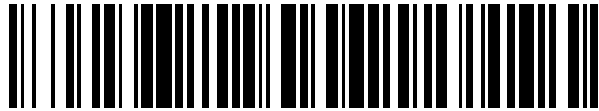


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 393 496**

51 Int. Cl.:

**A01N 43/54** (2006.01)

**A01N 43/66** (2006.01)

**C07D 239/24** (2006.01)

**C07D 239/52** (2006.01)

**C07D 251/12** (2006.01)

**C07D 251/20** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **05761888 .6**

96 Fecha de presentación: **21.07.2005**

97 Número de publicación de la solicitud: **1773124**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **18.04.2007**

54 Título: **Uso de sulfonamidas como fungicida agrícola y hortícola**

30 Prioridad:

**23.07.2004 JP 2004216399**

**15.03.2005 JP 2005073005**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:

**21.12.2012**

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:

**21.12.2012**

73 Titular/es:

**BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT  
(100.0%)**

**ALFRED-NOBEL-STRASSE 50  
40789 MONHEIM, DE**

72 Inventor/es:

**ARAKI, KOICHI;  
KUDO, SACHIO;  
SATO, YOSHITAKA;  
ITO, MASAHITO;  
GOMIBUCHI, TAKUYA;  
ARAKI, YASUO;  
INUTA, TETSUYA;  
ENDO, KEIJI;  
SHIRAKURA, SHINICHI y  
NAKAMURA, SHIN**

74 Agente/Representante:

**CARPINTERO LÓPEZ, Mario**

**ES 2 393 496 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

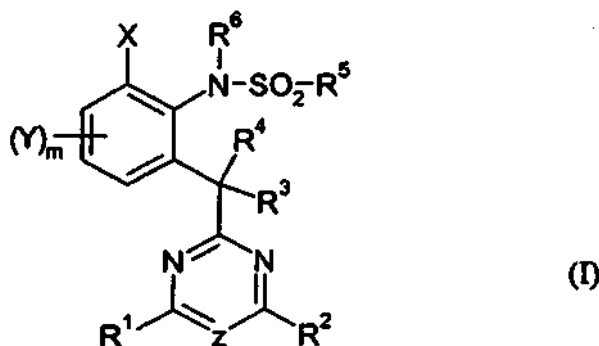
Uso de sulfonanilidas como fungicida agrícola y hortícola

La presente invención se refiere a un uso de sulfonanilidas como fungicida agrícola y hortícola, a nuevas sulfonanilidas y a procedimientos para su preparación.

- 5 Los fungicidas agrícolas y hortícolas se conocen, por ejemplo, a partir de la Publicación de Patente Japonesa Abierta a Inspección Pública N° JP 01(1989)-156952 A que desvela sulfonamidas fungicidas.

10 Ya se sabe que algunas clases de sulfonanilidas muestran una acción como herbicida (cf. por ejemplo, el Folleto Internacional PCT Abierto a Inspección Pública WO 93/9099 A, el Folleto Internacional PCT Abierto a Inspección Pública WO 96/41799 A, la Publicación de Patente Japonesa Abierta a Inspección Pública N° JP 11(1999)-60562 A, el documento EP 1 101 760 A (relacionado con el Folleto Internacional PCT Abierto a Inspección Pública WO 00/06553, la Publicación de Patente Japonesa Abierta a Inspección Pública N°JP 2000-44546 A y la Publicación de Patente Japonesa Abierta a Inspección Pública N°JP 2000-63360 A), la Publicación de Patente Japonesa Abierta a Inspección Pública N° JP 2002-145705 A).

Se sabe ahora que un grupo de sulfonanilidas de las siguientes fórmulas (I) tienen actividades fungicidas;



15 en la que

X representa hidrógeno, halógeno, alquilo, alcoxicarbonilo, acilo, dialquilaminocarbonilo, alcoxi, alquilsulfonilo, alquilsulfoniloxi, dialquilamino, haloalquilo, haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, haloalquilsulfoniloxi, formilo, carboxi, ciano, nitro o fenoxi,

20 Y representa halógeno, alquilo que puede estar opcionalmente sustituido, alcoxialquilo, alcoxicarbonilo, acilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, dialquilamino, ciano, amino o nitro, y 2 o 3 Y pueden ser iguales o diferentes entre sí en el caso en el que m sea 2 o 3,

Z representa C-R<sup>7</sup> o N,

25 m representa un número entero de 0 a 3,

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> representa cada uno independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo que puede estar opcionalmente sustituido, cicloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio o amino,

R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> representa cada uno independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo, alcoxi que puede estar opcionalmente sustituido, alquiltio, alquilsulfonilo o amino,

30 R<sup>3</sup> representa hidroxilo y R<sup>4</sup> representa hidrógeno o alquilo, o

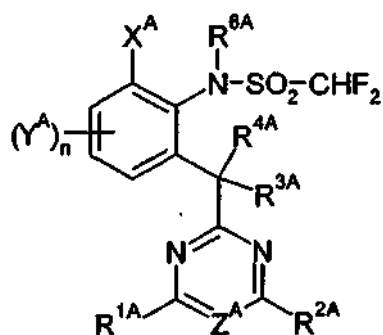
R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> pueden formar juntos C=O con el átomo de carbono al que están unidos,

R<sup>5</sup> representa alquilo que puede estar opcionalmente sustituido, alqueno, alquino, cicloalquilo o alcoxicarbonilamino,

35 R<sup>6</sup> representa hidrógeno, alquilo que puede estar opcionalmente sustituido, alqueno, alcoxialquilo, alcoxicarbonilo, acilo o un grupo -SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, y

R<sup>7</sup> representa hidrógeno o alquilo.

Las sulfonanilidas, representadas por la siguiente fórmula (IA) e incluidas en la fórmula (I) mencionada anteriormente de la presente invención, son compuestos novedosos que no se habían descrito en las publicaciones existentes. La fórmula



(Ia)

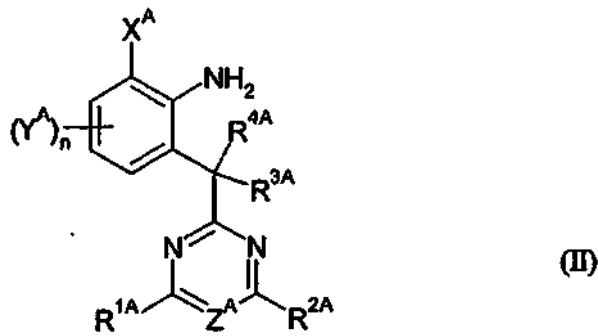
en la que

- 5  $X^A$  representa hidrógeno, halógeno, alquilo, alcoxicarbonilo, acilo, dialquilaminocarbonilo, alcoxi, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, dialquilamino, haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilsulfamilo, haloalquilsulfonilo, haloalquil-sulfonilo, formilo, carboxi, ciano, nitro o fenoxi,
- $Y^A$  representa halógeno, alquilo que puede estar opcionalmente sustituido, alcoxialquilo, alcoxicarbonilo, acilo, alcoxi, alquilsulfonilo, haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, dialquilamino, ciano o nitro, y 2 o 3  $Y^A$  pueden ser iguales o diferentes entre sí en el caso en el que n es 2 o 3,
- $Z^A$  representa C- $R^{7A}$  o N,
- 10 n representa un número entero de 0-3,
- $R^{1A}$  y  $R^{2A}$  representa cada uno independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo que puede estar opcionalmente sustituido, cicloalquilo, alcoxi, haloalcoxi o alquiltio,
- $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  representa cada uno independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo, alcoxi, alquiltio o alquilsulfonilo,
- $R^{3A}$  representa hidroxilo y  $R^{4A}$  representa hidrógeno o alquilo, o
- 15  $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  pueden formar juntos C=O con el átomo de carbono al que están unidos,
- $R^{6A}$  representa hidrógeno, alquilo que puede estar opcionalmente sustituido, alcoxialquilo, alcoxicarbonilo, acilo o un grupo - $SO_2R^{5A}$ ,
- $R^{5A}$  representa alquilo que puede estar opcionalmente sustituido, y
- $R^{7A}$  representa hidrógeno o alquilo,
- 20 con la excepción de los siguientes casos (T-1) - (T-3):
- (T-1) el caso en el que  $X^A$  representa alquilo, y n representa 0,
- (T-2) el caso en el que  $X^A$  representa hidrógeno, n representa 0,  $Z^A$  representa CH,  $R^{1A}$  y  $R^{2A}$  representan metoxi,  $R^{3A}$  representa hidroxilo y  $R^{4A}$  representa hidrógeno, o  $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  forman juntos C=O con el átomo de carbono al que están unidos, y  $R^{6A}$  representa hidrógeno,
- 25 (T-3) el caso en el que  $X^A$  representa halógeno, n representa 0,  $Z^A$  representa CH o N,  $R^{1A}$  y  $R^{2A}$  representan metoxi,  $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  representan hidrógeno,  $R^{3A}$  representa hidroxilo y  $R^{4A}$  representa hidrógeno, o  $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  forman juntos C=O con el átomo de carbono al que están unidos, y  $R^{6A}$  representa hidrógeno.

