**

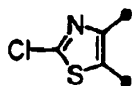
35 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 265:**

40 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 266:**

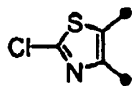
5 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 267:**

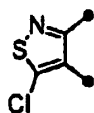
10 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 268:**

15 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 269:**

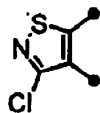
20 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 270:**

25 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 271:**

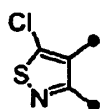
30 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 272:**

35 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 273:**

40 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



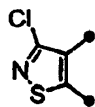
Compuesto 274:

5 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



Compuesto 275:

10 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



Compuesto 276:

15 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



Compuesto 277:

20 Compuestos de formula 4A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla D, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

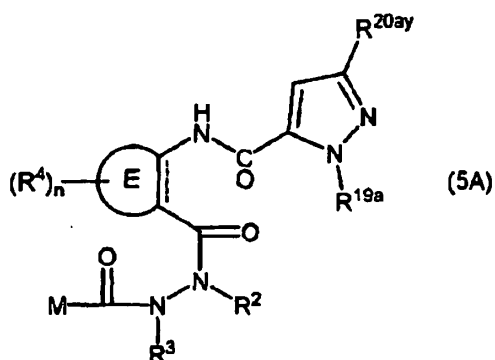


Tabla D:

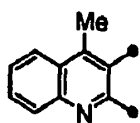
R^2	R^3	M	R^{19a}	R^{20ay}
H	H	H	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Me	H	H	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Me	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Et	H	H	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Et	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	CO ₂ Me	H	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	H	H	3-cloro-2-piridinilo	Br
Me	H	H	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	Br
Me	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	Br
Et	H	H	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	Br
Et	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	CO ₂ Me	H	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

ES 2 380 272 T3

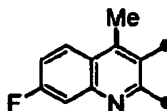
R ²	R ³	M	R ^{19a}	R ^{20ay}
Me	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Me	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Et	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Et	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	CO ₂ Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Me	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Me	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Et	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Et	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	CO ₂ Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
Me	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
Me	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
Et	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
Et	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	CO ₂ Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Me	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CF _J
H	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Me	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Et	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Et	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	CO ₂ Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

**Compuesto 278:**

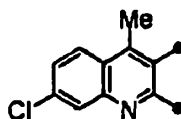
5 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 279:**

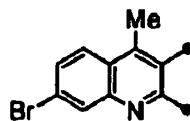
10 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 280:**

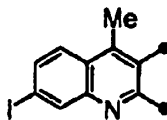
15 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 281:**

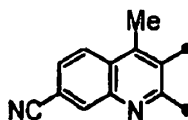
20 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 282:**

25 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

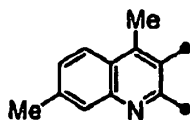
**Compuesto 283:**

30 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



Compuesto 284

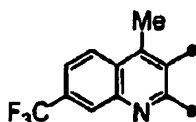
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



5

Compuesto 285:

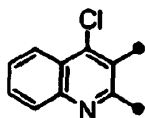
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



10

Compuesto 286:

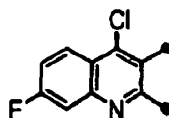
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



15

Compuesto 287:

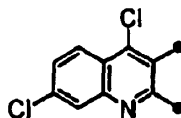
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



20

Compuesto 288:

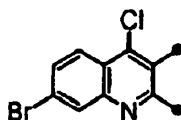
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



25

Compuesto 289:

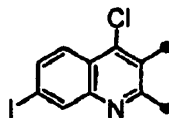
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



30

Compuesto 290:

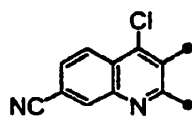
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



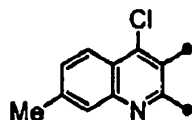
35

Compuesto 291:

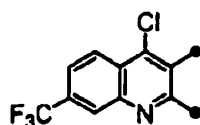
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 292:**

5 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 293:**

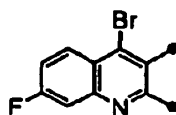
10 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 294:**

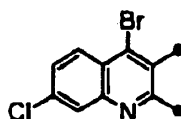
15 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 295:**

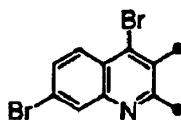
20 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 296:**

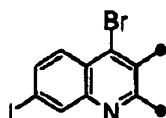
25 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 297:**

30 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

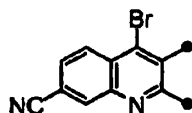
**Compuesto 298:**

35 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



Compuesto 299:

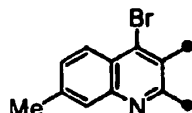
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



5

Compuesto 300:

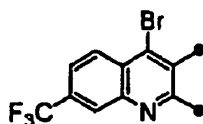
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



10

Compuesto 301:

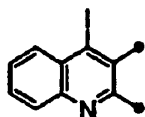
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



15

Compuesto 302:

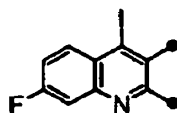
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



20

Compuesto 303:

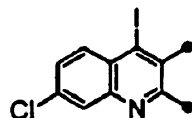
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



25

Compuesto 304:

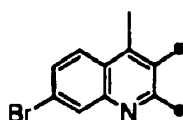
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



30

Compuesto 305:

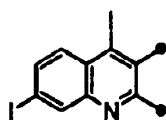
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



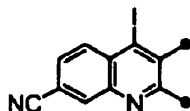
35

Compuesto 306:

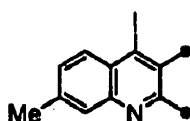
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 307:**

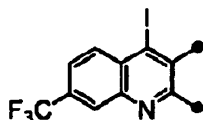
5 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 308:**

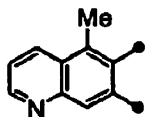
10 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 309:**

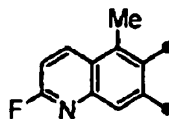
15 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 310:**

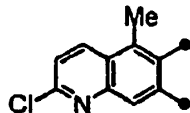
20 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 311:**

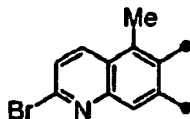
25 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 312:**

30 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

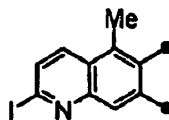
**Compuesto 313:**

35 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



Compuesto 314:

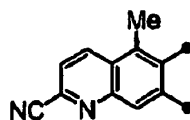
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



5

Compuesto 315:

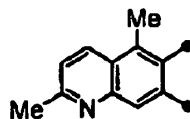
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



10

Compuesto 316:

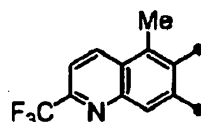
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



15

Compuesto 317:

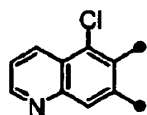
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



20

Compuesto 318:

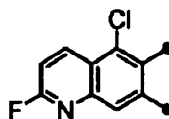
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



25

Compuesto 319:

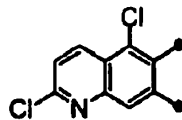
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



30

Compuesto 320:

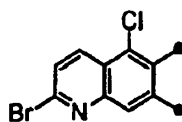
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



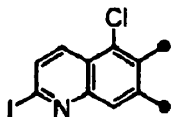
35

Compuesto 321:

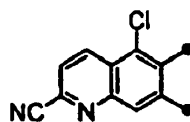
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 322:**

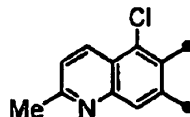
5 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 323:**

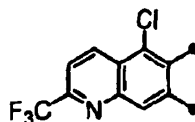
10 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 324:**

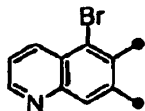
15 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 325:**

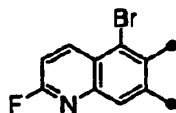
20 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 326:**

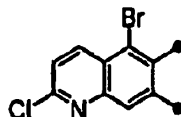
25 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 327:**

30 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

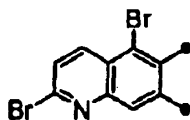
**Compuesto 328:**

35 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



Compuesto 329:

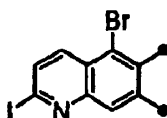
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



5

Compuesto 330:

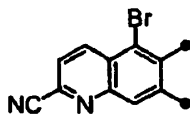
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



10

Compuesto 331:

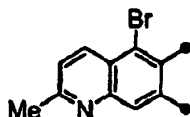
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



15

Compuesto 332:

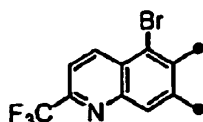
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



20

Compuesto 333:

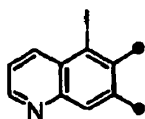
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



25

Compuesto 334:

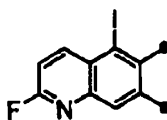
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



30

Compuesto 335:

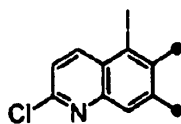
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:



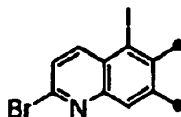
35

Compuesto 336:

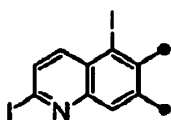
Compuestos de fórmula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 337:**

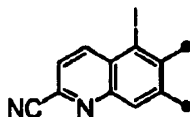
5 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 338:**

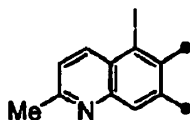
10 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 339:**

15 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 340:**

20 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

**Compuesto 341:**

25 Compuestos de formula 5A donde a cada uno de R^2 , R^3 , M, R^{19a} y R^{20ay} le corresponde una fila en la Tabla E, y E sustituido con $(R^4)_n$ es:

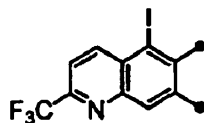


Tabla E:

R^2	R^3	M	R^{19a}	R^{20ay}
H	H	H	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Me	H	H	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Me	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Et	H	H	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Et	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	CO ₂ Me	H	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	H	H	3-cloro-2-piridinilo	Br

ES 2 380 272 T3

R ²	R ³	M	R ^{19a}	R ^{20ay}
Me	H	H	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	Br
Me	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	Br
Et	H	H	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	Br
Et	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	CO ₂ Me	H	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Me	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Me	Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CE ₃
Et	H	H	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Et	Et	H	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	CO ₂ Me	H	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Me	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Me	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Et	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Et	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	CO ₂ Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	Br
Me	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	Br
Me	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	Br
Et	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	Br
Et	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	CO ₂ Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Me	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Me	Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Et	H	Me	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Et	Et	Me	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	CO ₂ Me	Me	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

ES 2 380 272 T3

R ²	R ³	M	R ^{19a}	R ^{20ay}
H	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Me	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Me	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Et	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Et	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	CO ₂ Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
Me	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
Me	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
Et	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
Et	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	CO ₂ Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Me	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Me	Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Et	H	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Et	Et	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	CO ₂ Me	OMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Me	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Me	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Et	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Et	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	CO ₂ Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	Br
Me	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	Br
Me	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	Br
Et	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	Br
Et	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	Br

ES 2 380 272 T3

R ²	R ³	M	R ^{19a}	R ^{20ay}
H	CO ₂ Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Me	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Me	Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Et	H	OEt	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Et	Et	OEt	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	CO ₂ Me	OEt	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Me	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Me	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Et	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Et	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	CO ₂ Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	Br
Me	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	Br
Me	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	Br
Et	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	Br
Et	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	CO ₂ Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Me	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Me	Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Et	H	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Et	Et	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	CO ₂ Me	NH ₂	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Me	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Me	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Et	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl

ES 2 380 272 T3

R ²	R ³	M	R ^{19a}	R ^{20ay}
Et	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	CO ₂ Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
Me	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
Me	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
Et	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
Et	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	CO ₂ Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Me	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Me	Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Et	H	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Et	Et	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	CO ₂ Me	NHMe	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Me	H	NHMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Me	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Et	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	Cl
Et	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	CO ₂ Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	Br
Me	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	Br
Me	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	Br
Et	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	Br
Et	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	CO ₂ Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Me	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Me	Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Et	H	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

R ²	R ³	M	R ^{19a}	R ^{20ay}
H	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
Et	Et	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	CO ₂ Me	NMe ₂	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Los ejemplos de las plagas contra las que el presente compuesto tiene eficacia de control incluyen artrópodos nocivos tales como insectos nocivos y ácaros nocivos, y nematelmintos tales como nematodos, y sus ejemplos específicos se muestran más abajo.

Hemiptera:-

Saltadores de plantas (Delphacidae) tales como el saltador de plantas pardo pequeño (*Laodelphax striatellus*), el saltador de plantas del arroz (*Nilaparvata lugens*), y el saltador de plantas de arroz de dorso blanco (*Sogatella furcifera*); saltadores de hojas (Deltocephalidae) tales como el saltador de hojas del arroz (*Nephotettix cincticeps*), el saltador de hojas verde del arroz (*Nephotettix virescens*), y el saltador de hojas verde del té (*Empoasca onukii*); áfidos (Aphididae) tales como el pulgón del algodón (*Aphis gossypii*), el pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*), el pulgón de la col (*Brevicorine brassicae*), el pulgón de spiraea (*Aphis spiraecola*), el pulgón de la patata (*Macrosiphum euphorbiae*), el pulgón estriado de la digital y la patata (*Aulacorthum solani*), el pulgón de la avena (*Rhopalosiphum padi*), el pulgón café de los cítricos (*Toxoptera citricidus*), y el pulgón verde harinoso del ciruelo (*Hyalopterus pruni*); chinches apestosos (Pentatomidae) tales como la chinche apestosa verde (*Nezara antennata*), la chinche de las judías (*Riptortus clavatus*), la chinche del arroz (*Leptocorisa chinensis*), la chinche espinosa de manchas blancas (*Eysarcoris parvus*), y la chinche parda marmórea (*Halyomorpha mista*); moscas blancas (Aleyrodidae) tales como la mosca blanca de los invernaderos (*Trialeurodes vaporariorum*), la mosca blanca de la batata (*Bemisia tabaci*), la mosca blanca de las hojas plateadas (*Bemisia argentifolii*), la mosca blanca de los cítricos (*Dialeurodes citri*), y la mosca blanca espinosa de los cítricos (*Aleurocanthus spiniferus*); cochinillas (Coccidae) tales como la cochinilla roja de California (*Aonidiella aurantii*), la cochinilla de San José (*Comstockaspis perniciososa*), la cochinilla blanca del tronco (*Unaspis citri*), la escama roja de la cera (*Ceroplastes rubens*), la cochinilla acanalada (*Icerya purchasi*), la cochinilla harinosa de los cítricos (*Planococcus kraunhiae*), el gorgojo de Cosmstock (*Pseudaulacaspis longispinis*), y la cohinilla blanca del melocotonero (*Pseudaulacaspis pentagona*); chinches de encaje (Tingidae); psílidos (Psyllidae); etc.

Lepidoptera:-

Polillas Pirálidas (Pyralidae) tales como el minador del tallo del arroz (*Chilo suppressalis*), el minador amarillo del arroz (*Tryporyza incertulas*), el enrollahojas del arroz (*Cnaphalocrocis medinalis*), el enrollahojas del algodón (*Notarcha derogata*), la polilla India de la harina (*Plodia interpunctella*), el minador oriental del maíz (*Ostrinia furnacalis*), el gusano del brote de la col (*Hellula undalis*), y la oruga de la grama de los prados (*Pediasia teterrellus*); polillas lechuza (Noctuidae) tales como el gusano gris del tabaco (*Spodoptera litura*), el gusano cogollero de la remolacha (*Spodoptera exigua*), el gusano soldado (*Pseudaletia separata*), la noctua de la col (*Mamestra brassicae*), el gusano cortador grasiento (*Agrotis ipsilon*), el gusano de la remolacha (*Plusia nigrisigna*), *Thoracoplusia* spp., *Heliothis* spp., y *Helicoverpa* spp.; mariposas blancas y del azufre (Pieridae) tales como la blanquita de la col (*Pieris rapae*); polillas tortricidas (Tortricidae) tales como *Adoxophyes* spp., la polilla oriental del melocotonero (*Grapholita molesta*), el minador de la vaina de la soja (*Leguminivora glycinivorella*), el perforador de la vaina de la judía adzuki (*Matsumuraeses azukivora*), el tortricido de la fruta de verano (*Adoxophyes orana fasciata*), *Adoxophyes* sp., el tortricido oriental del té (*Homona magnanima*), el tortricido del manzano (*Archips fuscocupreanus*), y *Cydia pomonella*; minadores de las hojas (Gracillariidae) tales como la tortricia menor del té (*Caloptilia theivora*), y el minador de las hojas del manzano (*Phyllonorycter ringoneella*); Carposinidae tales como la polilla del melocotón (*Carposina niponensis*); polillas lionétidas (Lyonetiidae) tales como *Lyonetia* spp.; polilla gitana asiática (Lymantriidae) tales como *Lymantria* spp., y *Euproctis* spp.; polillas de iponoméutidas (Yponomeutidae) tales como la polilla dorso de diamante (*Plutella xilostella*); polillas gelequidas (Gelechiidae) tales como el gusano rosado (*Pectinophora gossypiella*), y la polilla de la patata (*Phthorimaera operculella*); polillas tigre y aliados (Arctiidae) tales como el gusano telarañero (*Hyphantria cunea*); polillas tinéidas (Tineidae) tales como la polilla de la ropa (*Tinea translucens*), y la polilla tejedora de la ropa (*Tinea bisselliella*); etc.

Thysanoptera:-

Trips (Thripidae) tales como el piojillo arenoso de los cítricos (*Frankliniella occidentalis*), *Thrips palmi*, el piojillo amarillo del té (*Scirtothrips dorsalis*), el piojillo de la cebolla (*Thrips tabaci*), el piojillo de las flores (*Frankliniella intonsa*), etc.

Diptera:-

La mosca común (*Musca domestica*), el mosquito común (*Culex pipiens pallens*), el tábano (*Tabanus trigonus*), el gusano de la cebolla (*Hylemya antiqua*), el gusano de la semilla del maíz (*Hylemya platura*), *Anopheles sinensis*, el minador de la hoja del arroz (*Agromyza oryzae*), el minador del arroz (*Hydrellia griseola*), el gusano del tallo del arroz (*clorops oryzae*), la mosca del melón (*Dacus cucurbitae*), *Ceratitidis capitata*, el minador americano de las hojas (*Liriomyza trifolii*), el minador de las hojas del tomate (*Liriomyza sativae*), minador de la hoja de la arveja (*Chromatomyia horticola*), etc.

Coleoptera:-

La mariquita de veintiocho puntos (*Epilachna vigintioctopunctata*), el escarabajo de la hoja de las cucurbitáceas (*Aulacophora femoralis*), el escarabajo pulga rallado (*Phyllotreta striolata*), el escarabajo de la hoja del arroz (*Oulema oryzae*), el curculio del arroz (*Echinocnemus squamous*), el gorgojo acuático del arroz (*Lissorhoptrus oryzophyllus*), *Anthonomus grandis*, el gorgojo de las leguminosas (*Callosobruchus chinensis*), *Sfenophorus venatus*, el escarabajo Japonés (*Popillia japonica*), el abejorro cúpreo (*Anomala cuprea*), el gusano de la raíz del maíz (*Diabrotica* spp.), el escarabajo de la patata (*Leptinotarsa decemlineata*), el gusano alambre (*Agriotes* spp.), la carcoma del tabaco (*Lasioderma serricorne*), el escarabajo de las alfombras (*Anthrenus verbasci*), el escarabajo rojo de la harina (*Tribolium castaneum*), el escarabajo del polvo de los postes (*Lyctus brunneus*), el escarabajo longicornio (*Anoplophora malasiaca*), el escarabajo de los brotes del pino (*Tomicus piniperda*), etc.

Orthoptera:-

La langosta Asiática (*Locusta migratoria*), el alacrán cebollero (*Grillotalpa africana*), el saltamontes del arroz (*Oxya yezoensis*), el saltamontes del arroz (*Oxya japonica*), etc.

Hymenoptera:-

La mosca de sierra de la col (*Athalia rosae*), *Acromyrmex* spp., la hormiga de fuego (*Solenopsis* spp.), etc.

Nematodos:-

El nematodo de las puntas blancas del arroz (*Afelechooides besseyi*), el nematodo de los brotes de la fresa (*Nothotylenchus acris*), el nematodo formador de nódulos en la raíz meridional (*Meloidogyne incognita*), el nematodo formador de nódulos en la raíz septentrional (*Meloidogyne hapla*), el nematodo formador de nódulos en la raíz de Java (*Meloidogyne javanica*), el nematodo de la soja (*Heterodera glycines*), el namatodo de la patata (*Globodera rostochiensis*), el namatodo de la lesión de la raíz del café (*Pratylenchus coffeae*), el nematodo de la lesión de la raíz de California (*Pratylenchus neglectus*), etc.

Dictyoptera:-

La cucaracha alemana (*Blattella germanica*), la cucaracha café ahumada (*Periplaneta fuliginosa*), la cucaracha Americana (*Periplaneta americana*), *Periplaneta brunnea*, la cucaracha oriental (*Blatta orientalis*), etc.

Acarina:-

Ácaros araña (Tetranychidae) tales como la araña roja (*Tetranychus urticae*), la araña Kanzawa (*Tetranychus kanzawai*), el ácaro rojo de los cítricos (*Panonychus citri*), el ácaro rojo Europeo (*Panonychus ulmi*), y *Oligonychus* spp.; ácaros eriófididos (Eriophyidae) tales como el ácaro rosa de la herrumbre de los cítricos (*Aculops pelekassi*), el ácaro rosa de la herrumbre de los cítricos (*Phyllocoptruta citri*), el ácaro tostador del tomate (*Aculops lycopersici*), el ácaro púrpura del té (*Calacarus carinatus*), el ácaro rosado de la herrumbre del té (*Acaphylla theavagran*), y *Eriophyes chibaensis*; ácaros tarsonémidos (Tarsonemidae) tales el ácaro blanco (*Polyphagotarsonemus latus*); falsos ácaros (Tenuipalpidae) tales como *Brevipalpus phoenicis*; Tuckerellidae; garrapatas (Ixodidae) tales como *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava*, *Dermacentor taiwanicus*, *Ixodes ovatus*, *Ixodes persulcatus*, *Boophilus microplus*, y *Rhipicephalus sanguineus*; ácaros acáridos (Acaridae) tales como el ácaro del moho (*Tyrophagus putrescentiae*), y *Tyrophagus similis*; ácaros del polvo doméstico (Pyroglyphidae) tales como *Dermatophagoides farinae*, y *Dermatophagoides pteronyssus*; ácaros quelétidos (Cheiletidae) tales como *Cheiletus eruditus*, *Cheiletus malaccensis*, y *Cheiletus moorei*; ácaros parasitoides (Dermanyssidae); etc.

El plaguicida de la presente invención puede ser el propio presente compuesto pero, usualmente, el presente compuesto se mezcla con un portador inerte tal como un portador sólido, un portador líquido, un portador gaseoso y similares y, si fuera necesario, se añaden un tensioactivo, y otros aditivos de preparación para formularlos en una composición o una preparación tal como una emulsión, aceite, polvo, gránulos, una preparación mojable, una preparación autosuspendible, microcápsulas, un aerosol, un fumigante, un cebo envenenado, una preparación de

resina o similares. Estas composiciones o preparaciones contienen usualmente de 0,01 a 95% en peso del presente compuesto.

5 Los ejemplos del portador sólido utilizado incluyen polvos finos y gránulos tales como arcillas (arcilla de caolín, tierra de diatomeas, bentonita, arcilla fubasami, arcilla ácida, etc.), óxido de silicio hidratado sintético, talco, cerámica, otros minerales inorgánicos (sericita, cuarzo, azufre, carbón activo, carbonato de calcio, sílice hidratada, etc.), fertilizantes químicos (sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, urea, cloruro de amonio, etc.) y similares.