Los compuestos de fórmula (Ia) pueden obtenerse, análogamente a los compuestos de fórmula (I) conocidos a partir del Folleto Internacional PCT Abierto a Inspección Pública WO 93/9099, el Folleto Internacional PCT Abierto a Inspección Pública WO 96/41799, la Publicación de Patente Japonesa Abierta a Inspección Pública N° 60562/1999, la Publicación de Patente Japonesa Abierta a Inspección Pública N°2000-44546, mediante un procedimiento en el que

a) en el caso en el que  $R^{6A}$  representa hidrógeno o difluorometanosulfonilo:

compuestos de fórmula (II)



en la que

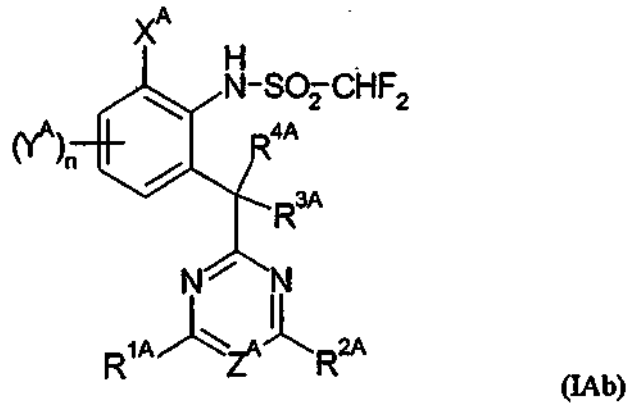
$X^A$ ,  $Y^A$ ,  $Z^A$ ,  $n$ ,  $R^{1A}$ ,  $R^{2A}$ ,  $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  tienen la misma definición que la mencionada anteriormente,

5 se hacen reaccionar con cloruro de difluorometanosulfonilo en presencia de disolventes inertes y, si fuera apropiado, en presencia de un aglutinante ácido,

o,

b) En el caso en el que  $R^{6A}$  representa alquilo que puede estar opcionalmente sustituido, alcoxilalquilo, acilo, alcoxycarbonilo o el grupo  $-SO_2R^{5A}$ :

compuestos de fórmula (IAb)



10

en la que

$X^A$ ,  $Y^A$ ,  $Z^A$ ,  $n$ ,  $R^{1A}$ ,  $R^{2A}$ ,  $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  tienen la misma definición que la mencionada anteriormente,

se hacen reaccionar con compuestos de fórmula (III)



15 en la que

$R^{6A}$  representa alquilo que puede estar opcionalmente sustituido, alcoxilalquilo, acilo, alcoxycarbonilo o el grupo  $-SO_2R^{5A}$

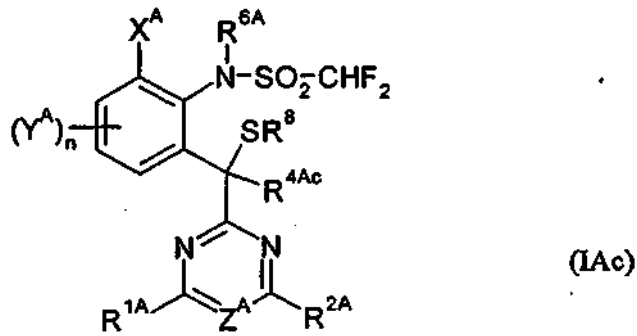
$L^b$  representa halógeno,

en presencia de disolventes inertes y, si fuera apropiado, en presencia de un aglutinante ácido,

20 o,

c) En el caso en el que  $R^{3A}$  representa hidrógeno y  $R^{4A}$  representa hidrógeno o alquilo:

compuestos de fórmula (IAC)



en la que

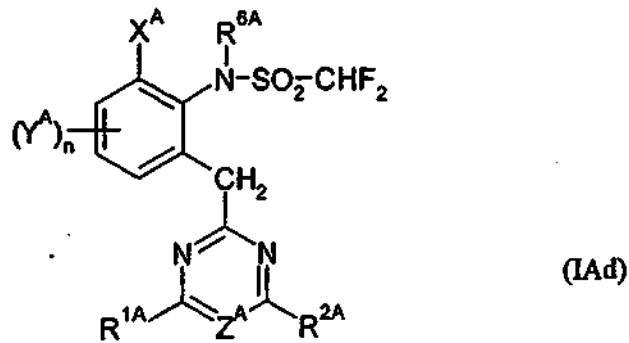
$R^{4Ac}$  representa hidrógeno o alquilo,

$R^B$  representa alquilo,

5  $X^A$ ,  $Y^A$ ,  $Z^A$ ,  $n$ ,  $R^{1A}$ ,  $R^{2A}$  y  $R^{6A}$  tienen la misma definición que la mencionada anteriormente,

se hacen reaccionar con un agente reductor en presencia de disolventes inertes, o,

d) En el caso en el que  $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  forman juntos C=O con el átomo de carbono al que están unidos:  
compuestos de fórmula (IAd)



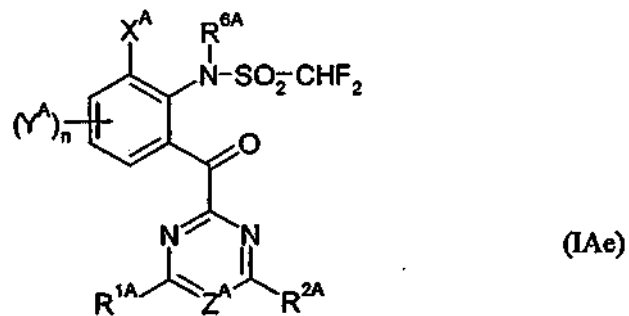
10 en la que

$X^A$ ,  $Y^A$ ,  $Z^A$ ,  $n$ ,  $R^{1A}$ ,  $R^{2A}$  y  $R^{6A}$  tienen la misma definición que la mencionada anteriormente, se hacen reaccionar con un agente oxidante en los disolventes inertes y, si fuera apropiado, en presencia de un catalizador ácido,

o,

e) En el caso en el que  $R^{3A}$  representa hidroxilo y  $R^{4A}$  representa alquilo:

15 compuestos de fórmula (IAe)



en la que

$X^A$ ,  $Y^A$ ,  $Z^A$ ,  $n$ ,  $R^{1A}$ ,  $R^{2A}$  y  $R^{6A}$  tienen la misma definición que la mencionada anteriormente, se hacen reaccionar con compuestos de fórmula (IV)



en la que

$R^{4Ae}$  representa alquilo,

$L^e$  representa halógeno,

5 en presencia de disolventes inertes, o,

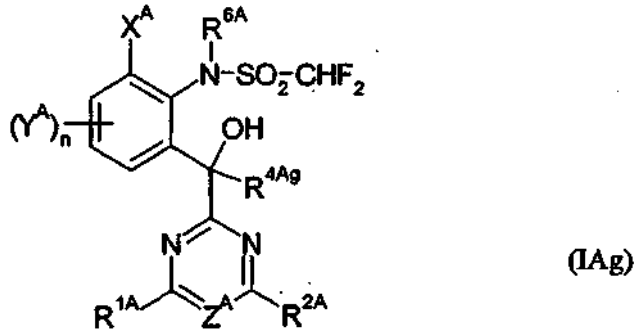
f) en el caso en el que  $R^{3A}$  representa hidroxilo y  $R^{4A}$  representa hidrógeno:

compuestos de la fórmula (IAe) mencionada anteriormente se hacen reaccionar con un compuesto de complejo de hidruro de metal alcalino o complejo de borano en presencia de disolventes inertes,

o,

10 g) en el caso en el que  $R^{3A}$  representa hidrógeno y  $R^{4A}$  representa hidrógeno o alquilo:

compuestos de fórmula (IAg)



en la que

$R^{4Ag}$  representa hidrógeno o alquilo,

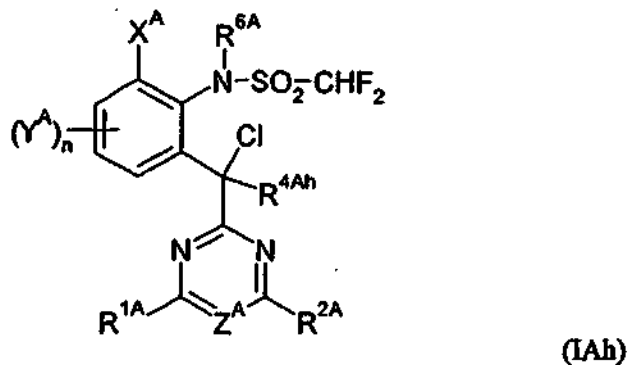
15  $X^A$ ,  $Y^A$ ,  $Z^A$ ,  $n$ ,  $R^{1A}$ ,  $R^{2A}$  y  $R^{6A}$  tienen la misma definición que la mencionada anteriormente,

se hacen reaccionar con un agente de halogenación en presencia de disolventes inertes,

o,

h) en el caso en el que  $R^{3A}$  representa alcoxi o alquiltio y  $R^{4A}$  representa hidrógeno o alquilo:

compuestos de fórmula (IAh)



20

en la que

$R^{4Ab}$  representa hidrógeno o alquilo,

$X^A$ ,  $Y^A$ ,  $Z^A$ ,  $n$ ,  $R^{1A}$ ,  $R^{2A}$  y  $R^{6A}$  tienen la misma definición que la mencionada anteriormente, se hacen reaccionar con compuestos de fórmula (V)

25  $R^{3Ah}-M \quad (V)$

en la que

R<sup>3Ah</sup> representa alcoxi o alquiltio,

M representa hidrógeno o metal alcalino,

en presencia de disolventes inertes y, si fuera apropiado, en presencia de un aglutinante ácido.

- 5 Los compuestos representados por la fórmula (I), que incluyen los nuevos compuestos de fórmula (IA), muestran una fuerte acción de control de plagas vegetales.

En la presente memoria descriptiva,

"Halógeno" representa flúor, cloro, bromo o yodo, preferentemente representa flúor o cloro.

- 10 "Alquilo" puede ser de cadena lineal o de cadena ramificada y pueden mencionarse, por ejemplo, alquilo C<sub>1-6</sub>, específicamente metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc-butilo, n- o neo-pentilo, n-hexilo, etc.

"Cicloalquilo": pueden mencionarse, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, etc.

"Alqueno" puede ser de cadena lineal o de cadena ramificada y pueden mencionarse, por ejemplo, alqueno C<sub>2-7</sub>, específicamente vinilo, alilo, isopropenilo, 1-propenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 1-heptenilo, 2-heptenilo, etc.

- 15 "Alquino" puede ser de cadena lineal o de cadena ramificada y pueden mencionarse, por ejemplo, alquino C<sub>2-7</sub>, específicamente etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 1-heptinilo, 2-heptinilo, etc.

- 20 "Alcoxi" representa un grupo alquil-O-, cuya parte alquilo tiene el significado mencionado anteriormente, y puede ser, por ejemplo, alcoxi C<sub>1-6</sub>, y pueden mencionarse específicamente metoxi, etoxi, n- o iso-propoxi, n-, iso-, sec- o terc-butoxi, n-pentiloxi, n-hexiloxi, etc.

"Alquiltio" representa un grupo alquil-S-, cuya parte alquilo tiene el significado mencionado anteriormente, y puede ser, por ejemplo, alquil C<sub>1-6</sub> tio, y pueden mencionarse específicamente metiltio, etiltio, n- o iso-propiltio, n-, iso-, sec- o terc-butiltio, n-pentiltio, n-hexiltio, etc.

- 25 "Alquilsulfinilo" representa un grupo alquil-S(O)-, cuya parte alquilo tiene el significado mencionado anteriormente, y puede ser, por ejemplo, alquil C<sub>1-6</sub> sulfinilo, y pueden mencionarse específicamente metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o iso-propil-sulfinilo, n-, iso-, sec- o terc-butilsulfinilo, n-pentilsulfinilo, n-hexilsulfinilo, etc.

"Alquilsulfonilo" representa un grupo alquil-SO<sub>2</sub>-, cuya parte alquilo tiene el significado mencionado anteriormente, y puede ser, por ejemplo, alquil C<sub>1-6</sub> sulfonilo, y pueden mencionarse específicamente metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o iso-propilsulfonilo, n-, iso-, sec- o terc-butilsulfonilo, n-pentilsulfonilo, n-hexilsulfonilo, etc.

- 30 "Alquilsulfonilo" representa un grupo alquil-SO<sub>2</sub>-O-, cuya parte alquilo tiene el significado mencionado anteriormente, y puede ser, por ejemplo, alquil C<sub>1-6</sub> sulfonilo, y pueden mencionarse específicamente metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o iso-propilsulfonilo, n-, iso-, sec- o terc-butilsulfonilo, n-pentilsulfonilo, n-hexilsulfonilo, etc.

- 35 "Haloalquilo" representa un alquilo de cadena lineal o de cadena ramificada, al menos uno de cuyos hidrógenos está sustituido con halógeno y pueden mencionarse, por ejemplo, alquilo C<sub>1-6</sub>, sustituido con 1 a 6 fluoro, cloro y /o bromo, y como ejemplos específicos pueden mencionarse fluorometilo, clorometilo, diclorometilo, bromometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorodifluorometilo, triclolorometilo, 2-fluoroetilo, 2-cloroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-1,1,2-trifluoroetilo, 3-fluoropropilo, 3-cloropropilo, 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, 1,2,2,3,3,3-hexafluoropropilo, etc.

- 40 La parte haloalquilo en "haloalcoxi", "haloalquiltio", "haloalquilsulfinilo", "haloalquilsulfonilo" y "haloalquilsulfonilo" puede ser de la misma definición que la del "haloalquilo" mencionado anteriormente y

específicamente como "haloalcoxi" pueden mencionarse, por ejemplo, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorodifluorometoxi, diclorometoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 3-cloropropoxi, etc.,

específicamente como "haloalquiltio" pueden mencionarse, por ejemplo, difluorometiltio, trifluorometiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio, 3-fluoropropiltio, etc.,

- 45 específicamente como "haloalquilsulfinilo" pueden mencionarse, por ejemplo, difluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfinilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfinilo, 3-fluoropropilsulfinilo, etc.,

específicamente como "haloalquilsulfonilo" pueden mencionarse, por ejemplo, difluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo, 3-fluoropropilsulfonilo, etc., y

específicamente como "haloalquilsulfoniloxi" pueden mencionarse, por ejemplo, difluorometilsulfoniloxi, trifluorometilsulfoniloxi, 2,2,2-trifluoroetilsulfoniloxi, 3-fluoropropilsulfoniloxi, etc.,

5 "Acilo" incluye un grupo alquil-(C=O)-, cuya parte alquilo tiene el significado mencionado anteriormente, y un grupo cicloalquil-(C-O)-, cuya parte cicloalquilo tiene el significado mencionado anteriormente, y puede ser, por ejemplo, un grupo alquil C<sub>1-6</sub>-(C=O)- o un grupo cicloalquil C<sub>3-7</sub>-(C=O)-, y pueden mencionarse específicamente metilcarbonilo (acetilo), etilcarbonilo (propionilo), ciclopropilcarbonilo, ciclopentilcarbonilo, ciclohexilcarbonilo, etc.