10 Los ejemplos del portador líquido incluyen agua, alcoholes (metanol, etanol, alcohol isopropílico, butanol, hexanol, alcohol bencílico, etilenglicol, propilenglicol, fenoxietanol, etc.), cetonas (acetona, metil etil cetona, ciclohexanona, etc.), hidrocarburos aromáticos (tolueno, xileno, etilbenceno, dodecibenceno, fenilxiletano, metilnaftaleno, etc.), hidrocarburos alifáticos (hexano, ciclohexano, queroseno, gasóleo, etc.), ésteres (acetato de etilo, acetato de butilo, miristato de isopropilo, oleato de etilo, adipato de diisopropilo, adipato de diisobutilo, monometileter acetato de propilenglicol, etc.), nitrilos (acetonitrilo, isobutironitrilo, etc.), éteres (éter diisopropílico, 1,4-dioxano, dimetileter de etilenglicol, dimetileter de dietilenglicol, monometileter de dietilenglicol, monometileter de propilenglicol, monometileter de dipropilenglicol, 3-metoxil-3-metil-1-butanol, etc.), amiduros de ácido (N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, etc.), hidrocarburos halogenados (diclorometano, tricloroetano, tetracloruro de carbono, etc.), sulfóxidos (dimetilsulfóxido, etc.), propileno carbónico y aceites vegetales (aceite de soja, aceite de semilla de algodón, etc.).

Los ejemplos del portador gaseoso incluyen fluorocarbonos, gas butano, GPL (gas de petróleo licuado), éter dimetílico, y gas ácido carbónico.

25 Los ejemplos del tensioactivo incluyen tensioactivos no iónicos tales como polioxietilentalquiléter, polioxietilentalquilarileter, ésteres de ácidos grasos y polietilenglicol, y similares, y tensioactivos aniónicos tales como sales alquilsulfonato, sales alquilbencenosulfonato y sales alquilsulfato.

30 Los ejemplos de otros aditivos de preparación incluyen aglutinantes, agentes dispersantes, agentes colorantes y estabilizantes, específicamente, caseína, gelatina, azúcares (almidón, goma arábiga, derivados de celulosa, ácido algínico, etc.), derivados de lignina, bentonita, polímeros solubles en agua sintéticos (poli(alcohol vinílico), polivinilpirrolidona, poli(ácidos acrílicos), etc.), PAP (fosfato ácido de isopropilo), BHT (2,6-di-terc-butil-4-metilfenol), y BHA (una mezcla de 2-terc-butil-4-metoxifenol y 3-terc-butil-4-metoxifenol).

35 El método para controlar una plaga de la presente invención se realiza usualmente aplicando el plaguicida de la presente invención directamente a una plaga o al lugar en el que habita la plaga (planta, suelo, en el hogar, etc.).

40 Cuando el plaguicida de la presente invención se utiliza para controlar una plaga en el campo agrícola, la cantidad que se va a aplicar es usualmente de 1 a 10.000 g por 10.000 m² en términos de la cantidad del presente compuesto. Cuando el plaguicida de la presente invención se formula en una emulsión, una preparación mojable, una preparación autosuspendible o similares, usualmente, el agente se aplica diluyéndolo con agua de manera que la concentración de ingrediente activo llega a ser de 0,01 a 10.000 ppm, y los gránulos, el polvo o similares se aplican usualmente tal cual.

45 Estas preparaciones, o las preparaciones diluidas con agua se pueden aplicar directamente a una plaga o a una planta tal como un cultivo que se vaya a proteger de una plaga, o se puede aplicar al suelo de una tierra cultivada con el fin de controlar una plaga que habite en el suelo.

50 Alternativamente, el tratamiento se puede realizar por ejemplo, enrollando una preparación de resina elaboradas en forma de lámina o en forma de cordón en un cultivo, rodeando un cultivo con la preparación de resina, o colocando la preparación de resina sobre el suelo por encima de las raíces de un cultivo.

55 Cuando el plaguicida de la presente invención se utiliza para controlar una plaga que habita en un inmueble (p. ej. mosca, mosquito, cucaracha, etc.), la cantidad que se va a aplicar es usualmente de 0,01 a 1000 mg por 1 m² de área de tratamiento en términos de la cantidad del presente compuesto en caso del tratamiento con tensioactivo, y es usualmente de 0,01 a 500 mg por 1 m³ de espacio de tratamiento en términos de la cantidad del presente compuesto en caso de tratamiento espacial. Cuando el plaguicida de la presente invención se formula en una emulsión, una preparación mojable, una preparación autosuspendible o similares, usualmente, el agente se aplica mediante dilución con agua de manera que la concentración de ingrediente activo concentración llega a ser de 0,1 a 1000 ppm, y el aceite, un aerosol, un fumigante, un cebo envenenado o similares se aplica tal cual.

60 El plaguicida de la presente invención puede contener otros agentes de control de artrópodos nocivos, acaricidas, nematocidas, fungicidas, herbicidas, reguladores del crecimiento vegetal, sinergistas, fertilizantes, acondicionadores del suelo, alimentos para animales, y similares.

En cuanto a los ingredientes activos de los otros agentes de control de artrópodos nocivos anteriormente mencionados, los acaricidas y/o los nematocidas, por ejemplo, se pueden mencionar los siguientes compuestos.

(1) Compuestos organofosforados

5 Acefato, fosfuro de aluminio, butatiofos, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cianofos: CYAP, diazinón, DCIP (diclorodiisopropileter), diclofentión: ECP, diclorvos: DDVP, dimetoato, dimetilvinfos, disulfotón, EPN, etión, etoprofos, etrimfos, fentiión: MPP, fenitrotión: MEP, fostiazato, formotión, fosfuro de hidrógeno, isofenfos, isoxatión, malatión, mesulfenfos, metidatión: DMTP, monocrotofos, naled: BRP, oxideprofos:ESP, paratión, fosalona, fosmet: PMP, pirimifos-metilo, piridafentiión, quinalfos, fentoato: PAP, profenofos, propafos, protiofos, piraclorfos, salitión, sulprofos, tebupirimfos, temefos, tetraclorvinfos, terbufos, tiometón, triclorfón:DEP, vamidotión, y similares.

(2) Compuestos carbamato

15 Alanicarb, bendiocarb, benfuracarb, BPMC, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, cloetocarb, etiofencarb, fenobucarb, fenotiocarb, fenoxicarb, furatiocarb, isoprocarb:MIPC, metolcarb, metomilo, metiocarb, NAC, oxamilo, pirimicarb, propoxur: PHC, XMC, tiodicarb, xililcarb, y similares.

(3) Compuestos piretroides sintéticos

20 Acrinatrina, aletrina, benflutrina, beta-ciflutrina, bifentrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cipermetrina, deltametrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flufenoprox, flumetrina, fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, permetrina, praletrina, piretrinas, resmetrina, sigmacipermetrina, silafluofeno, teflutrina, tralometrina, transflutrina, (EZ)-(1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2,2-dimetil-3-prop-1-enilciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-9-(metoximetil)bencilo, (EZ)-(1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2,2-dimetil-3-prop-1-enilciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-9-metilbencilo, (1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)ciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)bencilo, y similares.

(4) Compuestos de Nereistoxina

30 Cartap, bensultap, tiociclam, monosultap, bisultap, y similares.

(5) Compuestos Neonicotinoides

35 Imidacloprid, nitenpiram, acetamiprid, tiametoxam, tiacloprid, dinotefurano, clotianidina, y similares.

(6) Compuestos de benzoilurea

40 Clorfluazurón, bistriflurón, diafentiurón, diflubenzurón, fluazurón, fluciclozurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, teflubenzurón, triflumurón, y similares.

(7) Compuestos de fenilpirazol

45 Acetoprol, etiprol, fipronilo, vaniliprol, piriprol, pirafluprol, y similares.

(8) Insecticidas de toxina Bt

50 Endosporas viables derivadas de *Bacillus thuringiensis* y toxinas cristalinas producidas por el mismo, así como una mezcla de las mismas.

(9) Compuestos de hidrazina

55 Cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida, y similares.

(10) Compuestos de cloro orgánicos

Aldrina, dieldrina, dienoclor, endosulfan, metoxiclor, y similares.

(11) Insecticidas naturales

60 Aceite para máquinas, nicotina-sulfato, y similares.

(12) Otros insecticidas

5 Avermectina-B, bromopropilato, buprofezina, clorfenapir, ciromazina, 1,3-Dicloropropeno, benzoato de emamectina, fenazaquina, flupirazofos, hidropreno, indoxacarb, metoxadiazona, milbemicina-A, pimetrozina, piridalilo, pirioproxifeno, espinosad, sulfuramida, tolfenpirad, triazamato, flubendiamida, SI-0009, ciflumetofeno, ácido arsénico, benclotiaz, cianamida cálcica, polisulfuro de calcio, clordano, DDT, DSP, flufenerim, flonicamida, flurimfen, formetanato, metam-amonio, metam-sodio, Bromuro de metilo, nidinotefurano, Oleato de potasio, protrifenbute, espiromesifeno, azufre, metaflumizona, espirotetramat, y similares.

Acaricidas

10 Acequinocilo, amitraz, benzoximato, bromopropilato, quinometionato, clorobencilato, CPCBS (clorfenson), clofentecina, Kelthane (dicofol), etoxazol, óxido de fenbutatina, fenotiocarb, fenpiroximato, fluacpirim, fluproxifeno, hexitiazox, propargita:BPPS, polinactinas, piridabeno, Pirimidifeno, tebufenpirad, tetradifón, espiroclorofeno, amidoflumet, Bifenazato, Ciflumetofeno, y similares.

15 Nematocidas (ingredientes activos nematocidas)

DCIP, fostiazato, levamisol, isotiocianato de metilo, tartarato de morantel, y similares.

20 La presente invención se explicará como más detalle más abajo por medio de los Ejemplos de Preparación, Ejemplos de Formulación, Ejemplos de Ensayo, pero la presente invención no se limita a esos Ejemplos.

En primer lugar, se explicarán los Ejemplos de Preparación del presente compuesto.

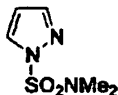
Ejemplos de Preparación:

25 **Ejemplo 1: Preparación de éster metílico de ácido N'-(3-{[5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino}-2,6-dicloro-piridin-4-carbonil)-hidrazincarboxílico (1)**

Etapa 1: Preparación de dimetilamiduuro de ácido pirazol-1-sulfónico

30 Se disolvió pirazol (15 g) en tolueno (200 mL) y se añadió lentamente cloruro de dimetilsulfamoilo (23,7 mL).

35 Después de la adición de trietilamina (40 mL), la solución se agitó durante 18 h a temperatura ambiente. El precipitado se separó mediante filtración, el producto filtrado se concentró a vacío y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna (gel de sílice 60, hexano/acetato de etilo = 5:1, después 2:1, $R_f = 0,30$ en hexano/acetato de etilo = 2:1, solución en $KMnO_4$) para proporcionar 17,6 g del compuesto del título de fórmula



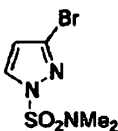
en forma de un aceite incoloro.

40 RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 2,95 (6H, s), 6,40 (1H, dd, $J = 3$ Hz, 2 Hz), 7,75 (1 H, d, $J = 2$ Hz), 7,95 (1 H, dd, $J = 3$ Hz, 1 Hz).

Etapa 2: Preparación de dimetilamiduuro de ácido 3-bromo-pirazol-1-sulfónico

45 El dimetilamiduuro de ácido pirazol-1-sulfónico (17,6 g) se disolvió en THF seco (200 mL) y se enfrió a $-78^\circ C$. Se añadió lentamente una solución de n-butillitio (80 mL, 1,3 M) a lo largo de un período de 15 min y se agitó durante 15 min. adicionales a $-78^\circ C$. Se añadió una solución de 1,2-dibromo-1,1,2,2-tetracloroetano (35,8 g) en THF seco (60 mL) en 10 min a esta solución y se agitó durante 15 min. adicionales a $-78^\circ C$, a continuación se retiró el baño refrigerante y la mezcla se sofocó con agua después de agitar durante 1 h. La mezcla de reacción se extrajo 3x con acetato de etilo, las capas org. combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre $MgSO_4$ y se concentraron a vacío.

50 El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (gel de sílice 60, hexano/acetato de etilo = 5:1, $R_f = 0,25$) para proporcionar 21,3 g del compuesto del título de fórmula

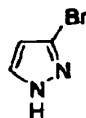


55 en forma de un aceite incoloro.

RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,08 (6H, s), 6,43 (1H, m), 7,61 (1H, m).

Etapa 3: Preparación de 3-bromo-1H-pirazol

- 5 A dimetilamido de ácido 3-bromo-pirazol-1-sulfónico (21,3 g) se le añadió lentamente ácido trifluoroacético (30 mL) y se agitó a temperatura ambiente durante 2 h. Se añadió hexano y el precipitado formado se separó mediante filtración y se lavó con hexano. El producto filtrado se diluyó con MTB-éter, se lavó con una solución sat. de NaHCO_3 , agua y salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró a vacío para proporcionar 10,7 g de un aceite incoloro que contenía 80% del compuesto del título de fórmula



10

El residuo se utilizó para la siguiente etapa sin purificación adicional.

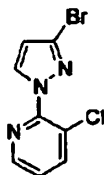
RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,37 (1H, d, $J = 3$ Hz), 7,55 (1H, d, $J = 3$ Hz), 12,6 (1H, s ancho).

15

Etapa 4: Preparación de 2-(3-bromo-pirazol-1-il)-3-cloropiridina

- 20 El producto bruto de 3-bromo-1H-pirazol (10,7 g) se disolvió en DMF (80 mL), se añadieron 2,3-dicloropiridina (11,8 g) y carbonato de cesio (57,3 g) y la mezcla se agitó durante 8 h a 100°C . Después de la adición de agua, la mezcla se extrajo 2x con MTB-éter, las capas org. combinadas se lavaron 2x con agua, salmuera, se secaron sobre MgSO_4 y se concentraron a vacío.

El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (gel de sílice 60, hexano/acetato de etilo = 5:1, $R_f = 0,20$) para proporcionar 12,9 g del compuesto del título de fórmula



25

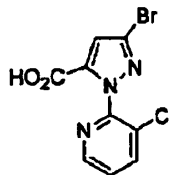
es forma de un sólido de color blanco.

RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,51 (1H, d, $J = 3$ Hz), 7,31 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 7,91 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 2 Hz), 8,04 (1H, d, $J = 3$ Hz), 8,95 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 2 Hz).

30

Etapa 5: Preparación de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico

- 35 La 2-(3-bromo-pirazol-1-il)-3-cloro-piridina (9,2 g) se disolvió en THF seco (80 mL) y se enfrió a -78°C . Se añadió una solución de LDA (21,3 mL, 2,0 M) a lo largo de un período de 10 min y se agitó durante 15 minutos adicionales a -78°C . La solución se vertió sobre hielo triturado en THF (50 mL) y se agitó durante 1 h adicional. Se añadieron agua y Et_2O y se añadió una solución de NaOH 2 N para ajustar el pH a 10-12. Las capas se separaron y la capa acuosa se lavó 2x con Et_2O y aciduló con HCl 2 N (pH - 3). La suspensión resultante se extrajo tres veces con MTB-éter, las capas org. combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre MgSO_4 y se concentraron para proporcionar 7,96 g del compuesto del título de fórmula



40

en forma de un sólido de color naranja.

RMN ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 7,23 (1H, s), 7,68 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 8,24 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 2 Hz), 8,55 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 2 Hz).

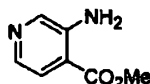
45

Etapa 6: Preparación de éster metílico de ácido 3-aminoisonicotínico

El ácido 3-aminoisonicotínico (400 mg) se suspendió en metanol (6 mL) y se añadió tolueno (18 mL). Una solución de (trimetilsilil)diazometano (2,0 M en éter dietílico, 1,88 mL) se añadió lentamente a la suspensión. En 5 a 10

minutos después de la adición, la suspensión se volvió una solución. Después de 2 horas de agitación a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se sofocó con agua y se extrajo 3x con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con ácido clorhídrico 2 N, una solución saturada de bicarbonato y salmuera, se secó sobre MgSO₄ y se concentró a vacío.

5 El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (gel de sílice 60, hexano/acetato de etilo = 1:2, R_f = 0,40) para proporcionar 340 mg del compuesto del título de fórmula

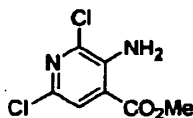


10 es forma de un sólido de color blanco.

RMN H¹ (CDCl₃, TMS) δ (ppm) : 3,91 (3H, s), 5,65 (2H, s ancho), 7,59 (1H, d, J = 5 Hz), 7,93 (1H, d, J = 5 Hz), 8,19 (1H, s).

15 **Etapa 7: Preparación de éster metílico de ácido 3-amino-2,6-dicloroisonicotínico**

El éster metílico de ácido 3-aminoisonicotínico (340 mg) se disolvió en DMF (3 mL), se añadió N-clorosuccinimida (600 mg) y la solución resultante se agitó durante 15 horas a temperatura ambiente. El producto se precipitó mediante adición de agua a la mezcla de reacción, se separó mediante filtración y se lavó con agua. El producto bruto se purificó mediante cromatografía en columna (gel de sílice 60, hexano/acetato de etilo = 3:1, R_f = 0,50) para proporcionar 460 mg del compuesto del título de fórmula

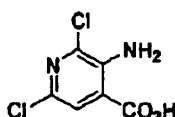


es forma de un sólido de color blanco.

25 RMN H¹ (CDCl₃, TMS) δ (ppm) : 3,94 (3H, s), 6,17 (2H, s ancho), 7,66 (1H, s).

Etapa 8: Preparación de ácido 3-amino-2,6-dicloroisonicotínico

30 El éster metílico de ácido 3-amino-2,6-dicloroisonicotínico (460 mg) se disolvió en etanol (8 mL), agua (2 mL) y se añadió hidróxido de potasio (234 mg). La solución se agitó durante 20 minutos a temperatura ambiente y durante 1,5 horas a reflujo. Después de enfriar a temperatura ambiente, se añadió ácido clorhídrico 2 N para ajustar el valor de pH a -3 y el precipitado de color amarillo formado de este modo se extrajo 3x con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO₄ y se concentró a vacío para proporcionar 420 mg del compuesto del título de fórmula

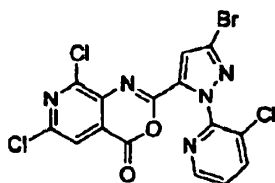


35 en forma de un sólido de color amarillo. El compuesto se utilizó en la siguiente etapa de reacción sin purificación adicional

40 RMN H¹ (CDCl₃, TMS) δ (ppm) : 6,21 (2 H, s ancho), 7,69 (1 H, s).

Etapa 9: Preparación de 2-[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-6,8-dicloro-pirido[3,4-d][1,3]oxazin-4-ona

45 Una mezcla de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (ejemplo 1, etapa 5) (745 mg) y cloruro de tionilo (540 μl) se agitó a reflujo durante 2 horas. El cloruro de tionilo en exceso se evaporó simultáneamente con tolueno seco en un evaporador, el residuo se volvió a disolver en acetonitrilo seco (10 mL) y se añadió ácido 3-amino-2,6-dicloroisonicotínico (ejemplo 1, etapa 8) (745 mg). La solución se agitó durante 5 minutos a temperatura ambiente y se añadió trietilamina (490 μL) y se agitó durante 1 hora, antes de añadir una segunda porción de trietilamina (490 μL). Después de agitar la mezcla de reacción durante 30 minutos adicionales a temperatura ambiente, se añadió cloruro de metanosulfonilo (210 μL). Después de agitar durante 20 horas a temperatura ambiente, el precipitado formado se separó mediante filtración, se lavó cuidadosamente con agua y MTB-éter y se secó a vacío para proporcionar 731 mg del compuesto del título de fórmula

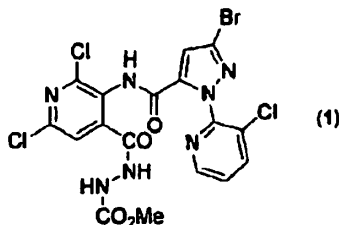


en forma de un sólido de color amarillo.

5 RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 7,32 (1H, s), 7,51 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 7,94 (1H, s), 7,99 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 2 Hz), 8,55 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 2 Hz).

Etapa 10: Preparación de éster metílico de ácido N' -(3-([5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino)-2,6-dicloropiridin-4-carbonil)-hidrazincarboxílico

10 (1) La 2-[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-6,8-dicloro-pirido[3,4-d][1,3]oxazin-4-ona (200 mg) se disolvió en DMF (8 mL) con calentamiento suave. Se añadió éster metílico de ácido carbazoico (380 mg) y la solución se agitó durante 25 horas a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se sofocó con agua y se extrajo con MTB-éter. La capa orgánica se lavó 3x con agua, salmuera, se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/acetato de etilo = 1:2, $R_f = 0,20$) para proporcionar
15 190 mg de compuesto 1 de la presente invención de fórmula



es forma de un sólido de color blanco.

20 RMN H^1 ($DMSO-D_6$) δ (ppm): 3,48-3,65 (3H, m), 7,41 (1H, s), 7,60-7,63 (2H, m), 8,18 (1H, d, $J = 8$ Hz), 8,51 (1H, d, $J = 5$ Hz), 9,47 (1H, s ancho), 10,47 (1H, s ancho), 10,76 (1H, s ancho).

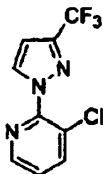
Ejemplo 2: Preparación de éster metílico de ácido N' -(2,6-dicloro-3-([2-(3-cloropiridin-2-il)-5-trifluorometil-2H-pirazol-3-carbonil]-amino)-piridin-4-carbonil)-hidrazincarboxílico (2)

Etapa 1: Preparación de 3-cloro-2-(3-trifluorometilpirazol-1-il)-piridina

El 3-trifluorometil-1H-pirazol (15,30 g), 2,3-dicloropiridina (16,64 g) y carbonato de potasio (26,42 g) se suspendieron en DMF seca (100 mL) y se agitó durante 3 h a 130°C, durante la noche a rt y de nuevo durante 11 h a 130°C.

30 Una vez consumida completamente la sustancia de partida, la reacción se enfrió a temperatura ambiente y se sofocó con agua. La mezcla se extrajo 2x con acetato de etilo, las capas org. combinadas se lavaron 2x con agua, salmuera, se secaron sobre $MgSO_4$ y se concentraron a vacío.

35 El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (gel de sílice 60, hexano/acetato de etilo = 8:1, a continuación 5:1, $R_f = 0,35$ en hexano/acetato de etilo = 3:1) para proporcionar 22,88 g del compuesto del título de fórmula

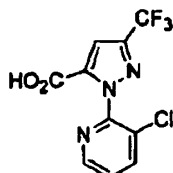


en forma de un aceite incoloro.

40 RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 6,75 (1H, d, $J = 2$ Hz), 7,37 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 7,95 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 2 Hz), 8,14 (1H, d, $J = 2$ Hz), 8,49 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 2 Hz).

Etapa 2: Preparación de ácido 2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-trifluoro metil-2H-pirazol-3-carboxílico

La 3-cloro-2-(3-trifluorometil-pirazol-1-il)-piridina (15 g) se disolvió en THF seco (150 mL) y se enfrió a -78°C . Se añadió una solución de LDA (39 mL, 2,0 M) a lo largo de un período de 15 min y se agitó durante 15 min. adicionales a -78°C . El matraz se conectó a una entrada de gas y se hizo burbujear CO_2 a través de la solución a una velocidad tal que la temperatura interna se mantuvo por debajo de -60°C . La solución viró a color amarillo pálido y se retiró el baño refrigerante después de agitar durante 10 min adicionales a -78°C y detener la corriente de CO_2 . Después de calentar la solución a temperatura ambiente, se añadieron 200 ml agua y 200 ml hexano, y se añadió una solución de NaOH 2 N para ajustar el pH a 10-12. Las capas se separaron y la capa orgánica se extrajo de nuevo dos veces con una solución de NaOH 0,5 N. Las soluciones acuosas combinadas se lavaron 2x con Et_2O y acidularon con HCl 2 N (pH - 3). La suspensión resultante se extrajo tres veces con MTB-éter, las capas org. combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre MgSO_4 y se concentraron para proporcionar 16,08 g del compuesto del título de fórmula

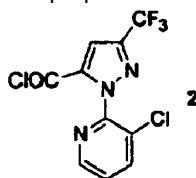


en forma de un sólido de color beige. El compuesto se utilizó para la siguiente etapa sin purificación adicional.

RMN ^1H (DMSO- d_6) δ (ppm) : 7,60 (1H, s), 7,74 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 8,30 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 2 Hz), 8,60 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 2 Hz).

Etapa 3: Preparación de cloruro de 2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-trifluoro metil-2H-pirazol- 3-carbonilo

El ácido 2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-trifluorometil-2H-pirazol-3-carboxílico (16,08 g) se mezcló con cloruro de tionilo (12 mL) y se calentó a reflujo durante 2 h. El cloruro de tionilo en exceso se evaporó desde la solución bruta en un evaporador rotativo bajo evaporación simultánea con tolueno seco. El cloruro de ácido se aisló mediante destilación del residuo a presión reducida ($125^{\circ}\text{C}/3$ mmHg) para proporcionar 14,2 g del compuesto del título de fórmula

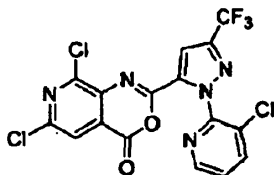


en forma de un sólido cristalino.

RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm) : 7,52 (1H, s), 7,52 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 7,97 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 2 Hz), 8,53 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 2 Hz).

Etapa 4: Preparación de 6,8-dicloro-2-[2-(3-cloro-piridin -2-il)-5-trifluorometil-2H-pirazol-3-il]-pirido[3,4-d][1,3]oxazin-4-ona

El cloruro de ácido 5-trifluorometil-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (ejemplo 2, etapa 3) (242 mg) se añadió a una mezcla de ácido 3-amino-2,6-dicloroisonicotínico (ejemplo 1, etapa 8) (190 mg) en acetonitrilo (3 mL). La mezcla se agitó durante 5 minutos a temperatura ambiente y se añadió trietilamina (220 μL) y se agitó durante 20 minutos, antes de añadir una segunda porción de trietilamina (220 μL). Después de agitar la mezcla de reacción durante 20 minutos adicionales a temperatura ambiente, se añadió cloruro de metanosulfonilo (70 μL). Después de agitar durante 2 horas a temperatura ambiente, el precipitado formado se separó mediante filtración, se lavó cuidadosamente con agua y MTB-éter y se secó a vacío para proporcionar 350 mg del compuesto del título de fórmula

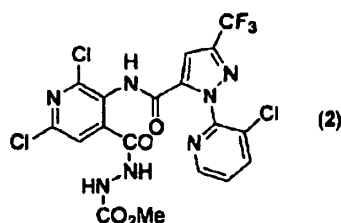


en forma de un sólido de color amarillo.

RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,54-7,57 (2H, m), 7,88 (1H, s), 8,01-8,04 (1H, m), 8,56-8,58 (1H, m).

Etapa 5: Preparación de éster metílico de ácido N'-(2,6-dicloro-3-([2-(3-cloropiridin-2-il)-5-trifluorometil-2H-pirazol-3-carbonil]-amino)-piridin-9-carbonil)-hidrazincarboxílico (2)

La 6,8-dicloro-2-[2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-trifluorometil-2H-pirazol-3-il]-pirido[3,4-d] [1,3]oxazin-4-ona (200 mg) se disolvió en DMF (5 mL), se añadió éster metílico de ácido carbazoico (190 mg) y la solución se agitó durante 16 horas a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se sofocó con agua y se extrajo con MTB-éter. La capa orgánica se lavó 2x con agua, se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO₄ y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/acetato de etilo = 1:1, a continuación 1:2, R_f = 0,20 en hexano/acetato de etilo 1:2) para proporcionar 43 mg de compuesto **2** de la presente invención de fórmula

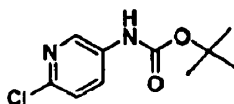


es forma de un sólido de color blanco.

RMN ¹H (DMSO-D₆) δ (ppm): 3,62 (3H, s ancho), 7,62 (1H, s), 7,67 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7,77 (1H, s), 8,23 (1H, d, J = 8 Hz), 8,54 (1H, d, J = 5 Hz), 9,47 (1H, s), 10,49 (1H, s), 10,92 (1H, s).

Ejemplo 3: Preparación de éster metílico de ácido N'-(3-([5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino)-6-cloro-2-metil-piridin-4-carbonil)-hidrazincarboxílico (3)**Etapa 1: preparación de éster terc-butílico de ácido (6-cloro-piridin-3-il)-carbámico**

Una mezcla de 5-amino-2-cloropiridina (5,0 g) y dicarbonato de di-terc-butilo (9,34 g) en dioxano (60 mL) se agitó durante 2 horas a reflujo. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se sofocó con agua y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó 5x con ácido clorhídrico diluido, se lavó con bicarbonato de sodio saturado, salmuera, se secó sobre MgSO₄ y se concentró a vacío. El residuo se lavó con hexano para producir 5,39 g del compuesto del título en forma de un sólido de color blanco. Los lavados ácidos combinados se volvieron a extraer con MTB-éter. La capa orgánica se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO₄ y se concentró a vacío. El residuo se combinó con el residuo del lavado con hexano y se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/acetato de etilo 3:1, R_f = 0,40) para proporcionar otros 650 mg del compuesto del título de fórmula

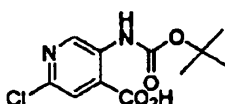


es forma de un sólido de color blanco.

RMN ¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 1,52 (9H, s), 6,60 (1H, s), 7,25 (1H, d, J = 8 Hz), 7,95 - 7,97 (1H, m ancho), 8,24 (1H, d, J = 3 Hz).

Etapa 2: Preparación de ácido 5-terc-butoxicarbonilamino-2-cloro-isonicotínico

Una solución de éster terc-butílico de ácido (6-cloro-piridin-3-il)-carbámico (4,19 g) en éter dietílico (150 mL) se enfrió a -78°C y se añadió N,N,N',N'-tetrametiletilendiamina (6,60 g). Después de la adición lenta de una solución de n-butil litio (1,32 M en hexano, 41,6 mL) a lo largo de un período de tiempo de 10 minutos, se dejó que la mezcla se templara hasta -10°C, se agitó a esta temperatura durante 2 horas y a continuación se volvió a enfriar a -78°C. La mezcla se vertió lentamente en una mezcla agitada de hielo triturado en THF y se agitó durante 30 minutos. La mezcla se concentró en un evaporador rotativo y se añadió agua al residuo. La capa acuosa se lavó 2x con MTB-éter y aciduló con ácido clorhídrico 6 N a pH = 3. El precipitado formado se separó mediante filtración, se lavó con agua, acetato de etilo y se secó a vacío para proporcionar 2,46 g del compuesto del título de fórmula

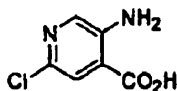


en forma de un sólido de color beige.

RMN ^1H (DMSO- D_6) δ (ppm) : 1,48 (9H, s), 7,77 (1H, s), 9,13 (1H, s), 10,13 (1H, s).

Etapa 3: Preparación de ácido 5-amino-2-cloroisonicotínico

- 5 Una suspensión de ácido 5-*terc*-butoxicarbonilamino-2-cloro-isonicotínico (2,46 g) en una solución acuosa de hidróxido de potasio 2N (45 mL) se agitó a 90°C durante 5 horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, la solución se aciduló mediante adición lenta de ácido clorhídrico 6 N. El precipitado formado se separó mediante filtración, se lavó con agua, MTB-éter y hexano y se secó a vacío para proporcionar 700 mg del compuesto del título de fórmula



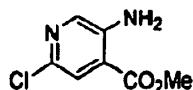
- 10 en forma de un sólido de color beige.

RMN ^1H (DMSO- D_6) δ (ppm): 7,47 (1H, s), 8,02 (1H, s).

15 **Etapa 4: Preparación de éster metílico de ácido 5-amino-3-cloroisonicotínico**

- 20 El ácido 5-amino-2-cloroisonicotínico (1,72 g) se suspendió en metanol (20 mL) y se añadió tolueno (60 mL). Se añadió lentamente a la suspensión una solución de (trimetilsilil)diazometano (2,0 M en éter dietílico, 6,5 mL). En 5 a 10 minutos después de la adición, la suspensión se volvió una solución. Después de 2 horas de agitación a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se sofocó con agua y se extrajo 3x con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con una solución saturada de bicarbonato y salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró a vacío.

- 25 El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (gel de sílice 60, cloroformo/acetato de etilo = 20:1, R_f = 0,30 en cloroformo/acetato de etilo = 3:1) para proporcionar 1,50 g del compuesto del título de fórmula

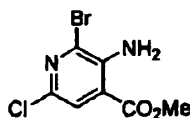


en forma de un sólido de color blanco.

- 30 RMN ^1H (DMSO- D_6) δ (ppm): 3,83 (3H, s), 6,77 (2H, s), 7,48 (1H, s), 8,05 (1H, s).

Etapa 5: Preparación de éster metílico de ácido 3-amino-2-bromo-6-cloroisonicotínico

- 35 El éster metílico de ácido 5-amino-3-cloroisonicotínico (600 mg) se disolvió en DMF (5 mL), se añadió N-bromosuccinimida (573 mg) y la solución se agitó durante 3 horas a 80°C y 24 horas a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se diluyó con MTB-éter y 3x se lavó con agua, se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/acetato de etilo = 10:1, R_f = 0,20) para proporcionar 787 mg del compuesto del título de fórmula

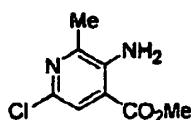


- 40 en forma de un sólido de color amarillo.

RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,93 (3H, s), 6,23 (2H, s ancho), 7,67 (1H, s).

45 **Etapa 6: Preparación de éster metílico de ácido 3-amino-6-cloro-2-metilisonicotínico**

- 50 El éster metílico de ácido 3-amino-2-bromo-6-cloroisonicotínico (500 mg), carbonato de potasio (829 mg), tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0) y trimetilboroxina (276 mg) se suspendieron en dioxano (15 mL). Se añadió agua (1,5 mL) y la mezcla se desgasificó utilizando una posterior evaporación y lavando con nitrógeno (5x). La mezcla de reacción se agitó a reflujo durante 7 horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla se sofocó con agua y se extrajo 2x con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/ acetato de etilo = 3 : 1, R_f = 0,25) para proporcionar 100 mg del compuesto del título de fórmula



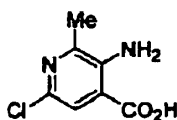
en forma de un sólido de color amarillo.

5 RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 2,44 (3H, s), 3,92 (3H, s), 5,70 (2H, s ancho), 7,57 (1H, s).

Etapa 7: Preparación de ácido 3-amino-6-cloro-2-metilisonicotínico

10 El éster metílico de ácido 3-amino-6-cloro-2-metilisonicotínico (100 mg) se disolvió en metanol (2 mL) y se añadió una solución acuosa de hidróxido de sodio 2 N (2 mL). La mezcla de reacción se agitó a reflujo durante 2,5 horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, se añadieron agua y éter dietílico, las capas se separaron y la capa acuosa se lavó con éter dietílico. La capa acuosa se aciduló mediante la adición de ácido clorhídrico 2 N y el precipitado formado se extrajo tres veces con MTB-éter. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró a vacío para proporcionar 89 mg del compuesto del título de fórmula

15



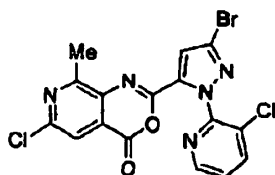
en forma de un sólido de color amarillo. El producto bruto se utilizó sin purificación adicional en la siguiente etapa.

20 RMN H^1 ($DMSO-D_6$) δ (ppm): 2,33 (3H, s), 7,40 (1H, s).

Etapa 8: Preparations de 2-[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-6-cloro-8-metil-pirido[3,4-d][1,3]oxazin-4-ona

25 Una mezcla de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (ejemplo 1, etapa 5) (144 mg) y cloruro de tionilo (105 μ l) se agitó a reflujo durante 2 horas. El cloruro de tionilo en exceso se evaporó simultáneamente con tolueno seco en un evaporador, el residuo se volvió a disolver en acetonitrilo seco (1,5 mL) y se añadió ácido 3-amino-6-cloro-2-metilisonicotínico (89 mg). La solución se agitó durante 10 minutos a temperatura ambiente y se añadió trietilamina (65 μ l) y se agitó durante 20 minutos, después de añadir una segunda porción de trietilamina (130 μ l). Después de agitar la mezcla de reacción durante 20 minutos adicionales a temperatura ambiente, se añadió cloruro de metanosulfonilo (45 μ l). Después de agitar durante 48 horas a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se sofocó con agua y se extrajo 3x con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró a vacío.

35 El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/acetato de etilo = 3:1, R_f = 0,20) para proporcionar 67 mg del compuesto del título de fórmula



en forma de un sólido de color blanco.

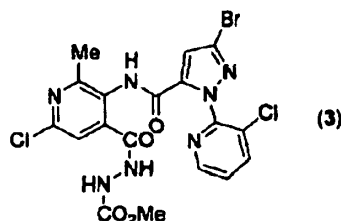
40 RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 2,10 (3H, s), 7,28 (1H, s), 7,53 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7,83 (1H, s), 8,00 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8,56 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz).

Etapa 9: Preparación de éster metílico de ácido N' -(3-[[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino]-6-cloro-2-metilpiridin-4-carbonil)-hidrazincarboxílico (3)

45 La 2-[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-6-cloro-8-metil-pirido[3,4-d][1,3]oxazin-4-ona (67 mg) se disolvió en DMF (4 mL) y se añadió éster metílico de ácido carbazoico (133 mg). La solución se agitó durante 20 horas a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se sofocó con agua y se extrajo con MTB-éter. La capa orgánica se lavó 4 x con agua, se lavó con salmuera, se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró a vacío. El residuo se purificó

50

mediante cromatografía en columna (sílice 60, cloroformo/acetato de etilo = 1:1, $R_f = 0,20$) para proporcionar 61 mg de compuesto **3** de la presente invención de fórmula



5 en forma de un sólido de color blanco.

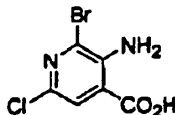
RMN H^1 (DMSO- D_6) δ (ppm): 2,35 (3H, s), 3,48-3,63 (3H, m ancho), 7,36 (1H, s), 7,39 (1H, s), 7,62 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 8,18 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 2 Hz), 8,50 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 2 Hz), 9,41 (1H, s), 10,38 (1H, s), 10,47 (1H, s).

10 **Ejemplo 4: Preparación de éster metílico de ácido N' -(2-bromo-3-[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino)-6-cloro-piridin-4-carbonil]-hidrazincarboxílico (4)**

Etapa 1: Preparación de ácido 3-amino-2-bromo-6-cloroisonicotínico

15 El éster metílico de ácido 3-amino-2-bromo-6-cloroisonicotínico (260 mg) (ejemplo 3, etapa 5) se disolvió en metanol (2 mL), se añadió una solución acuosa de hidróxido de sodio 2 N (2 mL) y la mezcla de reacción se agitó durante 2 horas a reflujo.

20 Después de enfriar a temperatura ambiente, se añadió éter dietílico y agua y las capas se separaron. La capa acuosa se lavó con éter dietílico y aciduló mediante la adición de ácido clorhídrico 2 N. El precipitado formado se extrajo con MTB-éter (3x), la capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró a vacío para proporcionar 246 mg de

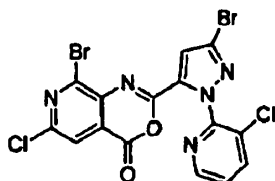


en forma de un sólido de color amarillo.

25 RMN H^1 (DMSO- D_6) δ (ppm): 6,82 (2H, s ancho), 7,61 (1H, s).

Etapa 2: Preparación de 8-bromo-2-[5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-6-cloro-pirido[3,4-d][1,3]oxazin-4-ona

30 Una mezcla de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (ejemplo 1, etapa 5) (1,20 g) y cloruro de tionilo (870 μ l) se agitó a reflujo durante 2 horas. El cloruro de tionilo en exceso se evaporó simultáneamente con tolueno seco en un evaporador, el residuo se volvió a disolver en acetonitrilo seco (12 mL) y ácido 3-amino-2-bromo-6-cloroisonicotínico (750 mg). La solución se agitó durante 10 minutos a temperatura ambiente y se añadió trietilamina (560 μ L) y se agitó durante 20 minutos, antes de añadir una segunda porción de trietilamina (1,20 mL). Después de agitar la mezcla de reacción durante 20 minutos adicionales a temperatura ambiente, se añadió cloruro de metanosulfonilo (340 μ L). Después de agitar durante 20 horas a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se sofocó por medio de la adición lenta de agua. El precipitado se separó mediante filtración, se lavó con agua/acetonitrilo [1 : 2], acetonitrilo y éter dietílico y se secó a vacío para proporcionar 598 mg del compuesto del

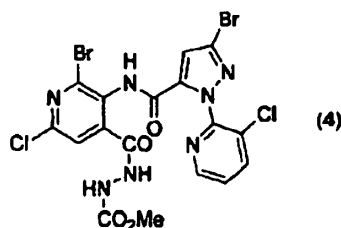


en forma de un sólido de color beige.

45 RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 7,32 (1H, s), 7,50 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 7,94 (1H, s), 8,00 (1H, d, $J = 8$ Hz), 8,55 (1H, d, $J = 5$ Hz).

Etapas 3: Preparación de éster metílico de ácido N'-(2-bromo-3-([5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino)-6-cloropiridin-4-carbonil)-hidrazincarboxílico (4)

La 8-bromo-2-[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-6-cloro-pirido[3,4-d][1,3]oxazin-4-ona (400 mg) se disolvió en DMF (12 mL) y se añadió éster metílico de ácido carbazico (696 mg). La solución se agitó durante 22 horas a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se sofocó con agua y se extrajo con MTB-éter. La capa orgánica se lavó 3x con agua, salmuera, se secó sobre MgSO₄ y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, cloroformo/acetato de etilo = 1:1, R_f = 0,20) para proporcionar 330 mg del compuesto 4 de la presente invención de fórmula

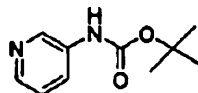


en forma de un sólido de color blanco.

RMN ¹H (DMSO-D₆) δ (ppm): 3,45-3,63 (3H, m ancho), 7,42 (1H, s), 7,59-7,63 (2H, m), 8,17 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8,51 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9,47 (1H, s ancho), 10,44 (1H, s), 10,76 (1H, s).

Ejemplo 5: Preparación de éster metílico de ácido N'-(2,6-dibromo-3-([5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino)piridin-4-carbonil)-hidrazincarboxílico (5)**Etapas 1: Preparación de éster terc-butílico de ácido piridin-3-il-carbámico**

La 3-aminopiridina (20,0 g) se disolvió en terc-butanol (300 mL), se añadió dicarbonato de di-terc-butílico (52,0 g) y la solución se agitó a 50°C durante 5 horas, a continuación durante 12 horas a temperatura ambiente y otras 7 horas a 50°C. El disolvente se evaporó en un evaporador rotativo y el residuo se disolvió en acetato de etilo. La capa orgánica se lavó tres veces con agua, se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO₄ y se concentró a vacío. El residuo se purificó dos veces mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/acetato de etilo - 1:1, a continuación 1:2, R_f = 0,15) para proporcionar 6,20 g del compuesto del título de fórmula

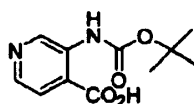


en forma de un sólido de color amarillo.

RMN ¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm) : 1,53 (9H, s), 6,71 (1H, s), 7,24 (1H, dd, J = 8 Hz, 5Hz), 7,99 (1H, d, J = 8 Hz), 8,28 (1H, d, J = 5 Hz), 8,45 (1H, d, J = 2 Hz).

Etapas 2: Preparación de ácido 3-terc-butoxicarbonilamino-isonicotínico

El éster terc-butílico de ácido piridin-3-il-carbámico (6,20 g) se disolvió en éter dietílico anhidro (260 mL), se enfrió a -78°C y se añadió N,N,N',N'-tetrametilendiamina (14,4 mL). Una solución de n-butil litio (1,6 M en hexano, 60 mL) se añadió lentamente a lo largo de un período de tiempo de 10 minutos. Una vez completada la adición del reactivo, la mezcla de reacción se dejó templando a -10°C y se agitó a esta temperatura durante 2 horas. La mezcla de reacción se volvió a enfriar a continuación a -78°C y se vertió lentamente en una mezcla agitada de hielo seco en éter dietílico. Después de agitar durante 30 minutos, se añadió agua a la mezcla de reacción y las capas se separaron después de la disolución completa de las materias sólidas. La capa acuosa se lavó 2x con éter dietílico y el valor de pH de la capa acuosa se ajustó a 5-6. La capa orgánica se extrajo 2x con MTB-éter. La capa orgánica combinada se lavó con una pequeña cantidad de salmuera, se secó sobre MgSO₄ y se concentró a vacío. El residuo se lavó con hexano para eliminar los subproductos oleosos y se secó a vacío para proporcionar 1,19 g del compuesto del título en forma de un sólido de color beige. El lavado acuoso se concentró en un evaporador rotativo hasta aprox. 50 mL, las sales inorgánicas se separaron mediante filtración y se añadió MTB-éter a las aguas madre. Se añadió lentamente ácido clorhídrico 6N a la mezcla bien agitada hasta que el valor de pH se ajustó a -3. Las capas se separaron, la capa acuosa se lavó 2x con MTB-éter y 2x con cloroformo. La capa orgánica combinada se secó sobre MgSO₄ y se secó a vacío para producir otros 2,03 g de sólido de color beige. Junto con el primer extracto orgánico, se aislaron 3,22 g del compuesto del título de fórmula

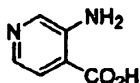


en forma de un sólido de color beige. El compuesto se utilizó en la siguiente etapa sin purificación adicional.

5 RMN H^1 (DMSO- D_6) δ (ppm): 1,47 (9H, s), 7,74 (1H, d, $J = 5$ Hz), 8,34 (1H, d, $J = 5$ Hz), 9,35 (1H, s), 10,07 (1H, s).

Etapa 3: Preparación de ácido 3-aminoisonicotínico

10 El ácido 3-*tert*-butoxicarbonilamino-isonicotínico (450 mg) se disolvió en metanol (8 mL) y se añadió ácido clorhídrico 6N (5 mL) a la solución. La suspensión resultante se agitó a reflujo durante 2,5 horas, se enfrió a temperatura ambiente y se lavó 3x con cloroformo. La capa acuosa se ajustó a pH-14 mediante la adición de una solución de hidróxido de sodio 2 N, se lavó 3x con cloroformo y se ajustó de nuevo a pH 3 mediante la adición de ácido clorhídrico 2 N. La capa acuosa se concentró en un evaporador rotativo hasta sequedad completa y el residuo se extrajo con etanol caliente. El extracto en etanol se filtró para eliminar la materia insoluble y se concentró a vacío para proporcionar 262 mg del compuesto del título de fórmula

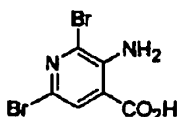


en forma de un sólido de color amarillo. El compuesto se utilizó en la siguiente etapa sin purificación adicional.