"Dialquilamino" es amino, sustituido con dos alquilos iguales o diferentes, y pueden mencionarse específicamente, por ejemplo, dimetilamino, dietilamino, di(n- o iso-propil)amino, etc.

10 Como "alcoxicarbonilo" pueden mencionarse, por ejemplo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o iso-propoxicarbonilo, etc.

Como "dialquilaminocarbonilo": pueden mencionarse, por ejemplo, dimetilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, di(n-propil)aminocarbonilo, etc.

Como "alcoxicarbonilamino" pueden mencionarse, por ejemplo, metoxicarbonilamino, etoxicarbonilamino, n- o iso-propoxicarbonilamino, etc.

15 Como "alcoxialquilo" pueden mencionarse, por ejemplo, metoximetilo, 2-metoxietilo, 1-metoxietilo, 3-metoxipropilo, etoximetilo, 2-etoxietilo, etc.

20 Como sustituyentes en "alquilo que puede estar opcionalmente sustituido" pueden mencionarse ciano, fenilo, alcoxicarbonilo, halógeno, etc. y el alquilo que puede estar sustituido con tales sustituyentes incluye, por ejemplo, alquilo C<sub>1-6</sub> que puede estar sustituido con ciano, alquilo C<sub>1-6</sub> que puede estar sustituido con fenilo, alquilo C<sub>1-6</sub> que puede estar sustituido con alcoxicarbonilo C<sub>1-6</sub>, alquilo C<sub>1-6</sub>, al menos uno de cuyos hidrógenos puede estar sustituido con un átomo de halógeno, particularmente con 1-6 flúoro, cloro y/o bromo, y pueden mencionarse específicamente metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc-butilo, n- o neo-pentilo, n-heptilo; cianometilo, 1-cianoetilo, 2-cianoetilo; bencilo, 2-feniletilo, 1-feniletilo (fenetilo), 1-fenilpropilo, 2-fenilpropilo, 3-fenilpropilo; metoxicarbonilmetilo, etoxicarbonilmetilo, (n- o iso-)propiloxicarbonilmetilo, (n-, iso-, sec- o terc-)butiloxicarbonilmetilo, 2-metoxicarboniletilo, 3-metoxicarbonilpropilo; fluorometilo, clorometilo, diclorometilo, bromometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorodifluorometilo, diclorometilo, triclorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-1,1,2-trifluoroetilo, 3-fluoropropilo, 3-cloropropilo, 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, 1,2,2,3,3,3-hexafluoropropilo, etc.

En los compuestos de la fórmula mencionada anteriormente (IA), preferentemente

30 X<sup>A</sup> representa hidrógeno, flúor, cloro, alquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>-carbonilo, alquil C<sub>1-6</sub>-carbonilo, cicloalquil C<sub>3-7</sub>-carbonilo, di(alquil C<sub>1-6</sub>)aminocarbonilo, alcoxi C<sub>1-6</sub>, alquil C<sub>1-6</sub>sulfonilo, alquil C<sub>1-6</sub>sulfoniloxi, di(alquil C<sub>1-6</sub>)amino, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalquil C<sub>1-6</sub>tio, haloalquil C<sub>1-6</sub>sulfinilo, haloalquil C<sub>1-6</sub>sulfonilo, haloalquil C<sub>1-6</sub>sulfoniloxi, formilo, carboxi, ciano, nitro o fenoxi,

35 Y<sup>A</sup> representa flúor, cloro, alquilo C<sub>1-6</sub>, al menos uno de cuyos hidrógenos puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi C<sub>1-6</sub>-alquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>-carbonilo, alquil C<sub>1-6</sub>-carbonilo, alcoxi C<sub>1-6</sub>, alquil C<sub>1-6</sub>sulfonilo, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalquil C<sub>1-6</sub>tio, haloalquil C<sub>1-6</sub>sulfinilo, haloalquil C<sub>1-6</sub>sulfonilo, di(alquil C<sub>1-6</sub>)amino, ciano o nitro, y 2 Y<sup>A</sup> pueden ser iguales o diferentes entre sí en el caso en el que n es 2,

Z<sup>A</sup> representa C-R<sup>7A</sup> o N,

n representa 0, 1 o 2,

40 R<sup>1A</sup> y R<sup>2A</sup> representa cada uno independientemente hidrógeno, cloro, alquilo C<sub>1-6</sub>, al menos uno de cuyos hidrógenos puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, cicloalquilo C<sub>3-7</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub> o alquil C<sub>1-6</sub>tio,

R<sup>3A</sup> y R<sup>4A</sup> representa cada uno independientemente hidrógeno, flúor, cloro, alquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, alquil C<sub>1-6</sub>tio o alquil C<sub>1-6</sub>sulfonilo,

45 R<sup>3A</sup> representa hidroxilo y R<sup>4A</sup> representa hidrógeno o alquilo C<sub>1-6</sub>, o

R<sup>3A</sup> y R<sup>4A</sup> pueden formar juntos C=O con el átomo de carbono al que están unidos,

R<sup>6A</sup> representa hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, al menos uno de cuyos hidrógenos puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi C<sub>1-6</sub>-alquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>-carbonilo, alquil C<sub>1-6</sub>-carbonilo, cicloalquil C<sub>3-7</sub>-carbonilo, o un grupo -SO<sub>2</sub>R<sup>5A</sup>,

50 R<sup>5A</sup> representa alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub> o alquilo C<sub>1-6</sub> sustituido con ciano, y



$R^{7A}$  representa hidrógeno o alquilo  $C_{1-6}$ ,

con la excepción de que se excluyen los siguientes casos (T-1) - (T-3):

(T-1) el caso en el que  $X^A$  representa alquilo  $C_{1-6}$ , y n representa 0,

5 (T-2) el caso en el que  $X^A$  representa hidrógeno, n representa 0,  $Z^A$  representa CH,  $R^{1A}$  y  $R^{2A}$  representan metoxi,  $R^{3A}$  representa hidroxilo y  $R^{4A}$  representa hidrógeno, o  $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  forman juntos C=O con el átomo de carbono al que están unidos, y  $R^{6A}$  representa hidrógeno,

(T-3) el caso en el que  $X^A$  representa flúor o cloro, n representa 0,  $Z^A$  representa CH o N,  $R^{1A}$  y  $R^{2A}$  representan metoxi,  $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  representan hidrógeno,  $R^{3A}$  representa hidroxilo y  $R^{4A}$  representa hidrógeno, o  $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  forman juntos C=O con el átomo de carbono al que están unidos, y  $R^{6A}$  representa hidrógeno.