20 RMN H^1 (DMSO- D_6) δ (ppm): 7,78 (1H, d, $J = 5$ Hz), 7,84 (1H, d, $J = 5$ Hz), 8,30 (1H, s).

Etapa 4: Preparación de ácido 3-amino-2,6-dibromoisonicotínico

25 El ácido 3-aminoisonicotínico (260 mg) se disolvió en DMF (10 mL), se añadió *N*-bromosuccinimida (320 mg) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora antes de añadir otra porción de *N*-bromosuccinimida (320 mg). Después de agitar durante 3 horas a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se sofocó con agua. Se añadió una solución de hidróxido de sodio 2 N, la solución acuosa se lavó 2x con éter dietílico y se ajustó a pH-2 mediante la adición de ácido clorhídrico 6 N. La capa acuosa se extrajo 3x con MTB-éter, la capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró a vacío para proporcionar 283 mg del compuesto del título de fórmula

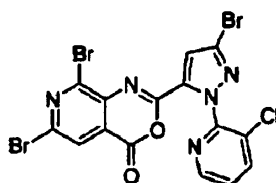


35 en forma de un sólido de color amarillo-naranja. El compuesto estaba contaminado con aprox. 10% de impurezas y se utilizó sin purificación adicional en la siguiente etapa.

RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 6,16 (2H, s ancho), 7,61 (1H, s).

Etapa 5: Preparación de 6,8-dibromo-2-[5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-pirido[3,9-d][1,3]oxazin-4-ona

40 Una mezcla de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (ejemplo 1, etapa 5) (242 mg) y cloruro de tionilo (180 μ l) se agitó a reflujo durante 2 horas. El cloruro de tionilo en exceso se evaporó simultáneamente con tolueno seco en un evaporador, el residuo se volvió a disolver en acetonitrilo seco (3 mL) y se añadió ácido 3-amino-2,6-dibromoisonicotínico (282 mg). La solución se agitó durante 10 minutos a temperatura ambiente y se añadió trietilamina (110 μ L) y se agitó durante 20 minutos, antes de añadir una segunda porción de trietilamina (220 μ L). Después de agitar la mezcla de reacción durante 20 minutos adicionales a temperatura ambiente, se añadió cloruro de metanosulfonilo (75 μ L). Después de agitar durante 18 horas a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se sofocó por medio de la adición lenta de agua. El precipitado se separó mediante filtración, se lavó con agua/acetronitrilo (1:2), acetronitrilo y éter dietílico y se secó a vacío para proporcionar 153 mg del compuesto del título de fórmula



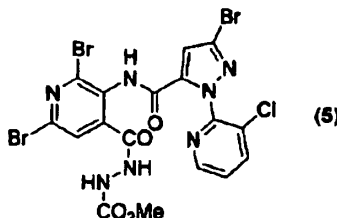
en forma de un sólido de color beige.

5 RMN ¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 7,32 (1H, s), 7,50 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 8,00 (1H, d, J = 8 Hz), 8,09 (1H, s), 8,56 (1H, d, J = 5 Hz).

Etapa 6: Preparación de éster metílico de ácido N'-(2,6-dibromo-3-([5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino)piridin-4-carbonil)-hidrazincarboxílico (5)

10 La 6,8-dibromo-2-[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-pirido[3,9-d][1,3] oxazin-4-ona (153 mg) se disolvió en DMF (7 mL) y se añadió éster metílico de ácido carbazicoico (240 mg). La solución se agitó durante 19 horas a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se sofocó con agua y se extrajo con MTB-éter. La capa orgánica se lavó 3x con agua, salmuera, se secó sobre MgSO₄ y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, cloroformo/acetato de etilo = 1:1, R_f = 0,20) para proporcionar 128 mg de compuesto 5 de la presente invención de fórmula

15



en forma de un sólido de color beige.

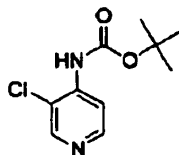
20 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ (ppm): 3,49-3,62 (3H, m), 7,42 (1H, s), 7,61 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7,70 (1H, s), 8,17 (1H, d, J = 8 Hz), 8,50 (1H, d, J = 5 Hz), 9,46 (1H, s ancho), 10,44 (1H, s), 10,75 (1H, s).

Ejemplo 6: Preparación de éster metílico de ácido N'-(4-([5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino)-5-cloropiridin-3-carbonil)-hidrazincarboxílico (6)

25 **Etapa 1: Preparación de éster terc-butílico de ácido (3-cloro-piridin-4-il)-carbámico**

El ácido 3-cloro-isonicotínico (3,0 g) se disolvió en terc-butanol (80 mL), se añadieron difenilfosforilazida (5,24 g) y trietilamina (2,7 mL) y la mezcla de reacción se agitó a 100°C durante 5,5 h. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se concentró a vacío y el residuo se disolvió en acetato de etilo y agua. Las capas se separaron y la capa acuosa se extrajo dos veces con acetato de etilo, la capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/acetato de etilo 3:1, R_f = 0,30) para proporcionar 2,74 g del compuesto del título de fórmula

30



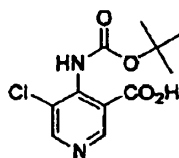
35 en forma de un sólido de color blanco.

40 RMN ¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm) : 1,55 (9H, s), 7,18 (1H, s ancho), 8,15 (1H, d, J = 6 Hz), 8,36 (1H, d, J = 6 Hz), 8,46 (1H, s).

Etapa 2: Preparación de ácido 4-terc-butoxicarbonilamino-5-cloronicotínico

45 El éster terc-butílico de ácido (3-cloro-piridin-4-il)-carbámico (1,50 g) se disolvió en éter dietílico seco (35 mL), N,N,N',N'-tetrametilenetilendiamina (2,35 mL) y la mezcla de reacción se enfrió en un baño refrigerante de hielo seco/acetona a -78°C. Se añadió n-butil litio (9,9 mL, 1,59 M en hexano) a la suspensión, el baño refrigerante se reemplazó por una mezcla de cloruro de sodio/hielo y la mezcla de reacción se agitó a -10°C durante 1,5 h. La

5 suspensión se vertió lentamente sobre hielo triturado (2,0 g) en éter dietílico seco (20 mL) y se agitó durante 1 h. Se añadió agua y el pH se ajustó a -12 mediante la adición de 2 N sodio hidróxido solución. La capa acuosa se lavó 2x con MTB-éter, se añadió ácido clorhídrico 2 M a la capa acuosa y el pH se ajustó a -2 y la capa acuosa se extrajo tres veces con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío para proporcionar 1,03 g del compuesto del título de fórmula

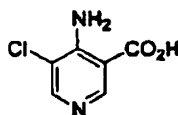


10 en forma de un sólido de color beige. El producto bruto contenía ~30% de ácido valérico y se utilizó sin purificación adicional en la siguiente etapa.

RMN ^1H (DMSO- D_6) δ (ppm); 1,44 (9H, s), 8,72 (1H, s), 8,74 (1H, s), 9,49 (1H, s), 13,29 (1H, s ancho).

15 **Etapa 3: Preparación de ácido 4-amino-5-cloro-nicotínico**

El ácido 4-*tert*-butoxicarbonilamino-5-cloro-nicotínico (1,03 g, producto bruto de la etapa 2 en una mezcla ~3:1 con ácido valérico) se disolvió en metanol (10 mL), se añadió ácido clorhídrico 5 M (10 mL) y la mezcla de reacción se agitó durante 1,5 h bajo un leve reflujo. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla se concentró a vacío, el residuo se disolvió en agua y la mezcla se ajustó a pH ~ 12 mediante la adición de una solución de hidróxido de sodio 2 N. La capa acuosa se lavó 2x con una mezcla de MTB-éter/hexano (1:1), a continuación se añadió ácido clorhídrico 5 M y la capa acuosa se ajustó a pH - 2. La capa acuosa se lavó 2x con acetato de etilo y la capa acuosa se concentró a continuación a vacío hasta sequedad. El residuo se disolvió 3x en metanol/tolueno y se co-evaporó hasta sequedad para eliminar las trazas de agua. El residuo se suspendió en metanol (50 mL), se agitó a reflujo durante 30 min se enfrió a temperatura ambiente y las sales insolubles se eliminaron mediante filtración. El producto filtrado se concentró y se secó a vacío para proporcionar 1,59 g de un sólido de color amarillo que contenía el compuesto del título de fórmula

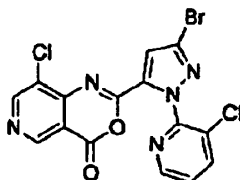


30 El producto bruto todavía contenía sales inorgánicas y se utilizó en la siguiente etapa sin purificación adicional.

RMN ^1H (DMSO- D_6) δ (ppm): 8,60-9,03 (2H, m ancho), 8,71 (1H, s), 8,73 (1H, s).

35 **Etapa 4: Preparación de 2-[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-8-cloro- pirido[4,3-d][1,3]oxazin-4-ona**

El ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (ejemplo 1, etapa 5) (696 mg) se suspendió en tolueno seco (20 mL), se añadieron cloruro de oxalilo (580 μL) y 3 gotas de DMF seca (desprendimiento de gas) y la mezcla de reacción se agitó durante 1 h a temperatura ambiente. La mezcla se concentró a vacío y el cloruro de oxalilo en exceso se eliminó mediante co-evaporación con tolueno seco (3x). El residuo se disolvió en acetonitrilo seco (20 mL) y se añadieron ácido 4-amino-5-cloro-nicotínico (mezcla bruta de la anterior etapa 3, 1,0 g) y trietilamina (320 μL). La mezcla de reacción se agitó durante 30 minutos, antes de añadir una segunda porción de trietilamina (640 μL). Después de agitar la mezcla de reacción durante 20 minutos adicionales a temperatura ambiente, se añadió cloruro de metanosulfonilo (195 μL). Después de agitar durante 4 h a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se sofocó mediante la adición de agua (10 mL). El precipitado se separó mediante filtración, se lavó con agua/acetonitrilo (1:2), acetonitrilo y éter dietílico y se secó a vacío para proporcionar 250 mg del compuesto del título de fórmula

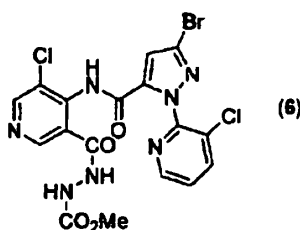


en forma de un sólido de color beige.

RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,36 (1H, s), 7,50 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 7,99 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 2 Hz), 8,55 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 2 Hz), 8,84 (1H, s), 9,24 (1H, s).

5 Etapa 5: Preparación de éster metílico de ácido *N*-(4-[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carbonil]-amino)-5-cloro-piridin-3-carbonil)-hidrazincarboxílico (6)

10 La 2-[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-il]-8-cloro-pirido[4,3-*d*][1,3]oxazin-4-ona (150 mg) se disolvió en DMF (10 mL) y se añadió éster metílico de ácido carbazico (154 mg). La solución se agitó durante 2 h a temperatura ambiente antes de sofocarla con agua. La mezcla se extrajo dos veces con acetato de etilo, la capa orgánica combinada se lavó tres veces con agua, se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, cloroformo/metanol = 20:1, a continuación 10:1, $R_f = 0,15$ en cloroformo/metanol = 10:1) para proporcionar 99 mg de compuesto (6) de la presente invención de fórmula



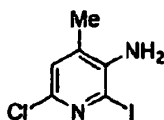
15 en forma de un sólido de color blanco

RMN ^1H ($\text{DMSO-}D_6$) δ (ppm): 3,96-3,65 (3H, m), 7,45 (1H, s), 7,61 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 8,17 (1H, d, $J = 8$ Hz), 8,51 (1H, d, $J = 5$ Hz), 8,64 (1H, s), 8,86 (1H, s), 9,40 (1H, s ancho), 10,44 (1H, s), 10,81 (1H, s).

20 Ejemplo 7: Preparación de éster metílico de ácido (*N*-(3-(5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carbonil)-amino)-6-cloro-4-metil-piridin-2-carbonil)-hidrazincarboxílico (7)

Etapa 1: Preparación de 3-amino-6-cloro-2-yodo-4-metilpiridina

25 La 5-amino-2-cloro-4-metilpiridina (1,35 g) se disolvió en DMF (20 mL), se añadió *N*-yodosuccinimida (2,59 g) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas. Se añadió acetato de etilo y la capa orgánica se lavó 3x con agua, se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/acetato de etilo = 3:1, $R_f = 0,30$) para proporcionar 1,38 g del compuesto del título de fórmula

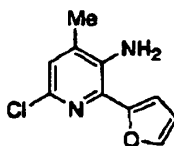


30 en forma de un sólido de color naranja.

RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm) : 2,21 (3H, s), 4,06 (2H, s ancho), 6,95 (1H, s).

35 Etapa 2: Preparación de 3-amino-6-cloro-2-(2-furanil)-4-metilpiridina

La 3-amino-6-cloro-2-yodo-4-metilpiridina (1,38 g), ácido 2-furanborónico (861 mg), y carbonato de sodio (815 mg) se suspendieron en una mezcla disolvente consistente en tolueno (19 mL), THF (19 mL) y agua (6 mL). La mezcla se desgasificó utilizando la posterior evaporación y lavando con nitrógeno (5x) y se añadió tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0) (658 mg). La mezcla de reacción se agitó a 90°C durante 5 horas y 12 horas a temperatura ambiente. Después de la adición de otra porción de ácido 2-furanborónico (430 mg) y tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0) (132 mg), la mezcla se agitó de nuevo durante 12 horas a 90°C. Después de agitar durante 12 horas a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se sofocó con agua y se extrajo 2x con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/acetato de etilo = 4:1, $R_f = 0,25$) para proporcionar 929 mg del compuesto del título de fórmula

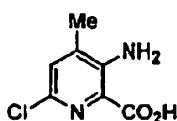


en forma de un sólido de color naranja.

RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,20 (3H, s), 4,65 (2H, s ancho), 6,56 (1H, dd, $J = 4$ Hz, 2 Hz), 6,99 (1H, s), 7,07 (1H, dd, $J = 4$ Hz, 1 Hz), 7,54 (1H, dd, $J = 2$ Hz, 1 Hz).

Etapa 3: Preparación de ácido 3-amino-6-cloro-4-metil-piridin-2- carboxílico

5 La 3-amino-6-cloro-2-(2-furanil)-4-metilpiridina (400 mg) se disolvió en acetona (10 mL) y se enfrió en un baño de hielo a 0°C . Una solución preparada de permanganato de potasio (909 mg) en agua (15 mL) se añadió gota a gota a esta solución. Después de la adición completa, la mezcla de reacción se dejó templando a temperatura ambiente y se agitó durante 2 horas. La mezcla se enfrió de nuevo a 0°C y se añadió una segunda porción de permanganato de potasio (600 mg) en agua (10 mL) y se retiró el baño refrigerante. Después de agitar durante 2 horas, la mezcla de reacción se filtró a través de un lecho de celite, La torta del filtro se lavó cuidadosamente con agua, metanol y acetato de etilo y se concentró a aprox. 10 mL en un evaporador rotativo. Se añadió una solución de hidróxido de sodio 2 N para ajustar el valor del pH a -12 y la capa acuosa se lavó 2x con MTB-éter. La capa acuosa se ajustó a continuación a pH-2 mediante la adición de ácido clorhídrico 6 N y se extrajo 3x con MTB-éter. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró a vacío para proporcionar 262 mg del compuesto del título de fórmula

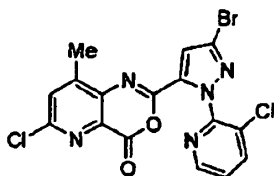


en forma de un sólido de color naranja-pardo.

20 RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,24 (3H, d, $J = 1$ Hz), 5,94 (2H, s ancho), 7,21 (1H, d, $J = 1$ Hz).

Etapa 4: Preparación de 2-[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il) -2H-pirazol-3-il]-6-cloro-8-metil-pirido[3,2-d][1,3]oxazin-4-ona

25 Una mezcla de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (ejemplo 1, etapa 5) (413 mg) y cloruro de tionilo (300 μl) se agitó a reflujo durante 2 horas. El cloruro de tionilo en exceso se evaporó simultáneamente con tolueno seco en un evaporador, el residuo se volvió a disolver en acetonitrilo seco (5 mL) y se añadió ácido 3-amino-6-cloro-4-metil-piridin-2-carboxílico (255 mg). La solución se agitó durante 15 minutos a temperatura ambiente y se añadió trietilamina (190 μL) y se agitó durante 30 minutos, antes de añadir una segunda porción de trietilamina (380 μL). Después de agitar la mezcla de reacción durante 30 minutos adicionales a temperatura ambiente, se añadió cloruro de metanosulfonilo (120 μL). Después de agitar durante 20 horas a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se sofocó por medio de la adición lenta de agua. El precipitado se separó mediante filtración, se lavó con agua/acetronitrilo (1:2), acetonitrilo y éter dietílico y se secó a vacío para proporcionar 112 mg del compuesto del título de fórmula

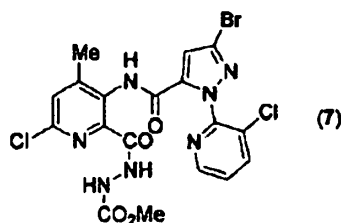


35 en forma de un sólido de color beige.

40 RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,89 (3H, d, $J = 1$ Hz), 7,29 (1H, s), 7,47 (1H, d, $J = 1$ Hz), 7,50 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 7,98 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 2 Hz), 8,56 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 2 Hz).

Etapa 5: Preparación de éster metílico de ácido (N'-3-((5-bromo-2-(3-cloro-piridin -2-il)-2H-pirazol-3-carbonil)-amino)-6-cloro-4-metilpiridin-2-carbonil)-hidrazincarboxílico (7)

45 La 2-[5-Bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-6-cloro-8-metil-pirido[3,2-d][1,3]oxazin-4-ona (112 mg) se disolvió en DMF (7 mL) y se añadió éster metílico de ácido carbazico (223 mg). La solución se agitó durante 3,5 horas, se secó sobre MgSO_4 y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, cloroformo/acetato de etilo = 3:1, $R_f = 0,25$) para proporcionar 113 mg de compuesto 7 de la presente invención de fórmula



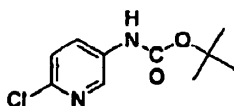
en forma de un sólido de color blanco.

5 RMN H^1 (DMSO- D_6) δ (ppm): 2,19 (3H, s), 3,50-3,61 (3H, m ancho), 7,42 (1H, s), 7,62 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 7,73 (1H, s), 8,18 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 2 Hz), 8,50 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 2 Hz), 9,27 (1H, s ancho), 10,41 (1H, s), 10,56 (1H, s).

Preparación alternativa de éster metílico de ácido N' -(3-([5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino)-6-cloro-4-metil-piridin-2-carbonil)-hidrazincarboxílico (7)

10 **Etapas 1: Preparación de éster terc-butílico de ácido (6-cloro-piridin-3-il)-carbámico**

Se disolvió 6-cloro-piridin-3-ilamina (10,0 g) en *tert*-butanol (140 mL), se añadió dicarbonato de di-*tert*-butilo (18,7 g) y la solución se agitó a 50°C durante 4 h. Se añadió dicarbonato de di-*tert*-butilo (3,40 g) y la mezcla de reacción se agitó durante otras 8 h a 50°C. La mayoría del disolvente se eliminó a vacío y el residuo se disolvió en acetato de etilo y se lavó 3x con agua, se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, cloroformo/acetato de etilo 10:1, $R_f = 0,30$) para proporcionar 16,5 g del compuesto del título de fórmula

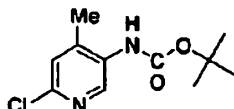


20 en forma de un sólido de color blanco.

RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 1,52 (9H, s), 6,54 (1H, s ancho), 7,27 (1H, d, $J = 3$ Hz), 7,96 (1H, s), 8,23 (1H, d, $J = 3$ Hz).

25 **Etapas 2: Preparación de éster terc-butílico de ácido (6-cloro-4-metil-piridin-3-il)-carbámico**

El éster terc-butílico de ácido (6-cloro-piridin-3-il)-carbámico (14,11 g) se disolvió en éter dietílico seco (310 mL), se añadió N,N,N',N' -tetrametil-etilen-1,2-diamina (23,1 mL). La solución se enfrió a -78°C, se añadió *n*-butil litio (97 mL, 1,59 M en hexano), el baño refrigerante se reemplazó por un baño refrigerante de hielo/cloruro de sodio y la suspensión se agitó durante 2 h a -10°C. La suspensión se enfrió de nuevo a -78°C y se añadió lentamente yoduro de metilo (5,8 mL). El baño refrigerante se retiró y la reacción se sofocó al cabo de 1 h mediante la adición de agua. Se añadió acetato de etilo y la mezcla se neutralizó mediante la adición de ácido clorhídrico 2 M. Las capas se separaron y la capa acuosa se extrajo 2x con acetato de etilo, la capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/acetato de etilo 5:1, $R_f = 0,10$) para proporcionar 4,24 g del compuesto del título de fórmula



en forma de un sólido de color amarillo.

40 RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 1,52 (9H, s), 2,26 (3H, s), 6,21 (1H, s), 7,13 (1H, s), 8,69 (1H, s).

Etapas 3: Preparación de éster terc-butílico de ácido (6-cloro-4-metil-1-oxi-piridin-3-il)-carbámico

45 El éster terc-butílico de ácido (6-cloro-4-metil-piridin-3-il)-carbámico (4,24 g) se disolvió en cloroformo (40 mL), se añadió ácido 3-cloroperoxisobenzoico (5,87 g, 77%) y la solución se agitó a temperatura ambiente durante 21 h. Se añadió una segunda porción de ácido 3-cloroperoxisobenzoico (1,17 g) y la mezcla de reacción se agitó durante 5 h a temperatura ambiente. Se añadió cloroformo hasta la completa disolución de los sólidos y la fase orgánica se lavó con una solución de hidróxido de sodio 2 N. El lavado acuoso se volvió a extraer una vez con cloroformo y la capa

orgánica combinada se lavó de nuevo con una solución de hidróxido de sodio 2 N, agua, salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío para proporcionar 4,40 g del compuesto del título de fórmula

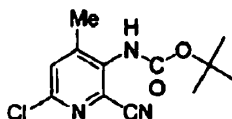


5 en forma de un sólido de color blanco. El producto bruto se utilizó sin purificación adicional en la siguiente etapa.

RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,52 (9H, s), 2,24 (3H, s), 6,24 (1H, s), 7,22 (1H, s), 9,13 (1H, s).

10 Etapa 3: Preparación de éster terc-butílico de ácido (6-cloro-2-ciano-4-metil-piridin-3-il)-carbámico

El éster terc-butílico de ácido (6-cloro-4-metil-1-oxi-piridin-3-il)-carbámico (4,40 g) se suspendió en acetonitrilo seco (50 mL), se añadieron cianuro de trimetilsililo (7,2 mL) y trietilamina (5,37 mL) y la mezcla de reacción se agitó a reflujo durante 2 h. Después de dejar estar durante 15 h a temperatura ambiente, se añadieron cianuro de trimetilsililo (4,4 mL) y trietilamina (3,65 mL) y la mezcla de reacción se agitó durante otras 4 h a reflujo. Se añadieron agua y una solución de hidróxido de sodio 2 N después de enfriar a temperatura ambiente y la mezcla se extrajo tres veces con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/acetato de etilo = 5:1, a continuación 4:1, R_f = 0,20 en hexano/acetato de etilo = 4,1) para proporcionar 3,72 g del compuesto del título de fórmula

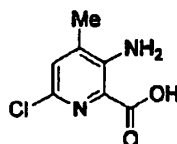


en forma de un sólido de color amarillo.

25 RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,52 (9H, s), 2,36 (3H, s), 6,43 (1H, s), 7,42 (1H, s).

Etapa 4: Preparación de ácido 3-amino-6-cloro-9-metil-piridin-2-carboxílico

El éster terc-butílico de ácido (6-cloro-2-ciano-4-metil-piridin-3-il)-carbámico (3,72 g) se disolvió en ácido sulfúrico concentrado (19 mL) y se agitó durante 1 h a 100°C. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se añadió lentamente agua (19 mL). La mezcla de reacción se calentó de nuevo a 100°C y se agitó a esta temperatura durante 2 h. Se añadió agua después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla se enfrió en un baño de hielo y el pH se ajustó a ~14 por medio de la adición lenta de hidróxido de sodio sólido. La solución acuosa se lavó 2x con MTB-éter, la capa acuosa se ajustó a continuación a pH -2 mediante la adición de ácido clorhídrico 5 M y se extrajo 3x con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío para proporcionar 2,25 g del compuesto del título de fórmula



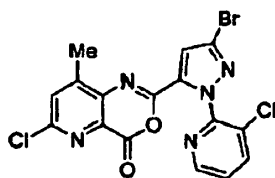
40 en forma de un sólido de color beige.

RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,24 4 (3H, s), 5,96 (2H, s), 7,20 (1H, s), 10,69 (1H, s ancho).

45 Etapa 5: Preparación de 2-[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-6-cloro-8-metil-pirido[3,2-d][1,3]oxazin-4-ona

El ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (ejemplo 1, etapa 5) (3,65 g) se suspendió en tolueno seco (50 mL), se añadieron cloruro de oxalilo (3,10 mL) y 10 gotas de DMF seca (desprendimiento de gas) y la mezcla de reacción se agitó durante 1 h a temperatura ambiente. La mezcla se concentró a vacío y el cloruro de oxalilo en exceso se eliminó mediante co-evaporación con tolueno seco (3x). El residuo se disolvió en acetonitrilo seco (20 mL) y se añadió a una suspensión de ácido 3-amino-6-cloro-4-metil-piridin-2-carboxílico (2,25 g) en acetonitrilo (30 mL). Se añadió trietilamina (1,7 mL) y la mezcla de reacción se agitó durante 20 minutos, antes de

añadir una segunda porción de trietilamina (3,4 mL). Después de agitar la mezcla de reacción durante 50 minutos adicionales a temperatura ambiente, se añadió cloruro de metanosulfonilo (1,03 mL). Después de agitar durante 18 horas a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se concentró a -25 mL y se añadió agua (20 mL). El precipitado se separó mediante filtración, se lavó con agua/acetonitrilo (1:2), acetonitrilo y éter dietílico y se secó a vacío para proporcionar 3,97 g del compuesto del título de fórmula

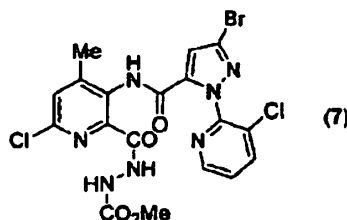


en forma de un sólido de color amarillo.

RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 1,89 (3H, d), 7,29 (1H, s), 7,47 (1H, s), 7,50 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5Hz), 7,98 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 2 Hz), 8,56 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 2 Hz).

Etapa 6: Preparación de éster metílico de ácido (*N'*-3-{[5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carbonil]-amino}-6-cloro-4-metil-piridin-2-carbonil)-hidrazincarboxílico (7)

La 2-[5-Bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-il]-6-cloro-8-metil-pirido[3,2-*d*][1,3]oxazin-4-ona (500 mg) se disolvió en DMF (28 mL) y se añadió éster metílico de ácido carbazoico (994 mg). La solución se agitó durante 3,5 h a temperatura ambiente antes de sofocarla con agua. La mezcla se extrajo 2x con acetato de etilo, la capa orgánica combinada se lavó tres veces con agua, se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, cloroformo/acetato de etilo = 3:1, $R_f = 0,25$) para proporcionar 541 mg del compuesto (7) de la presente invención de fórmula



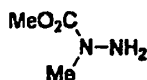
en forma de un sólido de color blanco.

RMN H^1 ($DMSO-D_6$) δ (ppm): 2,19 (3H, s), 3,50-3,61 (3H, m ancho), 7,42 (1H, s), 7,62 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 7,73 (1H, s), 8,18 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 2 Hz), 8,50 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 2 Hz), 9,27 (1H, s ancho), 10,41 (1H, s), 10,56 (1H, s).

Ejemplo 8: Preparación de éster metílico de ácido *N'*-3-{[5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carbonil]-amino}-6-cloro-4-metil-piridin-2-carbonil)-*N*-metil-hidrazincarboxílico (8)

Etapa 1: Preparación de éster metílico de ácido *N*-metil-hidrazin-carboxílico

La monometilhidrazina (10,6 mL) se disolvió en metanol (50 mL) y se añadió hidróxido de sodio (8,0 g). La suspensión se enfrió con un baño de hielo y se añadió gota a gota cloroformiato de metilo (15,4 mL) (¡reacción violenta!), se retiró el baño de hielo y la suspensión se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. El precipitado de color blanco se separó mediante filtración, se lavó con metanol y el producto filtrado se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante destilación (50-80°C /15 mmHg) para proporcionar 13,4 g del compuesto del título de fórmula

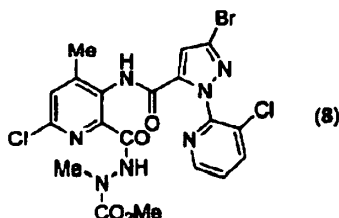


en forma de un aceite incoloro.

RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 3,11 (3 H, s), 3,73 (3 H, s), 4,13 (2 H, s ancho).

Etapa 2: Preparación de éster metílico de ácido *N'*-3-{[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carbonil]-amino}-6-cloro-4-metilpiridin-2-carbonil)-*N*-metil-hidrazincarboxílico (8)

La 2-[5-Bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-6-cloro-8-metil-pirido[3,2-d][1,3]oxazin-4-ona (140 mg) (ejemplo 7, etapa 4) se disolvió en DMF (10 mL) y se añadió éster metílico de ácido *N*-metil-hidrazincarboxílico (161 mg). La solución se agitó durante 3 horas a 80°C, a continuación 12 horas a temperatura ambiente y de nuevo durante 3,5 horas a 80°C. La mezcla de reacción se sofocó se diluyó con MTB-éter y se lavó 4x con agua, se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO₄ y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (hexano/acetato de etilo 2:1, a continuación 1,5:1, R_f = 0,15 en hexano/acetato de etilo = 2:1) para proporcionar 112 mg de compuesto **8** de la presente invención de fórmula



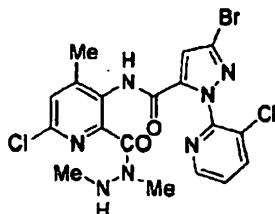
en forma de un sólido de color blanco.

RMN H¹ (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 2,26 (3H, s), 3,28 (3H, s), 3,77 (3H, s ancho), 7,11 (1H, s), 7,35 (1H, s), 7,39 (1H, dd, *J* = 8 Hz, 5 Hz), 7,86 (1H, dd, *J* = 8 Hz, 2 Hz), 8,47 (1H, dd, *J* = 5 Hz, 2 Hz), 9,58 (1H, s), 11,06 (1H, s).

Ejemplo 9: Preparación de éster metílico de ácido *N'*-(3-{[5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino}-6-cloro-4-metil-piridin-2-carbonil)-*N,N'*-dimetilhidrazincarboxílico (9)

Etapa 1: Preparación de [6-cloro-2-(*N,N'*-dimetilhidrazinocarbonil)-4-metil-piridin-3-il]-amiduro de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico

El dihidrocloruro 1,2-dimetilhidrazina (176 mg) y carbonato de potasio (366 mg) se suspendieron en THF (8 mL) y 10 gotas de agua, se añadió 2-[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-6-cloro-8-metil-pirido[3,2-d][1,3]oxazin-4-ona (ejemplo 7, etapa 4) (300 mg) y la mezcla de reacción se agitó durante 20 h a temperatura ambiente. Se añadieron agua y acetato de etilo, las capas se separaron y la capa acuosa se extrajo 2x con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, cloroformo/acetato de etilo = 1:1, R_f = 0,13) para proporcionar 300 mg del compuesto del título de fórmula

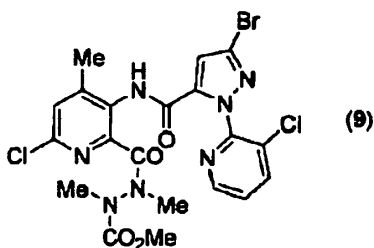


en forma de un sólido de color blanco.

RMN H¹ (CDCl₃, TMS) δ (ppm) : 2,10 (1,5H, s), 2,13 (1,5H, s), 2,43 (1,5H, s), 2,66 (1,5H, s), 3,00 (1,5H, s), 3,23 (1,5H, s), 3,97 (0,5H, s ancho), 5,52 (0,5H, s ancho), 7,04 (0,5H, s), 7,11 (0,5H, s), 7,26 (0,5H, s), 7,32 (0,5H, s), 7,35-7,40 (1,0H, m), 7,82-7,87 (1,0H, m), 8,43-8,47 (1,0H, m), 10,07 (0,5H, s), 10,16 (0,5H, s).

Etapa 2: Preparación de éster metílico de ácido *N'*-(3-{[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino}-6-cloro-4-metilpiridin-2-carbonil)-*N,N'*-dimetil-hidrazincarboxílico

El [6-cloro-2-(*N,N'*-dimetil-hidrazinocarbonil)-4-metil-piridin-3-il]-amiduro de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (250 mg) se disolvió en piridina (3 mL), se añadió cloroformiato de metilo (150 µL) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente. Al cabo de 30 min, 1 h y 1,5 h, se añadió cloroformiato de metilo (cada vez 75 µL). Al cabo de 1 h de agitación a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se sofocó con agua y co-evaporó 3x con tolueno. El residuo se disolvió en agua y acetato de etilo, las capas se separaron y la capa acuosa se extrajo 2x con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/acetato de etilo = 1:1, R_f = 0,20) para proporcionar 223 mg de compuesto (9) de la presente invención de fórmula



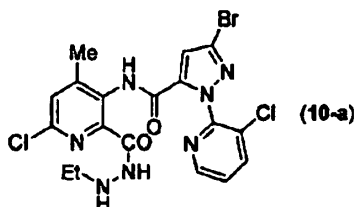
en forma de un sólido de color blanco.

RMN H^1 (DMSO- D_6) δ (ppm): 2,17 (1,5H, s), 2,24 (1,5H, s), 2,77 (1,5H, s), 2,84-2,85 (1,5H, m), 2,91-2,93 (1,5H, m), 3,09 (1,5H, s), 3,49 (2,5H, s), 3,69 (0,5H, s), 7,35-7,39 (1,0H, m), 7,61-7,68 (2,0H, m), 8,19-8,22 (1,0H, m), 8,49-8,52 (1,0H, m), 10,51-10,65 (1,0H, m ancho).

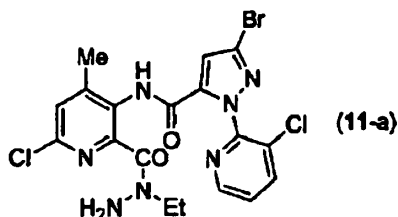
Ejemplo 10: Preparación de éster metílico de ácido *N'*-(3-{[5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carbonil]-amino}-6-cloro-4-metil-piridin-2-carbonil)-*N*-etil-hidrazincarboxílico (10) y *N'*-(3-{[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carbonil]-amino}-6-cloro-4-metil-piridin-2-carbonil)-*N'*-etil-hidrazincarboxílico (11)

Etapa 1: Preparación de [6-cloro-2-(*N'*-etilhidrazidocarbonil)-4-metil-piridin-3-il]-amiduro de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carboxílico (10-a) y [6-cloro-2-(*N*-etil-hidrazinocarbonil)-4-metilpiridin-3-il]-amiduro de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carboxílico (11-a)

La 2-[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-il]-6-cloro-8-metil-pirido[3,2-*d*][1,3]oxazin-4-ona (ejemplo 7, etapa 4) (600 mg) se suspendió en THF (16 mL), y se añadieron oxalato de etilhidrazina (398 mg) y carbonato de potasio (732 mg) y la mezcla de reacción se agitó durante 19 h a temperatura ambiente. Se añadieron agua y acetato de etilo y las capas se separaron. La capa acuosa se extrajo 1x con acetato de etilo, la capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, cloroformo/acetato de etilo 5:1, a continuación 3:1, a continuación 1:1, R_f (10-a) = 0,45, R_f (11-a) = 0,15 en cloroformo/acetato de etilo = 1:1) para proporcionar 380 mg del compuesto del título (10-a) de fórmula



en forma de un sólido de color blanco
y 228 mg del compuesto del título (11-a) de fórmula



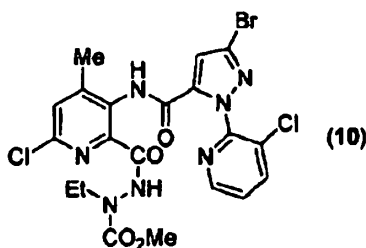
en forma de un sólido de color blanco.

(10-a) : RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 1,18 (3H, t, $J = 7$ Hz), 2,25 (3H, s), 2,99 (2H, q, $J = 7$ Hz), 4,69 (1H, s ancho), 7,13 (1H, s), 7,29 (1H, s), 7,39 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 7,86 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 2 Hz), 8,48 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 2 Hz), 9,18 (1H, s ancho), 11,45 (1H, s).

(11-a): RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 1,09-1,19 (3,0H, m), 2,08 (1,7H, s), 2,11 (1,3H, s), 3,28 (0,8H, q, $J = 7$ Hz), 3,63 (1,2H, q, $J = 7$ Hz), 4,16 (1,2H, s), 4,45 (0,8H, s), 7,01 (0,6H, s), 7,09 (0,4H, s), 7,31-7,33 (1,0H, m), 7,35-7,41 (1,0H, m), 7,83-7,88 (1,0H, m), 8,43-8,48 (1,0H, m), 10,24 (0,4H, s), 10,56 (0,6H, s).

Etapa 2: Preparación de éster metílico de ácido *N'*-(3-{[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carbonil]-amino}-6-cloro-9-metilpiridin-2-carbonil)-*N*-etil-hidrazincarboxílico (10)

El [6-cloro-2-(*N'*-etil-hidrazinocarbonil)-4-metilpiridin-3-il]-amiduro de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carboxílico (**10-a**) (320 mg) se disolvió en piridina (4 mL), se añadió cloroformiato de metilo (190 μ L) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente. Al cabo de 30 min, 1 h y 1,5 h, se añadió cloroformiato de metilo (cada vez 95 μ L). Al cabo de 1 h de agitación a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se sofocó con agua y se co-evaporó 3x con tolueno. El residuo se disolvió en agua y acetato de etilo, las capas se separaron y la capa acuosa se extrajo 2x con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/acetato de etilo = 2:1, R_f = 0,10) para proporcionar 308 mg del compuesto del título (**10**) de la presente invención de fórmula

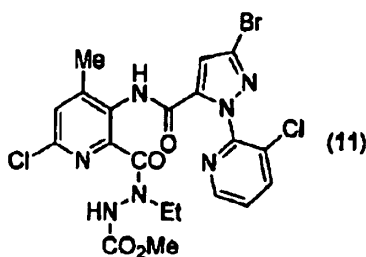


en forma de un sólido de color blanco.

RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 1,22 (3H, t, J = 7 Hz), 2,26 (3H, s), 3,69 (2H, q, J = 7 Hz), 3,76 (3H, s), 7,10 (1H, s), 7,35 (1H, s), 7,39 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7,86 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8,48 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9,52 (1H, s), 11,09 (1H, s).

Etapa 3: éster metílico de ácido *N'*-(3-{[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carbonil]-amino}-6-cloro-4-metil-piridin-2-carbonil)-*N'*-etil-hidrazinocarboxílico (11)

El [6-cloro-2-(*N'*-etil-hidrazinocarbonil)-4-metilpiridin-3-il]-amiduro de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carboxílico (**11-a**) (177 mg) se disolvió en piridina (2 mL), se añadió cloroformiato de metilo (100 μ L) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente. Al cabo de 30 min, 1 h y 1,5 h, se añadió cloroformiato de metilo (cada vez 50 μ L). Al cabo de 14 h de agitación a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se sofocó con agua y se co-evaporó 3x con tolueno. El residuo se disolvió en agua y acetato de etilo, las capas se separaron y la capa acuosa se extrajo 2x con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, cloroformio/acetato de etilo - 3:1, R_f = 0,10) para proporcionar 135 mg del compuesto del título (**11**) de la presente invención de fórmula



en forma de un sólido de color blanco.

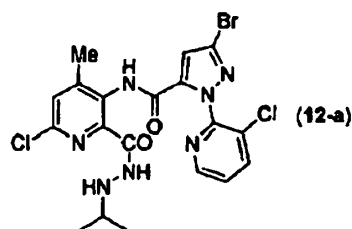
RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 1,14-1,27 (3H, m), 2,17 (3H, s), 3,62-3,80 (5H, m), 7,12 (2H, s), 7,20-7,22 (1H, m), 7,39 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7,87 (1H, dd, J = 8 Hz), 8,46 (1H, d, J = 5 Hz), 9,53 (1H, s ancho).

Ejemplo 11: Preparación de éster metílico de ácido *N'*-(3-{[5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carbonil]-amino}-6-cloro-4-metil-piridin-2-carbonil)-*N'*-isopropil-hidrazinocarboxílico (12) y éster metílico de ácido *N'*-(3-{[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carbonil]-amino}-6-cloro-4-metil-piridin-2-carbonil)-*N'*-isopropil-hidrazinocarboxílico (13)

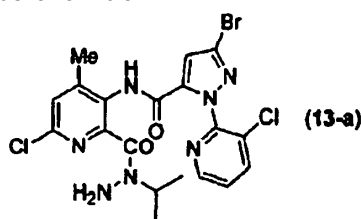
Etapa 1: Preparación de [6-cloro-2-(*N'*-isopropilhidrazinocarbonil)-4-metil-piridin-3-il]-amiduro de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carboxílico (12-a) y [6-cloro-2-(*N'*-isopropil-hidrazinocarbonil)-4-metilpiridin-3-il]-amiduro de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carboxílico (13-a)

La 2-[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-il]-6-cloro-8-metil-pirido[3,2-*d*] [1,3]oxazin-4-ona (ejemplo 7, etapa 4) (600 mg) se suspendió en THF (16 mL), se añadió isopropilhidrazina (294 mg) y la mezcla de reacción se agitó

durante 19 h a temperatura ambiente. Se añadieron agua y acetato de etilo y las capas se separaron. La capa acuosa se extrajo 1x con acetato de etilo, las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/acetato de etilo 2:1, a continuación 1:1, R_f (12-a) = 0,35, R_f (13-a) = 0,15 en hexano/acetato de etilo = 1:1) para proporcionar 478 mg del compuesto del título (12-a) de la fórmula



en forma de un sólido de color blanco
y 121 mg del compuesto del título (13-a) de la fórmula



en forma de un sólido de color blanco.

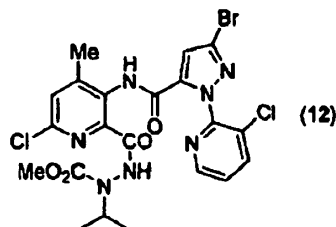
(12-a) RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 1,14 (6H, d, $J = 6$ Hz), 2,25 (3H, s), 3,17-3,23 (1H, m), 4,63 (1H, s), 7,12 (1H, s), 7,29 (1H, s), 7,37-7,41 (1H, m), 7,84-7,87 (1H, m), 8,46-8,48 (1H, m), 9,15 (1H, s), 11,46 (1H, s).

(13-a) RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 1,09 (3,0H, d, $J = 7$ Hz), 1,12 (3,0H, d, $J = 7$ Hz), 2,08 (1,5H, s), 2,11 (1,5H, s), 3,75-3,80 (0,5H, m), 3,80-4,16 (2,0H, m ancho), 4,69-4,75 (0,5H, m), 7,02 (0,5H, s), 7,09 (0,5H, s), 7,29 (0,5H, s), 7,31 (0,5H, s), 7,34-7,39 (1,0H, m), 7,82-7,86 (1,0H, m), 8,41-8,46 (1,0H, m), 10,12 (0,5H, s), 10,42 (0,5H, s).

Etapas 2: Preparación de éster metílico de ácido *N'*-(3-(5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil)-amino)-6-cloro-4-metilpiridin-2-carbonil)-*N*-isopropil-hidrazincarboxílico (12)

El [6-cloro-2-(*N*-isopropil-hidrazincarbonil)-4-metil-piridin-3-il]-amiduro de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (12-a) (378 mg) se disolvió en piridina (5 mL), se añadió cloroformiato de metilo (220 μ L) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente.

Al cabo de 30 min, 1 h y 1,5 h, se añadió cloroformiato de metilo (cada vez 110 μ L). Al cabo de 18 h de agitación a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se sofocó con agua y se co-evaporó 3x con tolueno. El residuo se disolvió en agua y acetato de etilo, las capas se separaron y la capa acuosa se extrajo 2x con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, cloroformio/acetato de etilo = 10:1, $R_f = 0,13$) para proporcionar 382 mg del compuesto del título (12) de la presente invención de fórmula

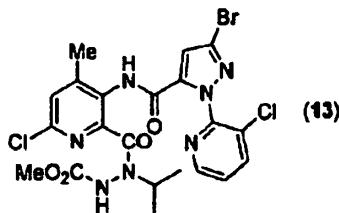


en forma de un sólido de color blanco.

RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 1,20 (6H, d, $J = 7$ Hz), 2,26 (3H, s), 3,75 (3H, s), 4,54-4,60 (1H, m), 7,09 (1H, s), 7,36 (1H, s), 7,39 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 7,85 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 2 Hz), 8,48 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 2 Hz), 9,28 (1H, s), 11,12 (1H, s).

Etapa 3: éster metílico de ácido N'-(3-([5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino)-6-cloro-4-metil-piridin-2-carbonil)-N'-isopropil-hidrazincarboxílico (13)

El [6-cloro-2-(N-isopropil-hidrazincarboxil)-4-metilpiridin-3-il]-amiduro de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (**13-a**) (121 mg) se disolvió en piridina (2 mL), se añadió cloroformiato de metilo (70 µL) y la mezcla de reacción se agitó a 50°C. Al cabo de 1h, se añadió cloroformiato de metilo (cada vez 40 µL) 8x a un intervalo de tiempo de 30 min a 50°C. Al cabo de 10 h de agitación a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se sofocó con agua y se co-evaporó 3x con tolueno. El residuo se disolvió en agua y acetato de etilo, las capas se separaron y la capa acuosa se extrajo 2x con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, cloroformo/acetato de etilo = 3:1, R_f = 0,15) para proporcionar 67 mg del compuesto del título (**13**) de la presente invención de fórmula

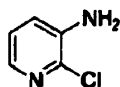


en forma de un sólido de color blanco.

RMN H¹ (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 1,00-1,30 (6H, m), 2,14 (3H, s), 3,57-3,81 (3H, m ancho), 4,62-4,79 (1H, m), 6,96-7,18 (3H, m), 7,39 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7,86 (1H, dd, J = 8 Hz), 8,45 (1H, d, J = 5 Hz), 9,66-9,86 (1H, m).

Ejemplo 12: Preparación de éster metílico de ácido N'-(3-([5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino)-4,6-dicloropiridin-2-carbonil)-hidrazincarboxílico (14)**Etapa 1: Preparación de 2-cloro-piridin-3-ilamina**

La 3-aminopiridina (25,0 g) se disolvió en ácido clorhídrico concentrado (250 mL, 37%) de 30 a 35°C y se enfrió en un baño de hielo después de completar la disolución de la sustancia de partida. Se añadió lentamente peróxido de hidrógeno peroxide (28,5 mL, solución acuosa al 30%) con un embudo de goteo a la solución a una velocidad tal que la temperatura se mantuvo por debajo de 10°C a lo largo de un período de 30 min. La solución de color naranja se calentó lentamente a la temperatura ambiente a lo largo de un período de tiempo de 2 h y se agitó a temperatura ambiente durante otras 2 h. La solución se enfrió en un baño de hielo y se añadieron lentamente 160 mL de una solución acuosa de hidróxido sodio (50%). La solución acuosa ácida se lavó con 30 mL tolueno y el lavado orgánico se volvió a extraer 1x con ácido clorhídrico acuoso 5 N. Se añadió una solución acuosa de hidróxido de sodio (50%) a la solución acuosa ácida combinada y el pH se ajustó a ~8-10. La solución acuosa se extrajo tres veces con 200 mL tolueno, la capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, cloroformo/acetato de etilo 20:1, R_f = 0,25) para proporcionar 17,6 g del compuesto del título de fórmula

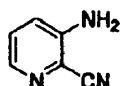


en forma de un sólido de color naranja.