10 En los compuestos de la fórmula (IA) mencionada anteriormente, particularmente preferentemente

$X^A$  representa hidrógeno, flúor, cloro, alquilo  $C_{1-4}$ , alcoxi  $C_{1-4}$ -carbonilo, alquil  $C_{1-4}$ -carbonilo, cicloalquil  $C_{3-5}$ -carbonilo, di(alquil  $C_{1-4}$ )aminocarbonilo, alcoxi  $C_{1-4}$ , alquil  $C_{1-4}$ sulfonilo, alquil  $C_{1-4}$ sulfonilo, di(alquil  $C_{1-4}$ )amino, haloalcoxi  $C_{1-4}$ , haloalquil  $C_{1-4}$ tio, haloalquil  $C_{1-4}$ sulfino, haloalquil  $C_{1-4}$ sulfonilo, haloalquil  $C_{1-4}$ sulfonilo, formilo, carboxi, ciano, nitro o fenoxi,

15  $Y^A$  representa flúor, cloro, alquilo  $C_{1-4}$ , al menos uno de cuyos hidrógenos puede estar opcionalmente sustituido con flúor, alcoxi  $C_{1-4}$ -alquilo  $C_{1-4}$ , alcoxi  $C_{1-4}$ -carbonilo, alquil  $C_{1-4}$ -carbonilo, alcoxi  $C_{1-4}$ , alquil  $C_{1-4}$ sulfonilo, haloalcoxi  $C_{1-4}$ , haloalquil  $C_{1-4}$ tio, haloalquil  $C_{1-4}$ sulfino, haloalquil  $C_{1-4}$ sulfonilo, di(alquil  $C_{1-4}$ )amino, ciano o nitro, y 2  $Y^A$  pueden ser iguales o diferentes entre sí en el caso en el que n es 2,

$Z^A$  representa C- $R^{7A}$  o N,

20 n representa 0, 1 o 2,

$R^{1A}$  y  $R^{2A}$  representa cada uno independientemente hidrógeno, cloro, alquilo  $C_{1-4}$ , al menos uno de cuyos hidrógenos puede estar opcionalmente sustituido con flúor, cicloalquilo  $C_{3-5}$ , alcoxi  $C_{1-4}$ , haloalcoxi  $C_{1-4}$  o alquil  $C_{1-4}$ tio,

25  $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  representa cada uno independientemente hidrógeno, flúor, cloro, alquilo  $C_{1-4}$ , alcoxi  $C_{1-4}$ , alquil  $C_{1-4}$ tio o alquil  $C_{1-4}$ sulfonilo,

$R^{3A}$  representa hidroxilo y  $R^{4A}$  representa hidrógeno o alquilo  $C_{1-4}$ , o

$R^{3A}$  y  $R^{4A}$  pueden formar juntos C=O con el átomo de carbono al que están unidos,

30  $R^{6A}$  representa hidrógeno, alquilo  $C_{1-4}$ , al menos uno de cuyos hidrógenos puede estar opcionalmente sustituido con flúor, alcoxi  $C_{1-4}$ -alquilo  $C_{1-4}$ , alcoxi  $C_{1-4}$ -carbonilo, alquil  $C_{1-4}$ -carbonilo, cicloalquil  $C_{3-5}$ -carbonilo, o un grupo  $-SO_2R^{5A}$ ,

$R^{5A}$  representa alquilo  $C_{1-4}$ , haloalquilo  $C_{1-4}$  o alquilo  $C_{1-4}$  sustituido con ciano, y

$R^{7A}$  representa hidrógeno o alquilo  $C_{1-4}$ ,

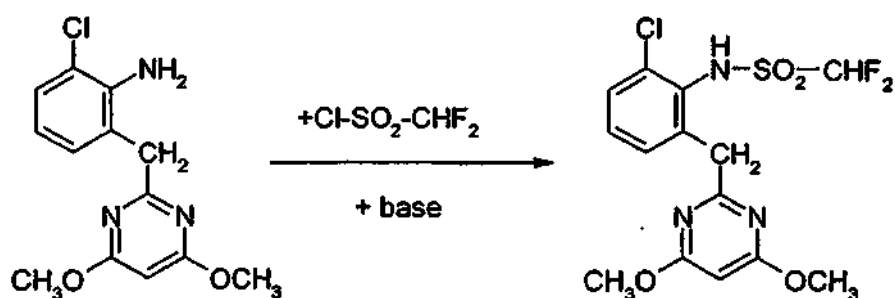
con la excepción de los siguientes casos (T-1) - (T-3) ;

(T-1) el caso en el que  $X^A$  representa alquilo  $C_{1-4}$ , y n representa 0,

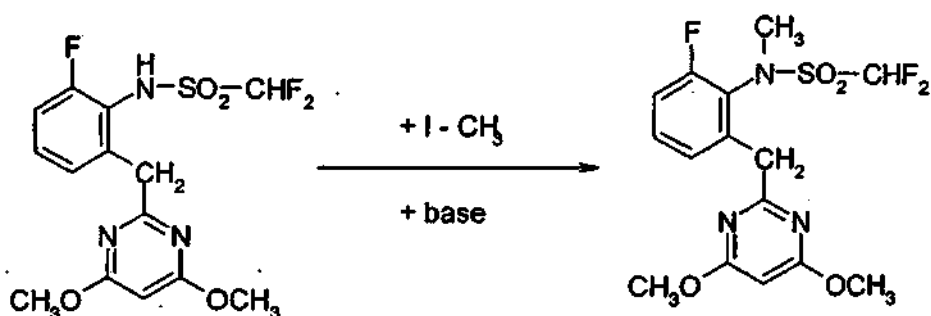
35 (T-2) el caso en el que  $X^A$  representa hidrógeno, n representa 0,  $Z^A$  representa CH,  $R^{1A}$  y  $R^{2A}$  representan metoxi,  $R^{3A}$  representa hidroxilo y  $R^{4A}$  representa hidrógeno, o  $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  forman juntos C=O con el átomo de carbono al que están unidos, y  $R^{6A}$  representa hidrógeno,

40 (T-3) el caso en el que  $X^A$  representa flúor o cloro, n representa 0,  $Z^A$  representa CH o N,  $R^{1A}$  y  $R^{2A}$  representan metoxi,  $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  representan hidrógeno,  $R^{3A}$  representa hidroxilo y  $R^{4A}$  representa hidrógeno, o  $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  forman juntos C=O con el átomo de carbono al que están unidos, y  $R^{6A}$  representa hidrógeno.

El procedimiento de preparación (a) mencionado anteriormente puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reacción en el caso en el que, por ejemplo, 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]anilina y cloruro de difluorometanosulfonilo se usen como los materiales de partida.

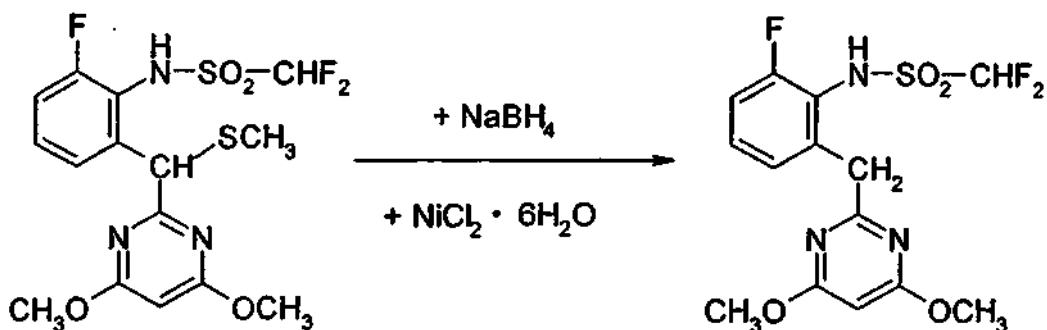


El procedimiento de preparación (b) mencionado anteriormente puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reacción en el caso en el que, por ejemplo, 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]-N-difluorometanosulfonilida y yoduro de metilo se usen como los materiales de partida.



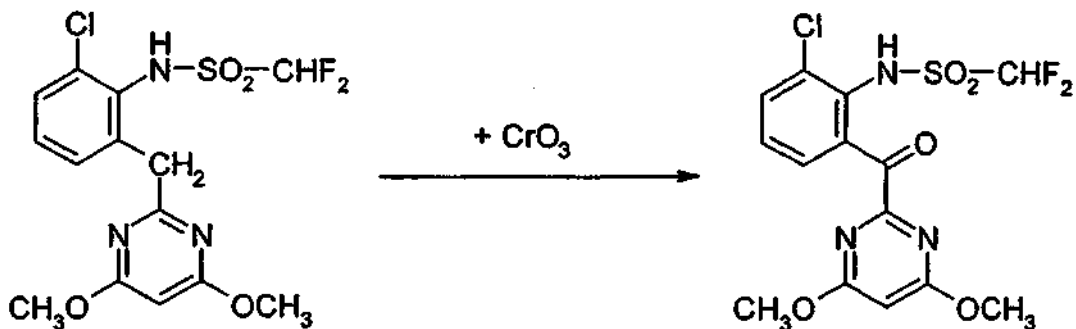
5

El procedimiento de preparación (c) mencionado anteriormente puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reacción en el caso en el que, por ejemplo, 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-metilmetil]-N-difluorometanosulfonilida y, como agente reductor, por ejemplo, borohidruro sódico y cloruro de níquel (II) hexahidrato, se usen como los materiales de partida.