RMN H¹ (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 4,12 (2H, s ancho), 7,04-7,05 (2H, m), 7,78-7,81 (1H, m).

Etapa 2: Preparación de 3-amino-piridin-2-carbonitrilo

La 2-cloro-piridin-3-ilamina (2,0 g) se disolvió en DMF (24 mL) y se añadió a la solución cianuro de sodio (1,83 g). La solución se desgasificó a vacío 5x, se añadió tetrakis(trifenilfosfina) paladio(0) (901 mg) y la mezcla de reacción se agitó a 90°C durante 7 h. Después de enfriar la mezcla de reacción a temperatura ambiente, el sólido se eliminó mediante filtración y la torta del filtro se lavó con acetato de etilo. Se añadió agua al producto filtrado, las capas se separaron y la capa acuosa se extrajo 2x con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó 3x con agua, se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, cloroformo/acetato de etilo 3:1, R_f = 0,25) para proporcionar 755 mg del compuesto del título de fórmula



en forma de un sólido de color blanco.

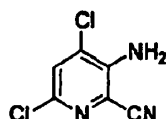
RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 4,43 (2H, s ancho), 7,10 (1H, dd, $J = 9$ Hz, 1 Hz), 7,25-7,29 (1H, m), 8,07 (1H, dd, $J = 4$ Hz, 1 Hz).

5

Etapa 3: Preparación de 3-amino-4,6-dicloro-piridin-2-carbonitrilo

El 3-amino-piridin-2-carbonitrilo (100 mg) se disolvió en DMF (2 mL) y se añadió N-chorosuccinimida (246 mg). La solución se agitó durante 20 h a temperatura ambiente antes de añadir agua. La mezcla se extrajo 2x con acetato de etilo, la capa orgánica combinada se lavó 3x con agua, se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/acetato de etilo = 3:1, $R_f = 0,30$) para proporcionar 121 mg del compuesto del título de fórmula

10



15 en forma de un sólido de color naranja.

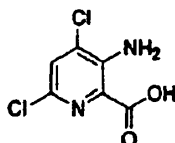
RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 4,92 (2H, s ancho), 7,44 (1H, s).

Etapa 4: Preparación de ácido 3-amino-4,6-dicloro-piridin-2-carboxílico

20

El 3-amino-9,6-dicloro-piridin-2-carbonitrilo (121 mg) se disolvió en ácido sulfúrico concentrado (1 mL) y se agitó durante 1 h a 100°C. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se añadió lentamente agua (1 mL). La mezcla de reacción se calentó de nuevo a 100°C y se agitó a esta temperatura durante 2 h. Se añadió agua después de enfriar a temperatura ambiente, el pH se ajustó a ~10 mediante la adición de bicarbonato de sodio sólido y la solución acuosa se lavó 2x con MTB-éter. La capa acuosa se ajustó a continuación a pH -2 mediante la adición de ácido clorhídrico 2 M y se extrajo 3x con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío para proporcionar 99 mg del compuesto del título de fórmula

25



30 en forma de un sólido de color amarillo.

RMN H^1 ($CDCl_3$, TMS) δ (ppm): 6,37 (2H, s ancho), 7,47 (1H, s), 10,50 (1H, s ancho).

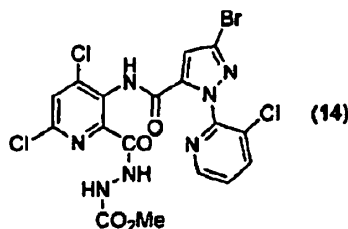
Etapa 5: Preparación de éster metílico de ácido N'-{3-([5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino)-4,6-dicloropiridin-2-carbonil}-hidrazincarboxílico

35

El ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (ejemplo 1, etapa 5) (142 mg) se suspendió en acetonitrilo (1 mL) y se añadieron piridina (65 μ L) y cloruro de metanosulfonilo (50 μ L). La mezcla de reacción se agitó durante 30 min a temperatura ambiente, se añadieron ácido 3-amino-4,6-dicloro-piridin-2-carboxílico (99 mg) en acetonitrilo (1 mL) y piridina (130 μ L) y la mezcla de reacción se agitó 1 h a temperatura ambiente. Se añadió cloruro de metanosulfonilo (65 μ L) y la mezcla de reacción se agitó durante 20 h a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se concentró a vacío, el residuo se suspendió en DMF (5 mL), se añadió éster metílico de ácido carbazoico (216 mg) y la mezcla de reacción se agitó durante 20 h a temperatura ambiente. Se añadió agua y la mezcla se extrajo 2x con MTB-éter. La capa orgánica combinada se lavó 3x con agua, se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/acetato de etilo = 2:1, $R_f = 0,15$) para proporcionar 37 mg del compuesto **14** de la presente invención de fórmula

40

45



en forma de un sólido de color blanco.

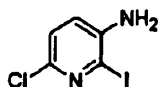
RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,82 (3H, s), 6,66 (1H, s ancho), 7,08 (1H, s), 7,39 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 7,57 (1H, s), 7,86 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 2 Hz), 8,47 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 2 Hz), 9,40 (1H, s), 10,71 (1H, s).

5 **Ejemplo 13: Preparación de éster metílico de ácido *N'*-(4-bromo-3-([5-bromo-2-(3-cloro -piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil)-amino)-6-cloro- piridin-2-carbonil)-hidrazincarboxílico (15)**

Etapa 1: Preparación de 3-amino-6-cloro-2-yodopiridina

10 La 5-amino-2-cloropiridina (3,0 g) se disolvió en DMF (40 mL), se añadió *N*-yodosuccinimida (5,25 g) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas. Se añadieron agua y MTB-éter a la mezcla de reacción, las capas se separaron y la capa orgánica se lavó 3x con agua, se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/acetato de etilo = 3:1, $R_f = 0,30$) para proporcionar 4,80 g del compuesto del título de fórmula

15



en forma de un sólido de color naranja.

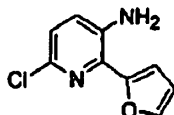
RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 4,13 (2H, s ancho), 6,89 (1H, d, $J = 8$ Hz), 7,05 (1H, d, $J = 8$ Hz).

20

Etapa 2: Preparación de 3-amino-6-cloro-2-(2-furanil)piridina

25 La 3-amino-6-cloro-2-yodopiridina (1,78 g), ácido 2-furanborónico (1,17 g), y carbonato de sodio (1,11 g) se suspendieron en una mezcla disolvente consistente en tolueno (23 mL), THF (23 mL) y agua (7 mL). La mezcla se desgasificó utilizando una posterior evaporación y lavado con nitrógeno (5x) y se añadió tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0) (808 mg). La mezcla de reacción se agitó a 90°C durante 7 horas y 14 horas a temperatura ambiente. Después de la adición de ácido 2-furanborónico (783 mg), la mezcla se agitó de nuevo durante 4 horas a 90°C, a continuación se añadió otra porción de ácido 2-furanborónico (390 mg) y la mezcla de reacción se agitó durante 5,5 horas a 90°C. Al cabo de 15 horas de agitación a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se sofocó con agua y se extrajo 2x con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/acetato de etilo = 3:1, $R_f = 0,25$) para proporcionar 1,26 mg del compuesto del título de fórmula

30



35 en forma de un sólido de color beige. El compuesto contenía ~10% de 3-amino-6-cloro-2-yodopiridina y se utilizó sin purificación adicional en la siguiente etapa.

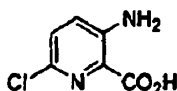
RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm) : 4,65 (2H, s ancho), 6,56 (1H, dd, $J = 4$ Hz, 2 Hz), 6,99 (2H, s), 7,08 (1H, d, $J = 4$ Hz), 7,54 (1H, d, $J = 2$ Hz).

40

Etapa 3: Preparación de ácido 3-amino-6-cloro-piridin-2-carboxílico

45 La 3-amino-6-cloro-2-(2-furanil)piridina (1,06 g) se disolvió en acetona (25 mL) y se enfrió en un baño de hielo a 0°C. Se añadió gota a gota a esta solución una solución preparada de permanganato de potasio (2,57 g) en agua (40 mL). Después de la adición completa, la mezcla de reacción se dejó templando a temperatura ambiente y se agitó durante horas. La mezcla se enfrió de nuevo a 0°C y se añadió una segunda porción de permanganato de potasio (858 mg) en agua (15 mL) y se retiró el baño refrigerante. Después de agitar durante 2 horas, la mezcla de reacción se filtró a través de un lecho de celite, la torta del filtro se lavó cuidadosamente con agua, metanol y acetato de etilo y se concentraron a aprox. 20 mL en un evaporador rotativo. Se añadió una solución de hidróxido de sodio 2 N para ajustar el valor de pH a -12 y la capa acuosa se lavó 2x con MTB-éter. La capa acuosa se ajustó a pH-2 mediante la adición de ácido clorhídrico 6 N y se extrajo 3x con MTB-éter. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró a vacío para proporcionar 636 mg del compuesto del título de fórmula

50



55

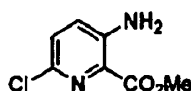
en forma de un sólido de color pardo. El compuesto aún contenía ~30% de una impureza desconocida y se utilizó en la siguiente etapa sin purificación adicional.

RMN ^1H (DMSO- D_6) δ (ppm): 7,28 (1H, d, $J = 9$ Hz), 7,34 (1H, d, $J = 9$ Hz).

Etapa 4: Preparación de éster metílico de ácido 3-amino-6-cloro-piridin-2-carboxílico

El ácido 3-amino-6-cloro-piridin-2-carboxílico (636 mg) se suspendió en metanol (8 mL) y se añadió tolueno (22 mL). Se añadió lentamente a la mezcla de reacción una solución de (trimetilsilil)diazometano (2,0 M en hexano, 2,4 mL). Al cabo de 1 hora de agitación a temperatura ambiente, se añadió otra porción de (trimetilsilil)diazometano (550 μl) y la mezcla se agitó durante 45 minutos adicionales. La mezcla de reacción se sofocó con agua y se extrajo 3x con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con ácido clorhídrico 2 N, una solución saturada de bicarbonato y salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró a vacío.

El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (gel de sílice 60, cloroformo/acetato de etilo = 50:1, $R_f = 0,30$) para proporcionar 365 mg del compuesto del título de fórmula

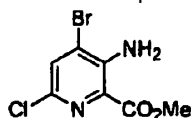


en forma de un sólido de color amarillo. El compuesto aún contenía ~30% de una impureza desconocida y se utilizó en la siguiente etapa sin purificación adicional.

RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,96 (3H, s), 5,82 (2H, s ancho), 7,05 (1H, d, $J = 9$ Hz), 7,23 (1H, d, $J = 9$ Hz).

Etapa 5: Preparación de éster metílico de ácido 3-amino-4-bromo-6-cloro-piridin-2-carboxílico

El éster metílico de ácido 3-amino-6-cloro-piridin-2-carboxílico (365 mg) se disolvió en DMF (10 mL) y se añadió *N*-bromosuccinimida (418 mg). La solución se agitó a 50°C durante 5 horas y se diluyó con MTB-éter. La capa orgánica se lavó 4x con agua, se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/acetato de etilo = 5:1, $R_f = 0,25$) para proporcionar 169 mg de éster metílico de ácido 3-amino-4-bromo-6-cloro-2-picolínico



en forma de un sólido de color naranja.

RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,97 (3H, s), 6,39 (2H, s ancho), 7,58 (1H, s).

Etapa 6: Preparación de ácido 3-amino-4-bromo-6-cloro-piridin-2-carboxílico

El éster metílico de ácido 3-amino-4-bromo-6-cloro-piridin-2-carboxílico (169 mg) se suspendió en metanol (3 mL) y una solución de hidróxido de sodio 2 N (2 mL). La suspensión se agitó a 50°C durante 3 horas. El precipitado se separó mediante filtración y se lavó cuidadosamente con éter dietílico. El precipitado se disolvió en una mezcla de ácido clorhídrico 2 N y acetato de etilo y las capas se separaron. La capa acuosa se extrajo 2x con acetato de etilo, se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró a vacío para proporcionar 138 mg del compuesto del título de fórmula

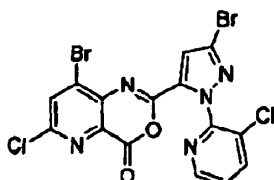


en forma de un sólido de color blanco.

RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,46 (2H, s ancho), 7,63 (1H, s), 10,59 (1H, s ancho).

Etapa 7: Preparación de 8-bromo-2-[5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-6-cloro-pirido[3,2-d] [1,3] oxazin-4-ona

Una mezcla de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (ejemplo 1, etapa 5) (183 mg) y cloruro de tionilo (130 μ l) se agitó a reflujo durante 2 horas. El cloruro de tionilo en exceso se evaporó simultáneamente con tolueno seco en un evaporador, el residuo se volvió a disolver en acetonitrilo seco (3 mL) y se añadió ácido 3-amino-4-bromo-6-cloro-piridin-2-carboxílico (138 mg). La solución se agitó durante 15 minutos a temperatura ambiente y se añadió trietilamina (85 μ L) y se agitó durante 30 minutos, antes de añadir una segunda porción de trietilamina (170 μ L). Después de agitar la mezcla de reacción durante 30 minutos adicionales a temperatura ambiente, se añadió cloruro de metanosulfonilo (55 μ L). Después de agitar durante 21 horas a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se sofocó por medio de la adición lenta de agua. El precipitado se separó mediante filtración, se lavó con agua/acetronitrilo (1 : 2), acetonitrilo y éter dietílico y se secó a vacío para proporcionar 141 mg del compuesto del título de fórmula

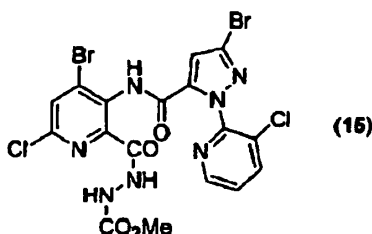


en forma de un sólido de color amarillo.

RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,33 (1H, s), 7,48 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 7,88 (1H, s), 7,98 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 2 Hz), 8,55 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 2 Hz).

Etapa 8: Preparación de éster metílico de ácido *N'*-(4-bromo-3-([5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino)-6-cloropiridin-2-carbonil)-hidrazincarboxílico (15)

La 8-bromo-2-(5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-il)-6-cloro-pirido[3,2-d][1,3]oxazin-4-ona (141 mg) se disolvió en DMF (8 mL) y se añadió éster metílico de ácido carbazoico (243 mg). La solución se agitó durante 14 horas a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se diluyó con MTB-éter y la capa orgánica se lavó 4x con agua, salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, cloroformo/acetato de etilo = 3:1, $R_f = 0,20$) para proporcionar 120 mg de compuesto 15 de la presente invención de fórmula



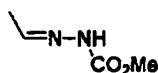
en forma de un sólido de color blanco.

RMN ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 3,46-3,62 (3H, m ancho), 7,45 (1H, s), 7,61 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 8,16 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 2 Hz), 8,28 (1H, s), 8,50 (1H, dd, $J = 5$ Hz, 2 Hz), 9,31 (1H, s ancho), 10,45 (1H, s), 10,72 (1H, s).

Ejemplo 14: Preparación de éster metílico de ácido *N'*-(4,6-dibromo-3-([5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino)piridin-2-carbonil)-*N'*-etil-hidrazincarboxílico (16)

Etapa 1: Preparación de éster metílico de ácido *N'*-etiliden-hidrazincarboxílico

El éster metílico de ácido carbazoico (10 g) se suspendió en tolueno (60 mL) y se calentó hasta 50°C durante 10 min. El matraz se equipó con un embudo de goteo, se cargó con una solución de acetaldehído (5,86 g) en tolueno (20 mL) y la solución se añadió gota a gota lentamente a la suspensión en 10 min. La mezcla se agitó durante 1 h a 50°C, y a continuación se enfrió a temperatura ambiente. El producto comenzó a cristalizarse y la refrigeración en un baño de hielo completó el procedimiento de cristalización. Los cristales de color blanco se separaron mediante filtración, se lavaron con pequeñas cantidades de tolueno frío y se secó a vacío para producir 12,07 g del compuesto del título de fórmula

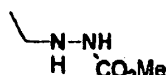


en forma de cristales de color blanco (principalmente un diastereómero).

RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm) : 1,99 (3H, d, $J = 5$ Hz), 3,82 (3H, s ancho), 7,24 (1H, q, $J = 5$ Hz), 8,06-8,56 (1H, m ancho).

Etapa 2: Preparación de éster metílico de ácido *N'*-etil-hidrazincarboxílico

5 El éster metílico de ácido *N'*-etiliden-hidrazincarboxílico (5,0 g) se disolvió en de THF seco (50 mL) y se agitó a 50°C. Se añadieron borohidruro de sodio (1,95 g) (desprendimiento de gas) y metanol seco (4,2 mL). La suspensión se convirtió en una solución en 5 a 10 min y cesó el desprendimiento de gas en 30 min. La solución se agitó durante 3 h a 50°C, antes de añadir 50 mL de metanol seco y la solución se agitó a reflujo durante 2 h. El disolvente se eliminó en un evaporador y el residuo se trató con 20 mL de cloroformo y se agitó durante 10 min a 50°C, antes de filtrarlo en un lecho de celite y se lavó 3x con 30 mL de cloroformo. El producto filtrado se concentró a vacío y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, cloroformo/acetato de etilo = 3:1; $R_f = 0,20$) para proporcionar 3,70 g del compuesto del título de fórmula



15 en forma de un aceite incoloro.

RMN ^1H ($\text{DMSO}-D_6$) δ (ppm): 0,93 (3H, t, $J = 7$ Hz), 2,66-2,73 (2H, m), 3,54 (3H, s), 4,39-4,42 (1H, m), 8,45 (1H, s ancho).

20 **Etapa 3: Preparación de 3-amino-4,6-dibromo-piridin-2-carbonitrilo**

La 2-cloro-piridin-3-ilamina (100 mg) se disolvió en DMF (2 mL) y se añadió *N*-bromosuccinimida (329 mg). La solución se agitó durante 26 h a temperatura ambiente antes de añadir agua. La mezcla se extrajo 2x con acetato de etilo, la capa orgánica combinada se lavó 3x con agua, se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/acetato de etilo = 3:1, $R_f = 0,30$) para proporcionar 158 mg del compuesto del título de fórmula

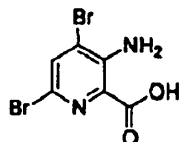


30 en forma de un sólido de color beige.

RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 4,93 (2H, s), 7,72 (1H, s).

35 **Etapa 4: Preparación de ácido 3-amino-4,6-dibromo-piridin-2-carboxílico**

El 3-amino-4,6-dibromo-piridin-2-carbonitrilo (158 mg) se disolvió en ácido sulfúrico concentrado (1,5 mL) y se agitó durante 1 h a 100°C. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se añadió lentamente agua (1,5 mL). La mezcla de reacción se calentó de nuevo a 100°C y se agitó a esta temperatura durante 2 h. Se añadió agua después de enfriar a temperatura ambiente, el pH se ajustó a -10 mediante la adición de bicarbonato de sodio sólido y la solución acuosa se lavó 2x con MTB-éter. La capa acuosa se ajustó a continuación a pH -2 mediante la adición de ácido clorhídrico 2 M y se extrajo 3x con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío para proporcionar 123 mg del compuesto del título de fórmula



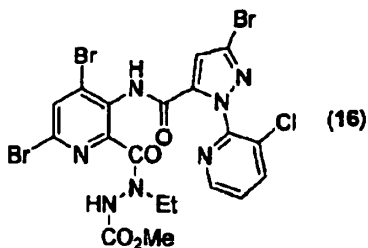
45 en forma de un sólido de color amarillo.

RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,43 (2H, s ancho), 7,75 (1H, s), 10,53 (1H, s ancho).

50 **Etapa 5: Preparación de éster metílico de ácido *N'*-(4,6-dibromo-3-((5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carbonil)-amino)-piridin-2-carbonil)-*N'*-etil-hidrazincarboxílico (16)**

El ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carboxílico (ejemplo 1, etapa 5) (126 mg) se suspendió en acetonitrilo (1 mL) y se añadieron piridina (55 μL) y cloruro de metanosulfonilo (40 μL). La mezcla de reacción se agitó durante 30 min a temperatura ambiente, se añadió ácido 3-amino-4,6-dibromo-piridin-2-carboxílico (123 mg) en

acetonitrilo (1 mL) y piridina (115 μ L) y la mezcla de reacción se agitó 1 h a temperatura ambiente. Se añadió cloruro de metanosulfonilo (40 μ L) y la mezcla de reacción se agitó durante 13 h a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se concentró a vacío, el residuo se suspendió en NMP (1 mL), se añadió éster metílico de ácido N'-etil-hidrazincarboxílico (237 mg, etapa 2) y la mezcla de reacción se agitó durante 1 h a 80°C. Se añadió agua después de enfriar a temperatura ambiente y la mezcla se extrajo 2x con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó 4x con agua, se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, cloroformo/acetato de etilo = 10:1, a continuación 5:1, a continuación 3:1, R_f = 0,25 en cloroformo/acetato de etilo = 3:1) para proporcionar 90 mg de un sólido de color blanco. El compuesto se purificó de nuevo mediante cromatografía en columna (sílice 60, hexano/acetato de etilo = 1:1, R_f = 0,20) para proporcionar 60 mg de compuesto **16** de la presente invención de fórmula



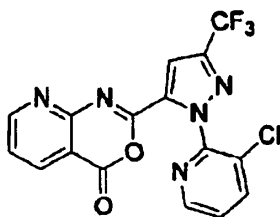
en forma de un sólido de color blanco.

RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,02-1,16 (3,0H, m), 3,67-3,90 (5,0H, m), 6,98 (0,5H, s), 7,18 (1,5H, s), 7,41 (1,0H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7,68 (1,0H, s), 7,88 (1,0H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8,47 (1,0H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 9,32-9,53 (1,0H, m).

Ejemplo 15: Preparación de éster metílico de ácido N'-2-([2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-trifluorometil-2H-pirazol-3-carbonil]-amino)piridin-3-carbonil)-hidrazincarboxílico (17)

Etapa 1: Preparación de 2-([2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-trifluorometil-2H-pirazol-3-il]-pirido[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona

El cloruro de ácido 5-trifluorometil-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (ejemplo 2, etapa 3) (800 mg) se añadió a una mezcla de ácido 2-aminonicotínico (356 mg) en acetonitrilo (20 mL). La mezcla se agitó durante 10 minutos a temperatura ambiente y se añadió trietilamina (360 μ L) y se agitó durante 15 minutos, antes de añadir una segunda porción de trietilamina (720 μ L). Después de agitar la mezcla de reacción durante 15 minutos adicionales a temperatura ambiente, se extrajo cloruro de metanosulfonilo (220 μ L). Después de agitar durante 1,5 horas a temperatura ambiente, la reacción se sofocó con agua y se extrajo 2x con acetato de etilo, se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, cloroformo/acetato de etilo = 1:1, R_f = 0,40) para proporcionar 660 mg del compuesto del título de fórmula

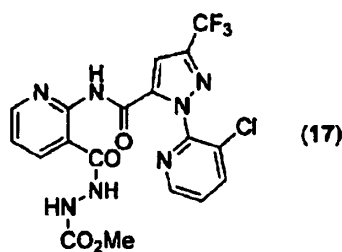


en forma de un sólido de color beige.

RMN ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,49 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7,56 (1H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 7,62 (1H, s), 8,02 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8,50 (1H, dd, J = 8 Hz, 2 Hz), 8,56 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz), 8,94 (1H, dd, J = 5 Hz, 2 Hz).

Etapa 2: Preparación de éster metílico de ácido N'-2-([2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-trifluorometil-2H-pirazol-3-carbonil]-amino)piridin-3-carbonil)-hidrazincarboxílico (17)

La 2-([2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-trifluorometil-2H-pirazol-3-il]-pirido[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona (292 mg) se disolvió en DMF (18 mL), se añadió éster metílico de ácido carbazoico (667 mg) y la solución se agitó durante 16 horas a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se sofocó con agua y se extrajo con MTB-éter. La capa orgánica se lavó 3x con agua, se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (sílice 60, cloroformo/metanol = 20:1, R_f = 0,15) para proporcionar 157 mg de compuesto **17** de la presente invención de fórmula



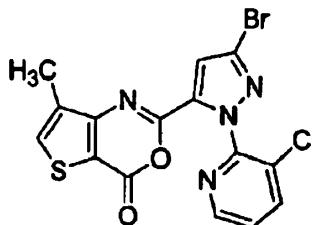
en forma de un sólido de color blanco.

5 RMN H^1 (DMSO- D_6) δ (ppm): 3,48-3,64 (3H, m ancho), 7,38 (1H, s ancho), 7,67-7,69 (2H, m), 8,07 (1H, s ancho), 8,24 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 1 Hz), 8,52-8,56 (2H, m), 9,31 (1H, s ancho), 10,43 (1H, s ancho), 11,48 (1H, s ancho).

Ejemplo 16: Preparación de éster metílico de ácido *N'*-(3-{[5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carbonil]-amino}-4-metil-tiofeno-2-carbonil)-hidrazincarboxílico (18)

10 **Etapa 1: Preparación de 2-[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-il]-7-metil-tien[3,2-*d*][1,3]oxazin-4-ona**

Una mezcla de ácido 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1*H*-pirazol-5-carboxílico (ejemplo 1, etapa 5) (600 mg) y cloruro de tionilo (2 ml) se calentó a reflujo durante 2 horas. La mezcla de reacción se dejó enfriando a temperatura ambiente y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se disolvió en acetonitrilo (10 mL) y se añadió
15 ácido 3-amino-4-metil-tiofeno-2-carboxílico (310 mg). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. A continuación, se añadió trietilamina (200 mg) a la mezcla. Después de agitar la mezcla a temperatura ambiente durante 30 minutos, se añadió una segunda porción de trietilamina (400 mg) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. Se añadió cloruro de metanosulfonilo (500 mg) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 6 horas. Se vertió agua a la mezcla de reacción y la mezcla se concentró a presión reducida. El
20 residuo resultante se lavó con agua y MTB-éter para proporcionar 0,72 g del compuesto del título de fórmula

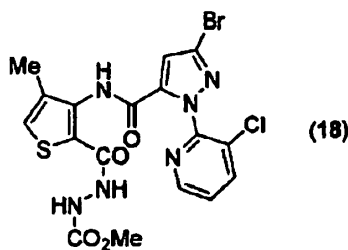


25 RMN H^1 (DMSO- D_6) δ (ppm): 1,74 (3H, s ancho), 7,52-7,57 (1H, m), 7,74-7,80 (1H, m), 8,02 (1H, s ancho), 8,30-8,37 (1H, m), 8,60-8,64 (1H, m).

Etapa 2: Preparación de éster metílico de ácido *N'*-(3-{[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carbonil]-amino}-4-metil-tiofeno-2-carbonil)-hidrazincarboxílico (18)

30 Una mezcla de 2-[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-il]-7-metil-tien[3,2-*d*][1,3]oxazin-4-ona (210 mg), éster metílico de ácido carbazoico (450 mg) y DMF (10 mL) se agitó a temperatura ambiente durante 10 horas. La mezcla de reacción se sofocó con agua y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó sobre sulfato de sodio y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para proporcionar 120 mg de compuesto **18** de la presente invención de fórmula:

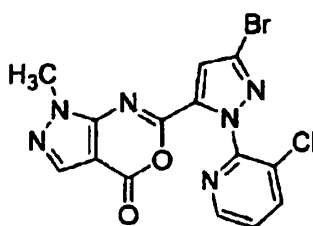
35



RMN H^1 (DMSO- D_6) δ (ppm): 1,96-2,01 (3H, m), 3,58-3,65 (3H, m), 7,38-7,47 (2H, m), 7,62 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 8,16-8,23 (1H, m), 8,50 (1H, d, $J = 4$ Hz), 9,24 (1H, s ancho), 9,83 (1H, s ancho), 10,28 (1H, s ancho)

Ejemplo 17: Preparación de éster metílico de ácido N'-(5-([5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino)-1-metil-1H-pirazol-4-carbonil)-hidrazincarboxílico (19)**Etapa 1: Preparación de 6-[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-1-metil-1H-pirazol[3,4-d][1,3]oxazin-4-ona**

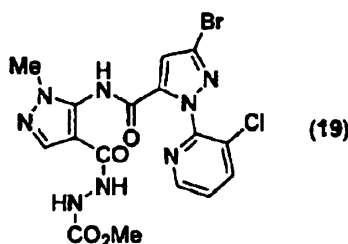
Una mezcla de ácido 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxílico (ejemplo 1, etapa 5) (1,10 g) y cloruro de tionilo (4 mL) se calentó a reflujo durante 2 horas. La mezcla de reacción se dejó enfriando a la temperatura ambiente, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se disolvió en acetonitrilo (10 mL) y se añadió ácido 5-amino-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico (520 mg). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. A continuación, se añadió trietilamina (400 mg) a la mezcla. Después de agitar a temperatura ambiente durante 30 minutos, se añadió una segunda porción de trietilamina (800 mg) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. Se añadió cloruro de metanosulfonilo (600 mg), y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 6 horas. Se vertió agua a la mezcla de reacción y la mezcla se concentró a presión reducida. El residuo resultante se lavó con agua y MTB-éter para proporcionar 900 mg del compuesto del título de fórmula



RMN H^1 (DMSO- D_6) δ (ppm): 3,46 (3H, s), 7,60 (1H, s), 7,78 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 8,24 (1H, s), 8,35 (1H, d, $J = 8$ Hz), 8,63 (1H, d, $J = 5$ Hz).

Etapa 2: Preparación de éster metílico de ácido N'-(5-([5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino)-1-metil-1H-pirazol-4-carbonil)-hidrazincarboxílico (19)

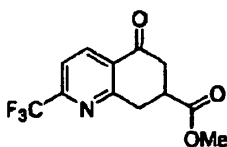
Una mezcla de 6-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-1-metil-1H-pirazol[3,4-d][1,3]oxazin-4-ona (300 mg), éster metílico de ácido carbazicoico (700 mg) y DMF (10 mL) se agitó a temperatura ambiente durante 10 horas. La mezcla de reacción se sofocó con agua y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó sobre sulfato de sodio, y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para proporcionar 200 mg de compuesto **19** de la presente invención de fórmula



RMN H^1 (DMSO- D_6) δ (ppm): 3,55-3,60 (6H, m), 7,48 (1H, s), 7,64 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 5 Hz), 7,96 (1H, s), 8,20 (1H, d, $J = 8$ Hz), 8,52 (1H, d, $J = 5$ Hz), 9,08 (1H, s ancho), 9,86 (1H, s ancho), 10,79 (1H, s ancho)

Ejemplo 18: Preparación de éster metílico de ácido N'-(6-((2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-trifluorometil-2H-pirazol-3-carbonil]-amino)-5-metil-2-trifluorometil-quinolin-7-carbonil)-hidrazincarboxílico (20)**Etapa 1: Preparación de éster metílico de ácido 5-oxo-2-trifluorometil-5,6,7,8-tetrahidroquinolin-7-carboxílico**

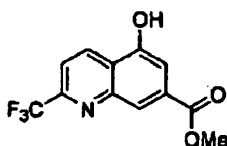
Una solución de éster metílico de ácido 3,5-dioxo-ciclohexanocarboxílico (3,6 g, preparación la descrita en J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1 (1976), (13), 1382-4.), (Z)-amino-1,1,1-trifluoro-but-3-en-2-ona (2,94 g, preparada como se describe en el documento EP 744400 (1996)), ácido trifluoroacético (1,21 g) y trifluoroacetato de amonio (1,39 g) en tolueno (50 mL) se calentaron a temperatura de reflujo en un aparato Dean-Stark. Una vez completada la reacción, la mezcla de reacción se enfrió, se diluyó con acetato de etilo y se lavó sucesivamente con bicarbonato de sodio acuoso saturado y agua. La fase orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro, se filtró y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (eluyendo con hexano/acetato de etilo = 4:1) para producir 1,5 g del compuesto del título de fórmula



en forma de cristales de color blanco.

Etapa 2: Preparación de éster metílico de ácido 5-hidroxi-2-trifluorometilquinolin-7-carboxílico

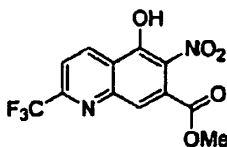
5 Una solución de éster metílico de ácido 5-oxo-2-trifluorometil-5,6,7,8-tetrahidroquinolin-7-carboxílico (50,0 g) se disolvió en cloruro de metileno (500 mL) y se trató gota a gota con una solución de bromotriclorometano (54,43 g) y 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno (55,72 g) en cloruro de metileno (100 mL) a 0-5°C. Después de completar la adición, se dejó que la mezcla de reacción se calentara a temperatura ambiente, y se agitó durante 1 h. La mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo y a continuación se lavó sucesivamente con ácido clorhídrico acuoso diluido y salmuera. La fase de acetato de etilo se secó sobre sulfato de sodio anhidro, se filtró y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante recristalización en hexano/acetato de etilo para producir 47,13 g del compuesto del título de fórmula



15 en forma de cristales de color amarillo pálido.

Etapa 3: Preparación de éster metílico de ácido 5-hidroxi-6-nitro-2-trifluorometilquinolin-7-carboxílico

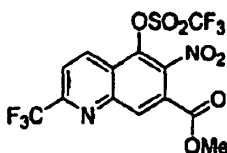
20 El éster metílico de ácido 5-hidroxi-2-trifluorometil-quinolin-7-carboxílico (46,0 g) se disolvió en ácido sulfúrico concentrado (200 mL, 97%) a 0-5°C. A esta solución refrigerada se le añadió gota a gota ácido nítrico humeante (7 mL, 100%). Después de completar la adición, se dejó que la mezcla de reacción se templara a temperatura ambiente. El análisis TLC (hexano/acetato de etilo = 4:1) al cabo de 30 min mostró que se había completado la reacción. La mezcla de reacción se vertió lentamente sobre una mezcla de hielo/agua (aprox. 2 mL) y los cristales se separaron mediante filtración, se lavaron cuidadosamente con agua y se secaron a vacío para proporcionar 47,0 g del compuesto del título de fórmula



30 en forma de cristales de color amarillo pálido.

Etapa 4: Preparación de éster metílico de ácido 6-nitro-5-trifluorometanosulfonilo-2-trifluorometil-quinolin-7-carboxílico

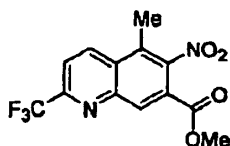
35 Una solución de éster metílico de ácido 5-hidroxi-6-nitro-2-trifluorometilquinolin-7-carboxílico (6,82 g) en cloruro de metileno (50 mL) se trató con trietilamina (6,69 g) y una cantidad catalítica de 4-dimetilaminopiridina (0,26 g). A esta solución se le añadió anhídrido trifluorometanosulfónico (9,1 g), manteniendo la temperatura a 25°C durante 1h. La mezcla de reacción se diluyó con cloruro de metileno y a continuación se lavó sucesivamente con ácido clorhídrico acuoso diluido, agua, bicarbonato de sodio acuoso saturado y agua. La fase de cloruro de metileno se secó sobre sulfato de sodio anhidro, se filtró y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (hexano/acetato de etilo = 9:1) para producir 6,6 g del compuesto del título de fórmula



en forma de cristales de color amarillo pálido.

Etapa 5: Preparación de éster metílico de ácido 5-metil-6-nitro-2-trifluorometilquinolin-7-carboxílico

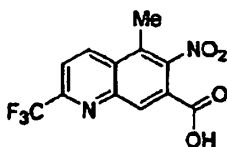
Una suspensión de tricloruro de indio (2,0 g) en THF seco (5 mL) en atmósfera de argón se enfrió a -78°C y a continuación se trató gota a gota con cloruro de metilmagnesio (9,1 mL, 3 M en THF). La suspensión lechosa se dejó templando a temperatura ambiente y a continuación se añadió gota a gota a una solución a reflujo de bis(trifenilfosfina)-cloruro de paladio(II) (0,19 g) y éster metílico de ácido 6-nitro-5-trifluorometanosulfonilo-2-trifluorometil-quinolin-7-carboxílico (4,05 g) en THF seco (35 mL). La mezcla se sometió a reflujo en una atmósfera de argón, verificando mediante TLC. Una vez completada la reacción, la mezcla de reacción se concentró a vacío, el residuo se recogió en éter dietílico y se lavó sucesivamente con ácido clorhídrico diluido y salmuera. La fase de éter dietílico se secó sobre sulfato de sodio anhidro, se filtró y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna (hexano/acetato de etilo = 4:1) para producir 2,0 g del compuesto del título de fórmula



en forma de cristales de color amarillo.

Etapa 6: Preparación de ácido 5-metil-6-nitro-2-trifluorometilquinolin-7-carboxílico

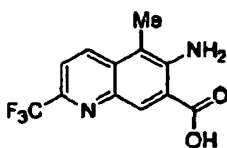
El éster metílico de ácido 5-metil-6-nitro-2-trifluorometil-quinolin-7-carboxílico (3,78 g) se disolvió en 200 mL de metanol/agua (mezcla 3:1) y se trató con hidrato de hidróxido de litio (1,06 g) a temperatura ambiente. Una vez completada la reacción, la mezcla se vertió en acetato de etilo y ácido clorhídrico 2 N, la fase orgánica se lavó 3x con agua, se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró a vacío. El residuo se trituró con una pequeña cantidad de hexano. La filtración produjo 3,50 g del compuesto del título de fórmula



en forma de cristales de color blanco.

Etapa 7: Preparación de ácido 6-amino-5-metil-2-trifluorometilquinolin-7-carboxílico

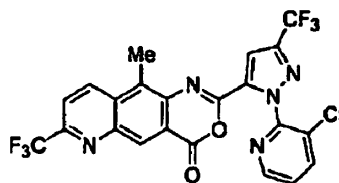
Una solución de ácido 5-metil-6-nitro-2-trifluorometilquinolin-7-carboxílico (1,40 g) en etanol (100 mL) se halogenó a presión atmosférica y temperatura ambiente en presencia de catalizador de níquel Raney. El análisis mediante TLC al cabo de 12 h mostró que se había completado la reacción. La mezcla se filtró sobre Hyflo y el producto filtrado se concentró a vacío. El residuo se recrystalizó en hexano/acetato de etilo para producir 0,90 g del compuesto del título de fórmula



en forma de cristales de color amarillo.

Etapa 8: Preparación de 2-[2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-trifluorometil-2H-pirazol-3-il]-9-metil-6-trifluorometil-3-oxa-1,5-diaza-antracén-4-ona

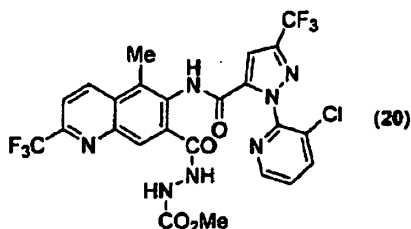
Una solución de ácido 6-amino-5-metil-2-trifluorometil-quinolin-7-carboxílico (0,60 g), ácido 2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-trifluorometil-2H-pirazol-3-carboxílico (0,65 g, ejemplo 2, etapa 2) y piridina (0,79 g) en acetonitrilo (30 mL) se enfrió a $0-5^{\circ}\text{C}$ y se trató gota a gota con cloruro de metanosulfonilo (0,89 g) disuelto en 2 mL acetonitrilo. El análisis mediante TLC (hexano/acetato de etilo 4:1) al cabo de 2 h mostró que se había completado la reacción. La mezcla de reacción se concentró a 2/3 del volumen original a vacío y se vertió sobre 75 mL de hielo/agua. Los cristales resultantes se separaron mediante filtración, se lavaron con agua y se secaron a vacío para producir 1,0 g del compuesto del título de fórmula



en forma de cristales de color naranja.

5 **Etapa 9: Preparación de éster metílico de ácido N'-(6-((2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-trifluorometil-2H-pirazol-3-carbonil)-amino)-5-metil-2-trifluorometil-quinolin-7-carbonil)-hidrazinocarboxílico (20)**

10 La 2-[2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-trifluorometil-2H-pirazol-3-il]-9-metil-6-trifluorometil-3-oxa-1,5-diaza-antracen-4-ona (600 mg, se puede preparar como en el documento WO 2007/020050) se suspendió en DMF y se añadió éster metílico de ácido carbazoico (1,18 g). La solución se agitó durante 15 h a 50°C antes de sofocarla con agua. La mezcla se extrajo 2x con acetato de etilo, la capa orgánica combinada se lavó 3x con agua, se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna para proporcionar el compuesto del título de fórmula



15 A continuación, se mostrarán los Ejemplos de Formulación. Todas las partes son en peso.

Ejemplo de Formulación 1

20 En una mezcla de 35 partes de xileno y 35 partes de N,N-dimetilformamida, se disuelven 10 partes de uno cualquiera de los presentes compuestos (1) a (19), y a continuación se añaden 14 partes de polioxietileno estirilfenil éter y 6 partes de dodecilsulfonato de calcio. La mezcla se agita cuidadosamente para obtener una emulsión al 10%.

25 **Ejemplo de Formulación 2**

A una mezcla de 4 partes de laurilsulfato de sodio, 2 partes de lignosulfonato de calcio, 20 partes de polvo fino de óxido de silicio hidratado sintético y 54 partes de tierra de diatomeas, se le añaden 20 partes de uno cualquiera de los presentes compuestos (1) a (19). La mezcla se agita cuidadosamente para obtener un agente mojable al 20%.

30 **Ejemplo de Formulación 3**

35 A 2 partes de uno cualquiera de los presentes compuestos (1) a (19), se les añaden 1 parte de polvo fino de óxido de silicio hidratado sintético, 2 partes de lignosulfonato de calcio, 30 partes de bentonita y 65 partes de arcilla de caolín, y a continuación se agitó cuidadosamente. A continuación, se añade una cantidad apropiada de agua a la mezcla. La mezcla se agita adicionalmente, se granula con una granuladora, y se seca con aire forzado para obtener un gránulo al 2%.

40 **Ejemplo de Formulación 4**

En una cantidad apropiada de acetona, se disuelve 1 parte de uno cualquiera de los presentes compuestos (1) a (19), y a continuación se añaden 5 partes de polvo fino de óxido de silicio hidratado sintético, 0,3 partes de PAP y 93,7 partes de arcilla fubasami. La mezcla se agita cuidadosamente. A continuación, la acetona se elimina de la mezcla mediante evaporación para obtener un polvo al 1%.

45 **Ejemplo de Formulación 5**

50 Una mezcla de 10 partes de uno cualquiera de los presentes compuestos (1) a (19); 35 partes de hulla blanca que contiene 50 partes de sal de amonio de polioxietileno alquil éter sulfato; y 55 partes de agua se tritura finamente mediante un método de trituración en mojado para obtener un agente suspendible al 10%.

Ejemplo de Formulación 6

5 En 5 partes de xileno y 5 partes de tricloroetano, se disuelven 0,1 partes de uno cualquiera de los presentes compuestos (1) a (19). La solución se mezcla con 89,9 partes de queroseno desodorizado para obtener un aceite al 0,1%.

Ejemplo de Formulación 7

10 En 0,5 ml de acetona, se disuelven 10 mg de uno cualquiera de los presentes compuestos (1) a (19). La solución se mezcla uniformemente con 5 g de un alimento sólido en polvo para un animal (alimento sólido en polvo para cría y reproducción CE-2, fabricado por CLEA Japan, Inc.), y a continuación se secó mediante evaporación de la acetona para obtener en cebo envenenado.

15 A continuación, se mostrará mediante los Ejemplos de Ensayo que el presente compuesto es eficaz para controlar artrópodos nocivos. En el Ejemplo de Ensayo, los valores de control se calcularon mediante la siguiente ecuación:

$$\text{Valor de control (\%)} = \{1 - (\text{Cb} \times \text{Tai}) / (\text{Cai} \times \text{Tb})\} \times 100$$

donde,

20 Cb: número de gusanos en una sección no tratada antes del tratamiento

Cai: número de gusanos en una sección no tratada durante la observación

Tb: número de gusanos en una sección tratada antes del tratamiento

Tai: número de gusanos en una sección tratada durante la observación.

Ejemplo de Ensayo 1

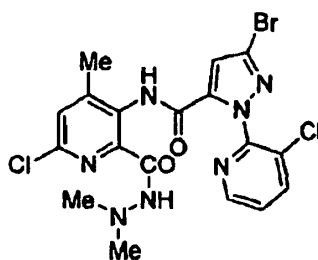
Las preparaciones de los compuestos de ensayo obtenidas en el Ejemplo de Formulación 5 se diluyeron con agua de manera que la concentración de ingrediente activo llegara a ser de 500 ppm, para preparar soluciones de ensayo para pulverización.

30 Al mismo tiempo, se plantó col en una copa de polietileno, y se hizo crecer hasta que se desarrolló la tercera hoja verdadera o la cuarta hoja verdadera. La solución de pulverización de ensayo descrita anteriormente se pulverizó en una cantidad de 20 ml/copa sobre la col.

35 Después de secar la solución de pulverización sobre la col, se colocaron sobre la col 10 larvas en el tercer instar de polillas dorso de diamante (*Plutella xilostella*). Al cabo de 5 días, se contó el número de polillas dorso de diamante, y el valor de control mediante la ecuación anterior.

40 Como resultado, las soluciones de pulverización de ensayo de los presentes compuestos (1), (2), (3), (4), (5), (7), (8), (9), (10), (11), (14), (15), (16), (17) y (19) mostraron cada una un valor de control de 90% o más.

Además, las preparaciones del compuesto de ensayo (7) y un compuesto comparativo de fórmula:



45 (documento WO 2002/070483A) obtenidas en una formulación de acuerdo con el Ejemplo de Formulación 5 se diluyeron con agua de manera que la concentración de ingrediente activo llegara a ser 0,2 ppm, para preparar una solución de pulverización de ensayo.

50 Al mismo tiempo, se plantó col en una copa de polietileno, y se hizo crecer hasta que se desarrolló la tercera hoja verdadera o la cuarta hoja verdadera. La solución de pulverización de ensayo descrita anteriormente se pulverizó en una cantidad de 20 ml/copa sobre la col.

55 Después de secar la solución de pulverización sobre la col, se colocaron sobre la col 10 larvas en el tercer instar de polillas dorso de diamante (*Plutella xilostella*). Al cabo de 5 días, se contó el número de polillas dorso de diamante, y el valor de control mediante la ecuación anterior. El Compuesto (7) exhibió un valor de control de más de 80%, mientras que el compuesto comparativo de la fórmula anterior exhibió menos de 80% de control.

Ejemplo de Ensayo 2

5 Las preparaciones de los compuestos de ensayo obtenidos en el Ejemplo de Formulación 5 se diluyeron con agua de manera que la concentración de ingrediente activo llegara a ser 500 ppm para preparar soluciones de pulverización de ensayo.

10 Al mismo tiempo, se plantó pepino en una copa de polietileno, y se hizo crecer hasta que se desarrolló la primera hoja verdadera. Se colocaron alrededor de 30 áfidos del algodón sobre el pepino. Un día después, la solución de pulverización de ensayo descrita anteriormente se pulverizó en una cantidad de 20 ml/copa sobre el pepino. Seis días después de la pulverización, se contó el número de áfidos del algodón (*Aphis gossypii*), y se calculó un valor de control mediante la ecuación anterior.