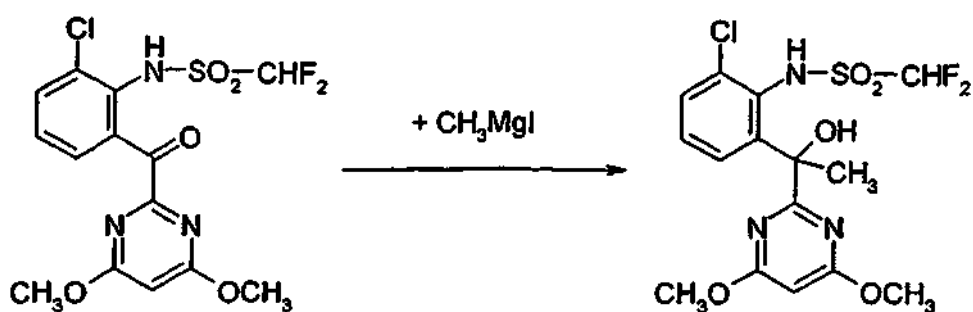


10

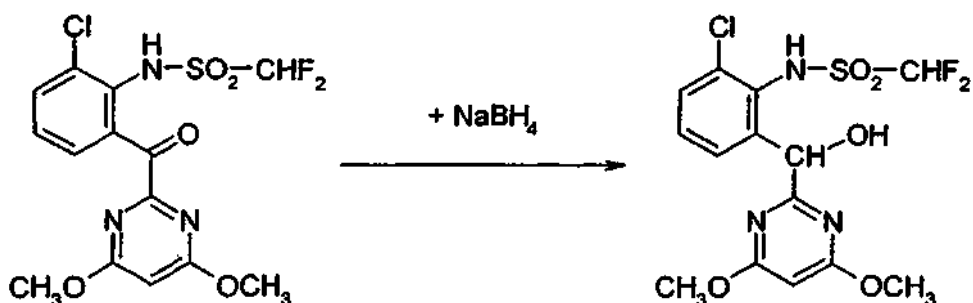
El procedimiento de preparación (d) mencionado anteriormente puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reacción en el caso en el que, por ejemplo, 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]-N-difluorometanosulfonilida y óxido de cromo (VI) se usen como los materiales de partida.



15 El procedimiento de preparación (e) mencionado anteriormente puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reacción en el caso en el que, por ejemplo, 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonyl]anilina y yoduro de metil magnesio se usen como los materiales de partida.

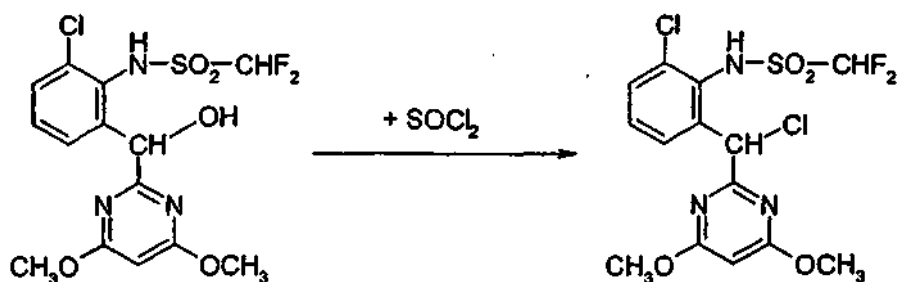


El procedimiento de preparación (f) mencionado anteriormente puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reacción en el caso en el que, por ejemplo, 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]anilina y, como agente reductor, por ejemplo, borohidruro sódico, se usen como los materiales de partida.

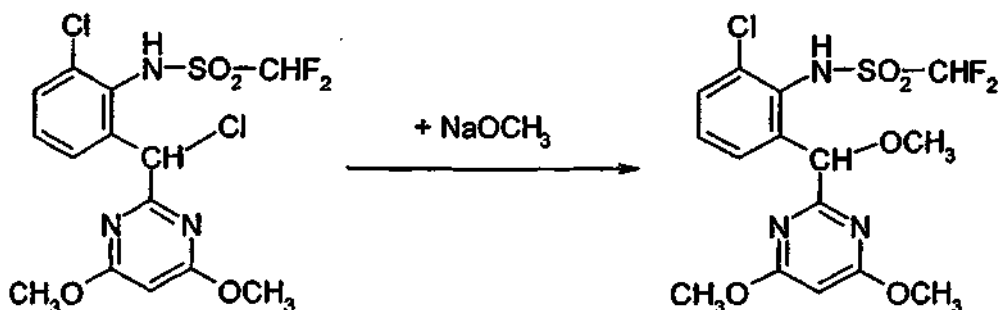


5

El procedimiento de preparación (g) mencionado anteriormente puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reacción en el caso en el que, por ejemplo, 2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)hidroximetil]-N-difluorometanosulfonanilida y cloruro de tionilo se usen como los materiales de partida.



10 El procedimiento de preparación (h) mencionado anteriormente puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de reacción en el caso en el que, por ejemplo, 2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-clorometil]-N-difluorometanosulfonanilida y metóxido sódico se usen como los materiales de partida.



15 Los compuestos de fórmula (II), usados como los materiales de partida en el procedimiento de preparación (a) mencionado anteriormente, que incluyen los compuestos conocidos descritos en la literatura de patente 1-3 mencionadas anteriormente, una parte de los cuales son compuestos novedosos que no se han descrito en la literatura existente, pueden prepararse, por ejemplo, de acuerdo con los procedimientos descritos en cualquier literatura de patente 1-3 mencionadas anteriormente. Como ejemplos específicos de los compuestos de fórmula (II) pueden mencionarse los siguientes:

20 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-metiltiometil]anilina,



2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)etil]anilina;  
 2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)etil]anilina,  
 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetilpirimidin-2-il)etil]anilina,  
 2-cloro-6-[1-(4,6-dimetilpirimidin-2-il)etil]anilina,  
 5 3-fluoro-6-[(4,6-dimetilpirimidin-2-il)metil]anilina,  
 3-cloro-6-[(4,6-dimetilpirimidin-2-il)metil]anilina,  
 2-fluoro-6-[(4-metoxi-6-metilpirimidin-2-il)metil]anilina,  
 2-cloro-6-[(4-metoxi-6-metilpirimidin-2-il)metil]anilina,  
 10 2-fluoro-6-[(4-metoxi-6-trifluorometilpirimidin-2-il)metil]anilina,  
 2-cloro-6-[(4-metoxi-6-trifluorometilpirimidin-2-il)metil]anilina,  
 3-fluoro-6-[(4-metoxi-6-metilpirimidin-2-il)metil]anilina,  
 3-cloro-6-[(4-metoxi-6-metilpirimidin-2-il)metil]anilina,  
 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)metil]anilina,  
 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)metil]anilina,  
 15 2,3-difluoro-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)metil]anilina,  
 2,3-dicloro-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)metil]anilina,  
 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxitriazin-2-il)etil]anilina,  
 2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxitriazin-2-il)etil]anilina,  
 20 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetiltriazin-2-il)etil]anilina,  
 2-cloro-6-[1-(4,6-dimetiltriazin-2-il)etil]anilina,  
 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]anilina,  
 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]anilina,  
 2,3-difluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]anilina,  
 2,3-dicloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]anilina,  
 25 2-fluoro-3-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]anilina,  
 3-fluoro-2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]anilina,  
 2,4-difluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]anilina,  
 2,4-dicloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]anilina,  
 2-fluoro-4-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]anilina,  
 30 4-fluoro-2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]anilina,  
 2,5-difluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]anilina,  
 2,5-dicloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]anilina,  
 2-fluoro-5-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]anilina,  
 5-fluoro-2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]anilina,  
 35 2-fluoro-6-[(4,6-dimetilpirimidin-2-il)carbonil]anilina,  
 2-cloro-6-[(4,6-dimetilpirimidin-2-il)carbonil]anilina,  
 2-fluoro-6-[(4-metoxi-6-metilpirimidin-2-il)carbonil]anilina,  
 2-cloro-6-[(4-metoxi-6-metilpirimidin-2-il)carbonil]anilina,  
 2-fluoro-6-[(4-metoxi-6-trifluorometilpirimidin-2-il)carbonil]anilina,  
 40 2-cloro-6-[(4-metoxi-6-trifluorometilpirimidin-2-il)carbonil]anilina;  
 3-fluoro-6-[(4-metoxi-6-metilpirimidin-2-il)carbonil]anilina,  
 3-cloro-6-[(4-metoxi-6-metilpirimidin-2-il)carbonil]anilina,  
 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)carbonil]anilina,  
 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)carbonil]anilina,  
 45 2-bromo-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)carbonil]anilina,  
 2-yodo-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)carbonil]anilina,  
 2,3-difluoro-6-[(4,6-dimetoxipiridin-2-il)carbonil]anilina,  
 2,3-dicloro-6-[(4,6-dimetoxipiridin-2-il)carbonil]anilina,  
 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-idrossimetil]anilina,  
 50 2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-idrossimetil]anilina,  
 2,3-difluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-idrossimetil]anilina,  
 2,3-dicloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-idrossimetil]anilina,  
 2-fluoro-3-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-idrossimetil]anilina,  
 3-fluoro-2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-idrossimetil]anilina,  
 55 2,4-difluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-idrossimetil]anilina,  
 2,4-dicloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-idrossimetil]anilina,  
 2-fluoro-4-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-idrossimetil]anilina,  
 4-fluoro-2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-idrossimetil]anilina,  
 2,5-difluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-idrossimetil]anilina,  
 60 2,5-dicloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-idrossimetil]anilina,  
 2-fluoro-5-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-idrossimetil]anilina,  
 5-fluoro-2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-idrossimetil]anilina,  
 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-idrossietil]anilina,  
 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-idrossietil]anilina,  
 65 3-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-idrossietil]anilina,  
 2-cloro-6-[(4,6-dimetilpirimidin-2-il)-1-idrossietil]anilina,



- 2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxitriazin-2-il)-1-cloroetil]anilina,  
 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetiltriazin-2-il)-1-cloroetil]anilina,  
 2-cloro-6-[1-(4,6-dimetiltriazin-2-il)-1-cloroetil]anilina,  
 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 5 2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 2,3-difluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 2,3-dicloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 2-fluoro-3-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 3-fluoro-2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 10 2,4-difluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 2,4-dicloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 2-fluoro-4-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 4-fluoro-2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 2,5-difluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 15 2,5-dicloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 2-fluoro-5-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 5-fluoro-2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetilpirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 2-cloro-6-[1-(4,6-dimetilpirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 20 2-fluoro-6-[1-(4-metoxi-6-metilpirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 2-cloro-6-[1-(4-metoxi-6-metilpirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 2-fluoro-6-[1-(4-metoxi-6-trifluorometilpirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 2-cloro-6-[1-(4-metoxi-6-trifluorometilpirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 3-fluoro-6-[1-(4-metoxi-6-metilpirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 25 3-cloro-6-[1-(4-metoxi-6-metilpirimidin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxitriazin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxitriazin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 2,3-difluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipiridin-2-il)-1-fluorometil]anilina,  
 2,3-dicloro-6-[1-(4,6-dimetoxipiridin-2-il)-1-fluorometil]anilina, y así sucesivamente

- 30 El cloruro de difluorometanosulfonilo, que reacciona con los compuestos de la fórmula (II) mencionada anteriormente en el procedimiento de preparación (a) mencionado anteriormente, es una sustancia conocida por sí misma.

- Los compuestos de fórmula (IAb), usados como los materiales de partida en el procedimiento de preparación (b) mencionado anteriormente, corresponden a una parte de los compuestos de fórmula (IA) de la presente invención, que pueden prepararse por el procedimientos de preparación (a), (c), (d), (e), (f), (g) o (h) mencionados anteriormente. Como sus ejemplos específicos pueden mencionarse los siguientes:

- 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-metiltiometil]-N-difluorometanosulfonilida,  
 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-metiltioetil]-N-difluorometanosulfonilida,  
 2-fluoro-3-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-metiltiometil]-N-difluorometano-sulfonilida,  
 2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-metiltiometil]-N-difluorometanosulfonilida,  
 40 2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)etil]-N-difluorometanosulfonilida,  
 2,3-difluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]-N-difluorometanosulfonilida,  
 2-fluoro-5-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]-N-difluorometanosulfonilida,  
 2,4-dicloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]-N-difluorometanosulfonilida,  
 3,5-dicloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]-N-difluorometanosulfonilida,  
 45 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-metil-1-hidroxi-etil]-N-difluorometano-sulfonilida,  
 2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxitriazin-2-il)-1-fluorometil]-N-difluorometanosulfonilida,  
 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-fluorometil]-N-difluorometanosulfonilida,  
 2-[1-(4,6-dimetoxitriazin-2-il)-1-fluorometil]-6-metil-N-difluorometanosulfonilida, y así sucesivamente.

- 50 Los compuestos de fórmula (III), que reaccionan con los compuestos de la fórmula (IAb) mencionada anteriormente en el procedimiento de preparación (b) mencionado anteriormente, son sustancias conocidas por sí mismas y como sus ejemplos específicos pueden mencionarse los siguientes:

yoduro de metilo, yoduro de etilo, 1,1,1-trifluoro-2-yodoetano, clorometil metil éter, clorometil etil éter, bromoacetato

de metilo, bromopropionato de metilo, cloruro de acetilo, cloruro de propionilo, cloruro de ciclopropanocarbonilo, cloruro de 2,2-dicloro-1-etil-3-metil-ciclopropanocarbonilo, cloroformiato de metilo, cloroformiato de etilo, cloroformiato de propilo, cloroformiato de isopropilo, etc., cloruro de metanosulfonilo, cloruro de clorometanosulfonilo, cloruro de difluorometanosulfonilo, cloruro de trifluorometanosulfonilo, cloruro de 2,2,2-trifluoroetanosulfonilo, cloruro de cianometilsulfonilo, cloruro de N,N-dimetilsulfamoilo, 2,2-difluoro-2-(fluorosulfonil)acetato de metilo, etc.; anhídrido acético, anhídrido trifluoroacético, anhídrido metanosulfónico, anhídrido trifluorometanosulfónico, etc.; ácido acético, ácido ciclohexanocarboxílico, ácido 2,2-dicloro-1-metilciclopropano-carboxílico, etc.; metanol, etanol, 2,2,2-trifluoroetanol, y así sucesivamente.