15 Como resultado, las soluciones de pulverización de ensayo de los presentes compuestos (1), (2), (3), (4), (5), (7), (8), (9), (10), (11), (14), (15), (16), (18) y (19) mostraron cada una un valor de control de 90% o mayor.

Ejemplo de Ensayo 3

20 Las preparaciones de los compuestos de ensayo obtenidos en el Ejemplo de Formulación 5 se diluyeron con agua de manera que la concentración de ingrediente activo llegara a ser 500 ppm para preparar soluciones de pulverización de ensayo.

25 Al mismo tiempo, se plantó col en una copa de polietileno, y se hizo crecer hasta que se desarrolló la tercera hoja verdadera o la cuarta hoja verdadera. La solución de pulverización de ensayo descrita anteriormente se pulverizó en una cantidad de 20 ml/copa sobre la col. Después de secar la solución de pulverización pulverizada sobre la col, se colocaron sobre la col 10 larvas en el cuarto instar de *Spodoptera litura*. Al cabo de 5 días, se contó el número de *Spodoptera litura* supervivientes sobre las hojas de col, y se calculó un valor de control mediante la ecuación anterior.

30 Como resultado, las soluciones de pulverización de ensayo de los presentes compuestos (1), (3), (4), (5), (7), (8), (9), (10), (11), (14), (15), (16) y (17) mostraron cada una un valor de control de 80% o mayor.

Ejemplo de Ensayo 4

35 Las preparaciones de los compuestos de ensayo obtenidos en el Ejemplo de Formulación 5 se diluyeron con agua de manera que la concentración de ingrediente activo llegara a ser 500 ppm para preparar soluciones de pulverización de ensayo.

40 Al mismo tiempo, se pulverizaron 20 ml de la solución de pulverización de ensayo descrita anteriormente a una plántula de manzana (plántula de 28 días, altura del árbol: alrededor de 15 cm) plantada en una copa de plástico. La plántula de manzana se secó al aire en un grado tal que la solución de pulverización pulverizada sobre la plántula de manzana se secó, se liberaron alrededor de 30 larvas en el primer instar *Adoxophyes orana*. Al cabo de siete días de la pulverización, se contó el número de gusanos supervivientes sobre la plántula de manzana, y se calculó un valor de control mediante la ecuación anterior.

45 Como resultado, las soluciones de pulverización de ensayo de los presentes compuestos (1), (2), (3), (4), (5), (7), (8), (14), (15) y (19) mostraron cada una un valor de control de 90% o mayor.

Ejemplo de Ensayo 5

50 Las preparaciones de los compuestos de ensayo obtenidos en el Ejemplo de Formulación 5 se diluyeron con agua de manera que la concentración de ingrediente activo llegara a ser 500 ppm para preparar soluciones de pulverización de ensayo.

55 Al mismo tiempo, se plantó pepino en una copa de polietileno, y se hizo crecer hasta que se desarrolló la primera hoja verdadera. La solución de pulverización de ensayo descrita anteriormente se pulverizó en una cantidad de 20 ml/copa sobre el pepino. Después de secar la solución de pulverización sobre el pepino, se cortó la primera hoja verdades y a continuación se colocó sobre un papel de filtro (diámetro: 70 mm) que contenía agua en una copa de polietileno (diámetro: 110 mm). Sobre la hoja de pepino, se liberaron 20 larvas de *Franklinella occidentalis*, y se tapó la copa de polietileno. Al cabo de siete días de la pulverización, se examinó el porcentaje de área foliar dañada por el insecto.

60 Como resultado, cada una de las soluciones de pulverización de ensayo de los presentes compuestos (1), (2), (3), (4), (7), (8), (9), (10), (11), (14), (15) y (16) suprimió el daño por alimentación al nivel de área dañada de 5% o menor.

Ejemplo de Ensayo 6

5 Las preparaciones de los compuestos de ensayo obtenidos en el Ejemplo de Formulación 5 se diluyeron con agua de manera que la concentración de ingrediente activo llegara a ser 500 ppm para preparar soluciones de pulverización de ensayo.

10 Al mismo tiempo, se plantó col en una copa de polietileno, y se hizo crecer hasta que se desarrolló la primera hoja verdadera. Todas las hojas excluyendo la primera hoja verdadera se separaron mediante corte. Sobre la primera hoja verdadera, se liberaron adultos de mosca blanca de las hojas plateadas, *Bemisia argentifolii* (o biotipo B de mosca blanca del tabaco, *Bemisia tabaci*) y se permitió que pusieran huevos durante alrededor de 24 horas. La col se mantuvo en un invernadero durante 8 días. Cuando las larvas eclosionaron de la puesta de huevos, la solución de pulverización de ensayo descrita anteriormente se pulverizó en una cantidad de 20 ml/copa a la col. Al cabo de siete días de la pulverización, se contó el número de larvas supervivientes sobre la col, y se calculó un valor de control mediante la ecuación anterior.

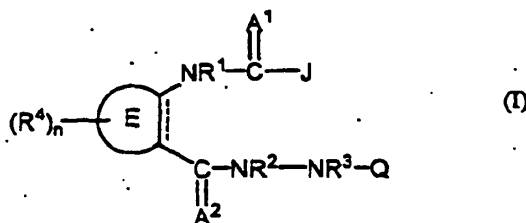
15 Como resultado, las soluciones de pulverización de ensayo de los presentes compuestos (7), (8), (9), (10), (11), (14) y (15) mostraron cada una un valor de control de 90% o mayor.

20 Aplicabilidad Industrial

De acuerdo con la presente invención, puesto que el compuesto de hidrazida de la presente invención tiene una eficacia excelente para controlar plagas, es útil como ingrediente activo de un plaguicida.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (I), un N-óxido del mismo o una sal adecuada del mismo:



- 5 donde,
 A¹ y A² representan independientemente un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;
 E representa, junto con los dos átomos de carbono conectores contiguos, un sistema anular heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema anular heterobíciclico fusionado de 8, 9 o 10 miembros
 10 R¹ representa un átomo de hidrógeno, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cianoalquilo C2-C6, hidroxialquilo C1-C6, alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquino C2-C6 sustituido
 15 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido
 20 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxi(C2-C6)carbonilo, alquil(C2-C6)aminocarbonilo, dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo, o trialquil(C3-C6)sililo;
 o representa fenilo, fenilalquilo C7-C9 o fenilcarbonilo: cada uno de dichos anillos de fenilo sustituidos opcionalmente
 25 con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) hidroxilo, (5) carboxilo, (6) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) hidroxialquilo C1-C6, (8) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) cianoalquilo C2-C6, (10) alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alquino C2-C6 sustituido
 30 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (14) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (15) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (16) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (17) alquil(C1-C6)amino, (18) dialquil(C2-C8)amino, (19) cicloalquil(C3-C6)amino, (20) alquil(C2-C6)carbonilo, (21) alcoxi(C2-C6)carbonilo, (22) alquil(C2-C6)aminocarbonilo, (23) dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, (24) cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo y (25) trialquil(C3-C6)sililo,
 35 R² y R³ representan independientemente un átomo de hidrógeno, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cianoalquilo C2-C6, hidroxialquilo C1-C6, alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquino C2-C6 sustituido
 40 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C2-C6)carbonilo sustituido
 45 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxi(C2-C6)carbonilo, alquil(C2-C6)aminocarbonilo, dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo, o trialquil(C3-C6)sililo;
 o representan fenilo, fenilalquilo C7-C9 o fenilcarbonilo: cada uno de dichos anillos de fenilo sustituidos
 50 opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) hidroxilo, (5) carboxilo, (6) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) hidroxialquilo C1-C6, (8) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) cianoalquilo C2-C6, (10) alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alquino C2-C6 sustituido
 55 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (14) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (15) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (16) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (17) alquil(C1-C6)amino, (18) dialquil(C2-C8)amino, (19) cicloalquil(C3-C6)amino, (20) alquil(C2-C6)carbonilo, (21) C2-C6-alcoxicarbonilo, (22) alquil(C2-C6)aminocarbonilo, (23) dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, (24) cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo y (25) trialquil(C3-C6)sililo; o
 R² y R³ se toman junto con los dos átomos de nitrógeno a los que están unidos para formar un anillo de 5 a 8 miembros que contiene dos átomos de nitrógeno, uno o más CH₂ o C(=O), y opcionalmente uno o dos miembros
 55 anulares seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de oxígeno, (2) un átomo de azufre, (3) S(=O), (4) S(=O)₂ y (5) NR^a (donde R^a representan alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno,

alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, o un fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno); y donde el anillo en los átomos de carbono está sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, y (3) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

R⁴ representa un átomo de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, carboxilo, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cianoalquilo C2-C6, alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquenilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquinilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)amino, dialquil(C2-C8)amino, cicloalquil(C3-C6)amino, alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxi(C2-C6)carbonilo, alquil(C2-C6)aminocarbonilo, dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, o trialquil(C3-C6)sililo;

o representa un fenilo, bencilo, fenoxi, o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros; cada anillo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) hidroxilo, (5) carboxilo, (6) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) hidroxialquilo C1-C6, (8) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) cianoalquilo C2-C6, (10) alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquenilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alquinilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (14) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (15) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (16) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (17) alquil(C1-C6)amino, (18) dialquil(C2-C8)amino, (19) cicloalquil(C3-C6)amino, (20) alquil(C2-C6)carbonilo, (21) alcoxi(C2-C6)carbonilo, (22) alquil(C2-C6)aminocarbonilo, (23) dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, (24) cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo y (25) trialquil(C3-C6)sililo,

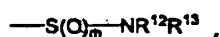
n representa un número entero de 0 a 3 (siempre que, cuando n es un número entero de 2 o más, R⁴s pueden ser iguales o diferentes);

Q representa Q1, Q2, Q3, Q4, Q5 o Q6:

Q1: -C(=A³¹)-R⁶
 Q2: -C(=A³²)-OR⁷
 Q3: -C(=A³³)-SR⁶
 Q4: -C(=A³⁴)-NR⁹R¹⁰
 Q5:



Q6:



A³¹, A³², A³³ y A³⁴ representan un átomo de oxígeno, o un átomo de azufre;

m representa un número entero de 0 a 2;

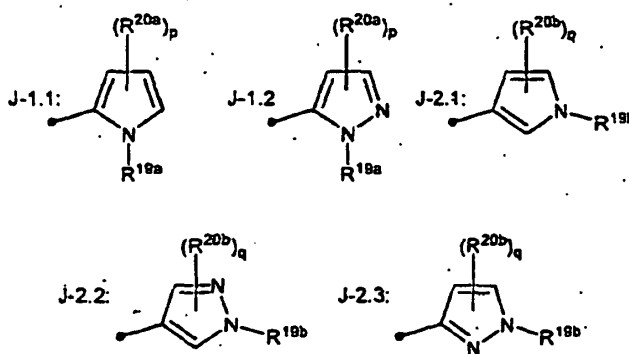
R⁶ representa un átomo de hidrógeno; alquenilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquinilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (3) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (4) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, y (7), cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) . alcoxi C1-C6

con uno o más átomos de halógeno; o piridinilalquilo C7-C9 cuyo anillo de piridina está sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, R^{20a} y R^{20b} representan un átomo de halógeno; ciano; nitro; tiocianato; alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cianoalquilo(C2-C6)oxi; alcoxi(C2-C6)alquiloxi sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquenil(C2-C6)oxi sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquinil(C2-C6)oxi sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquil(C1-C6)sulfonilo opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno; fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (L) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; o fenoxi sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, p representa un número entero de 0 a 3 (siempre que, cuando p es un número entero de 2 o 3, dos o más R^{20a} 's pueden ser iguales o diferentes); q representa un número entero de 0 a 3 (siempre que, cuando q es un número entero de 2 o 3, dos o más R^{20b} 's pueden ser iguales o diferentes).

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde E es un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros.

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, donde A^1 y A^2 son átomos de oxígeno, R^1 es un átomo de hidrógeno o alquilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno.

4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, 2 o 3, donde J es J-1.1, J-1.2, J-2.1, J-2.2 o J-2.3:



donde R^{19a} y R^{19b} representan un átomo de hidrógeno; alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo

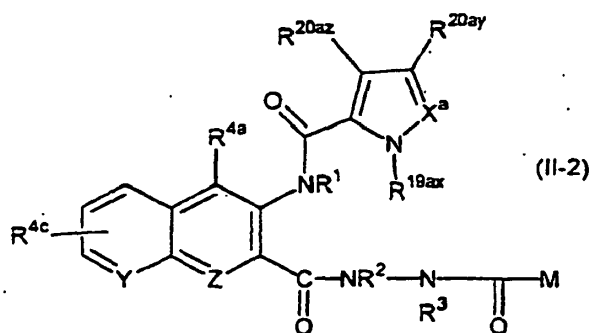
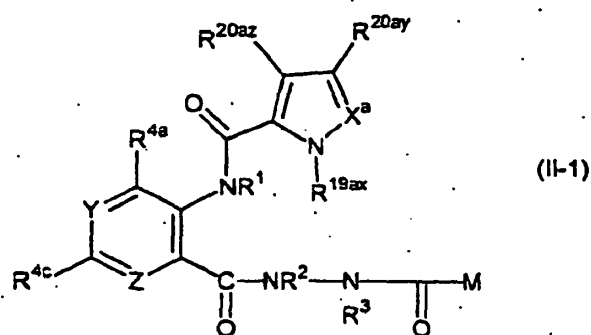
5 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido
 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente
 con uno o más átomos de halógeno; o heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más
 5 sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro,
 (4.) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido
 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;
 R^{20a} y R^{20b} representan un átomo de halógeno, ciano, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos
 de halógeno, alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cianoalquilo(C2-C6)oxi,
 10 alcoxi(C2-C6)alquiloxi sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquenil(C2-C6)oxi sustituido
 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos
 de halógeno, alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-
 C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, o
 fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste
 en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos
 15 de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;
 heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados
 del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente
 con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno
 o fenoxi sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste
 20 en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos
 de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;
 p representa un número entero de 0 a 3, y
 q representa un número entero de 0 a 3 (siempre que, cuando p es un número entero de 2 o 3, dos o más R^{20a} 's
 pueden ser iguales o diferentes y, cuando q es un número entero de 2 o 3, dos o más R^{20b} 's pueden ser iguales o
 25 diferentes).

5. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, un N-óxido del mismo o una sal
 adecuada del mismo, donde Q es Q1,
 A^{31} es oxígeno y
 30 R^6 representa un átomo de hidrógeno; alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes
 independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) alcoxi C1-C6 sustituido
 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (3) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más
 átomos de halógeno, (4) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; (5)
 35 alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) dialquil(C2-C6)amino
 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, y (7) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con
 uno o más átomos de halógeno;
 C3-C6 cicloalquilo. sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo
 que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de
 40 halógeno;
 fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste
 en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos
 de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio
 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con
 uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de
 45 halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-
 C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido
 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o
 más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de
 halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;
 50 heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados
 del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente
 con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;
 un anillo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes
 independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido
 55 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;
 o fenilalquilo C7-C9 o fenoxialquilo C7-C9: cada uno de dichos anillos de fenilo sustituidos opcionalmente con uno o
 más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3)
 nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido
 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno.
 60

6. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 5, donde A^1 y A^2 son átomos de oxígeno.

7. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, un N-óxido del mismo o una sal
 adecuada del mismo, donde Q es Q2, A^{32} es oxígeno y

- R⁷ es alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;
- 5 fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;
- 10 heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; o fenilalquilo C7-C9 cuyo radical anular está sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno.
- 20 8. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 7, donde A¹ y A² son átomos de oxígeno.
- 25 9. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, un N-óxido del mismo o una sal adecuada del mismo, donde Q es Q₄, A³⁴ es oxígeno y R⁹ y R¹⁰ representan independientemente un átomo de hidrógeno; alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;
- 30 fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;
- 35 heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno o fenilalquilo C7-C9 cuyo radical anular está sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno.
- 40 10. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 9, donde A¹ y A² son átomos de oxígeno.
- 50 11. Un compuesto de hidrazida de acuerdo con la reivindicación 1, que está representado por la fórmula (II-1) o (II-2),



donde,

- 5 X^a representa un átomo de nitrógeno o CR^{20ax} ,
 Y y Z representan independientemente un átomo de nitrógeno o CR^{4b} , pero ni Y ni Z son CR^{4b} al mismo tiempo,
 R^1 representa un átomo de hidrógeno o alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno,
 R^2 y R^3 representan independientemente un átomo de hidrógeno, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o
 10 más átomos de halógeno, cianoalquilo C2-C6, hidroxialquilo C1-C6, alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente
 con uno o más átomos de halógeno, alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno,
 alquino C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cicloalquilo C3-C6 sustituido
 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos
 de halógeno, alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-
 C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C2-C6)carbonilo sustituido
 15 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxi(C2-C6)carbonilo, alquil(C2-C6)aminocarbonilo,
 dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo, o trialquil(C3-C6)sililo;
 o representan fenilo, fenilalquilo C7-C9 o fenilcarbonilo, cada uno de dichos anillos de fenilo sustituidos
 opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo
 20 de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) hidroxilo, (5) carboxilo, (6) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o
 más átomos de halógeno, (7) hidroxialquilo C1-C6; (8) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más
 átomos de halógeno, (9) cianoalquilo C2-C6, (10) alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más
 átomos de halógeno, (11) alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno (12)
 alquino C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) cicloalquilo C3-C6 sustituido
 25 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (14) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más
 átomos de halógeno, (15) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (16)
 alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (17) alquil(C1-C6)amino (18)
 dialquil(C2-C8)amino, (19) cicloalquil(C3-C6)amino, (20) alquil(C2-C6)carbonilo, (21) alcoxi(C2-C6)carbonilo, (22)
 alquil(C2-C6)aminocarbonilo, (23) dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, (24) cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo y (25)
 trialquil(C3-C6)sililo; o
 30 R^2 y R^3 se toman junto con los dos átomos de nitrógeno a los que están unidos para formar un anillo de 5 a 8
 miembros que contiene dos átomos de nitrógeno, uno o más CH_2 o $C(=O)$, y opcionalmente uno o dos miembros
 anulares seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de oxígeno, (2) un átomo de azufre, (3) $S(=O)$, (4)
 $S(=O)_2$ y (5) NR^a (donde R^a representa alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno,
 alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, o un fenilo sustituido
 35 opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo
 de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5)
 alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido
 opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o
 más átomos de halógeno, (8) C1-C6. alquilsulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno,
 40 (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino

sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno); y donde el anillo en los átomos de carbono está sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, y (3) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; R^{4a} , R^{4b} y R^{4c} representan independientemente un átomo de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, carboxilo, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, C2-C6 alcoxi sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cianoalquilo C2-C6, alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquino C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)sulfino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alquil(C1-C6)amino, dialquil(C2-C8)amino, cicloalquil(C3-C6)amino, alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxi(C2-C6)carbonilo, alquil(C2-C6)aminocarbonilo, dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, trialquil(C3-C6)sililo; o representan independientemente fenilo, bencilo, fenoxi, o anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) hidroxilo, (5) carboxilo, (6) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) hidroxialquilo C1-C6, (8) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) cianoalquilo C2-C6, (10) alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alquino C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (14) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (15) alquil(C1-C6)sulfino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (16) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (17) alquil(C1-C6)amino, (18) dialquil(C2-C8)amino, (19) cicloalquil(C3-C6)amino, (20) alquil(C2-C6)carbonilo, (21) alcoxi(C2-C6)carbonilo, (22) alquil(C2-C6)aminocarbonilo, (23) dialquil(C3-C8)aminocarbonilo, (24) cicloalquil(C4-C6)aminocarbonilo y (25) trialquil(C3-C6)sililo;

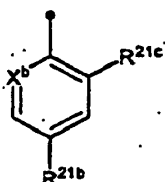
M es un átomo de hidrógeno; alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (3) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (4) alquil(C1-C6)sulfino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, y (7) cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquil(C1-C6)amino; dialquil(C2-C8)amino; fenilo, fenialquilo C7-C9 o fenoxialquilo C7-C9, cada uno de dichos anillos de fenilo sustituidos opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

o un anillo heterocíclico no aromático de 3 a 8 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno;

R^{19ax} representa un átomo de hidrógeno; alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cianoalquilo C2-C6 ; alcoxialquilo C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alqueno C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquino C2-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cicloalquilo C3-C6 sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, y (2) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-

- C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; fenilalquilo C7-C9 cuyo anillo de fenilo está sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; o piridinilalquilo C7-C9 cuyo anillo de piridina está sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (6) alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (7) alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (8) alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (9) alquil(C1-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (10) dialquil(C2-C6)amino sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (11) alquil(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (12) alcoxi(C2-C6)carbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, (13) alquil(C2-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (14) dialquil(C3-C6)aminocarbonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; R^{20ax} , R^{20ay} y R^{20az} representan un átomo de halógeno; ciano; nitro; tiocianato; alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; cianoalquilo(C2-C6)oxi; alcoxi(C2-C6)alquiloxi sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquinil(C2-C6)oxi sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquil(C1-C6)tio sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquil(C1-C6)sulfinilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; alquil(C1-C6)sulfonilo sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno; o fenoxi sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientes seleccionados del grupo que consiste en (1) un átomo de halógeno, (2) ciano, (3) nitro, (4) alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno y (5) alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno.
- 50 12. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 11, donde R^1 es un átomo de hidrógeno, R^2 es un átomo de hidrógeno o alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, R^3 es un átomo de hidrógeno, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno o alcoxi(C2-C6)carbonilo, R^{4a} es un átomo de halógeno o alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, R^{4c} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, ciano o alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, R^{19a} es



- donde X^b es un átomo de nitrógeno o CR^{21a} ,
 R^{20ax} y R^{20ay} son independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquilo C1-C6 sustituido
opcionalmente con uno o más átomos de halógeno, alcoxi C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos
de halógeno o alquil(C1-C6)io sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno,
5 R^{20az} es un átomo de hidrógeno,
 R^{21a} , R^{21b} y R^{21c} se seleccionan independientemente del grupo que consiste en un átomo de hidrógeno, un átomo de
halógeno o alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con uno o más átomos de halógeno.
13. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 12, donde X^a y X^b son átomos de nitrógeno,
10 Y es CH y
Z es un átomo de nitrógeno.
14. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 12, donde X^a y X^b son átomos de nitrógeno,
Y es un átomo de nitrógeno y
15 Z es CH.
15. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 12, donde R^{4b} es un átomo de hidrógeno.
16. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 15, donde M es un átomo de hidrógeno, alquilo C1-C6, alcoxi C1-
20 C6, amino, alquil(C1-C6)amino o dialquil(C2-C8)amino.
17. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 16, donde R^2 es un átomo de hidrógeno, metilo o etilo,
 R^3 es un átomo de hidrógeno, metilo, etilo o metoxicarbonilo,
 R^{4a} es metilo, cloro, bromo o yodo,
25 R^{4c} es hidrógeno, fluoro, cloro, bromo, yodo o ciano,
 R^{20ay} es cloro, bromo, yodo, trifluorometilo o pentafluoroetoxi,
 R^{22b} es un átomo de hidrógeno,
 R^{22c} es cloro o bromo,
M es hidrógeno, metoxi, etoxi, metilamino o dimetilamino.
30
18. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 17, donde R^2 es un átomo de hidrógeno,
 R^3 es metilo o etilo y
M es un átomo de hidrógeno.
- 35 19. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 18, donde R^2 y R^3 son independientemente hidrógeno, metilo o
etilo y
M es metoxi o etoxi.
20. Un plaguicida que comprende el compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 como ingrediente activo.
40
21. Use del compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 para controlar una plaga, con la condición de que se
excluye un método para el tratamiento del cuerpo humano o animal.
22. Use del compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 para la fabricación de una preparación plaguicida.
45
23. Un método para controlar una plaga que comprende aplicar el compuesto de acuerdo con la reivindicación 1
directamente a una plaga, o al lugar en el que habita la plaga, con la condición de que el método no es un método
para el tratamiento del cuerpo humano o animal.
50