Los compuestos de fórmula (IAc), usados como los materiales de partida en el procedimiento de preparación (c) mencionado anteriormente, corresponden a una parte de los compuestos de fórmula (IA) de la presente invención, que puede prepararse por los procedimientos de preparación (a) o (b) mencionados anteriormente y como sus ejemplos específicos pueden mencionarse los siguientes:

2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-metiltioetil]-N-difluoro-metanosulfonanilida,

2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-metiltioetil]-N-difluoro-metanosulfonanilida,

2-fluoro-3-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-metiltioetil]-N-difluoro-metanosulfonanilida,

2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-metiltioetil]-N-difluoro-metanosulfonanilida,

2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-metiltioetil]-N-metil-N-difluoro-metanosulfonanilida,

2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-metiltioetil]-N-acetil-N-difluoro-metanosulfonanilida,

2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-metiltioetil]-N-trifluoroacetil-N-difluoro-metanosulfonanilida,

2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-metiltioetil]-N-metilmetoxi-N-difluoro-metanosulfonanilida,

2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxitriazin-2-il)-1-metiltioetil]-N-metil-N-difluorometanosulfonanilida,

2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxitriazin-2-il)-1-metiltioetil]-N-acetil-N-difluorometano-sulfonanilida, y así sucesivamente

Como el agente reductor usado para sustituir a  $-SR^8$  en los compuestos de la fórmula (IAc) mencionada anteriormente en el procedimiento de preparación (c) mencionado anteriormente con hidrógeno pueden mencionarse, por ejemplo, una combinación de borohidruro sódico y cloruro de níquel (II), o níquel Raney, etc.

Los compuestos de fórmula (IAd), usados como los materiales de partida en el procedimiento de preparación (d) mencionado anteriormente, corresponden a una parte de los compuestos de fórmula (IA) de la presente invención, que puede prepararse por los procedimientos de preparación (a), (b) o (c) mencionados anteriormente y como sus ejemplos específicos pueden mencionarse los siguientes:

2,3-difluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]-N-difluorometanosulfonanilida,

2-fluoro-5-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]-N-difluorometanosulfonanilida,

2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]-N-metil-N-difluorometanosulfonanilida,

2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]-N-acetil-N-difluorometanosulfonanilida,

2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]-N-trifluoroacetil-N-difluorometanosulfonanilida,

2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]-N-metilmetoxi-N-difluorometanosulfonanilida,

2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)metil]-N-metil-N-difluorometanosulfonanilida,

2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)metil]-N-acetil-N-difluorometanosulfonanilida, y así sucesivamente.

Como el agente oxidante usado para convertir el metileno ( $-CH_2-$ ) en los compuestos de la fórmula (IAd) mencionada anteriormente en el procedimiento de preparación (d) mencionado anteriormente en carbonilo ( $=CO$ ) por oxidación pueden mencionarse, por ejemplo, óxido de cromo (VI), dióxido de manganeso, dióxido de selenio, etc.

Los compuestos de fórmula (IAe), usados como los materiales de partida en el procedimiento de preparación (e) mencionado anteriormente o el procedimiento de preparación (f) mencionado anteriormente, corresponden a una parte de los compuestos de fórmula (IA) de la presente invención, que puede prepararse por los procedimientos de preparación (a), (b) o (d) mencionados anteriormente y como sus ejemplos específicos pueden mencionarse los siguientes:

2,4-dicloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]-N-difluorometanosulfonanilida,



- 3,5-dicloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]-N-difluorometanosulfonilida,  
 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]-N-metil-N-difluorometanosulfonilida,  
 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]-N-acetil-N-difluorometanosulfonilida,  
 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]-N-trifluoroacetil-N-difluorometanosulfonilida,  
 5 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]-N-metilmetoxi-N-difluorometano-sulfonilida,  
 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)carbonil]-N-metil-N-difluorometanosulfonilida,  
 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)carbonil]-N-acetil-N-difluorometanosulfonilida, y así sucesivamente.

Los compuestos de fórmula (IV), que reaccionan con los compuestos de la fórmula (IAe) mencionada anteriormente en el procedimiento de preparación (e) mencionado anteriormente, son sustancias conocidas por sí mismas y, por ejemplo, como sus ejemplos específicos pueden mencionarse los siguientes:

bromuro de metil magnesio, bromuro de etil magnesio, cloruro de vinil magnesio, bromuro de alil magnesio, etc.

como el compuesto de complejo de hidruro de metal alcalino o complejo de borano usado para la reducción de carbonilo (=CO) en los compuestos de la fórmula (IAe) mencionada anteriormente en el procedimiento de preparación (f) mencionado anteriormente pueden mencionarse, por ejemplo, borohidruro sódico, hidruro de litio y aluminio, dimetil sulfuro borano, piridina-borano, etc. Los compuestos de fórmula (IAg), usados como los materiales de partida en el procedimiento de preparación (g) mencionado anteriormente, corresponden a una parte de los compuestos de fórmula (IA) de la presente invención, que puede prepararse por los procedimientos de preparación (a), (b), (f) o (e) mencionados anteriormente y como sus ejemplos específicos pueden mencionarse los siguientes:

- 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-hidroxietil]-N-difluorometanosulfonilida,  
 20 2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-hidroximetil]-N-metil-N-difluorometanosulfonilida,  
 2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-hidroximetil]-N-acetil-N-difluorometanosulfonilida,  
 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-hidroximetil] N-trifluoroacetil-N-difluorometanosulfonilida,  
 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-hidroximetil]-N-metilmetoxi-N-difluoro-metanosulfonilida,  
 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxitriazin-2-il)-1-hidroximetil]-N-metil-N-difluorometanosulfonilida,  
 25 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxitriazin-2-il)-1-hidroximetil]-N-acetil-N-difluorometanosulfonilida, y así sucesivamente.

Como el agente de halogenación usado para la halogenación de los compuestos de la fórmula (IAg) mencionada anteriormente en el procedimiento de preparación (g) mencionado anteriormente pueden mencionarse, por ejemplo, trifluoruro de dietilamina azufre, oxiclорuro de fósforo, cloruro de tionilo, etc.

Los compuestos de fórmula (IAh), usados como los materiales de partida en el procedimiento de preparación (h) mencionado anteriormente, corresponden a una parte de los compuestos de fórmula (IA) de la presente invención, que puede prepararse por el procedimiento de preparación (g) mencionado anteriormente y como sus ejemplos específicos pueden mencionarse los siguientes:

- 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-clorometil]-N-difluorometanosulfonilida,  
 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-cloroetil]-N-difluorometanosulfonilida,  
 35 2-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-clorometil]-6-metil-N-difluorometanosulfonilida,  
 2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-clorometil]-N-metil-N-difluorometano-sulfonilida,  
 2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-clorometil]-N-acetil-N-difluorometano-sulfonilida,  
 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-clorometil]-N-trifluoroacetil-N-difluoro-metanosulfonilida,  
 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-1-clorometil]-N-metilmetoxi-N-difluoro-metanosulfonilida,  
 40 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxitriazin-2-il)-1-clorometil]-N-metil-N-difluorometano-sulfonilida,  
 2-fluoro-6-[1-(4,6-dimetoxitriazin-2-il)-1-clorometil]-N-acetil-N-difluorometano-sulfonilida, y así sucesivamente.

Los compuestos de fórmula (V), que reaccionan con los compuestos de la fórmula (IAh) mencionada anteriormente en el procedimiento de preparación (h) mencionado anteriormente, son sustancias conocidas por sí mismas y como

sus ejemplos específicos pueden mencionarse los siguientes:

metóxido sódico, etóxido sódico, tiometóxido sódico, tioetóxido sódico, tiopropanol sódico, y así sucesivamente.

La reacción del procedimiento de preparación (a) mencionado anteriormente puede realizarse en un diluyente apropiado. Como ejemplos del diluyente usado en este caso pueden mencionarse hidrocarburos alifáticos, alicíclicos y aromáticos (pueden estar opcionalmente clorados), por ejemplo, pentano, hexano, ciclohexano, éter de petróleo, ligroína, benceno, tolueno, xileno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, diclorobenceno, etc.; éteres, por ejemplo, éter etílico, metil etil éter, éter isopropílico, éter butílico, dioxano, dimetoxietano (DME), tetrahidrofurano (THF), dimetil éter de dietilenglicol (DGM), etc.; cetonas, por ejemplo, acetona, metil etil cetona (MEK), metil-isopropil cetona, metil isobutil cetona (MIBK), etc.; nitrilos, por ejemplo, acetonitrilo, propionitrilo, etc.; ésteres, por ejemplo, acetato de etilo, acetato de amilo, etc.; bases, por ejemplo, piridina, etc.

El procedimiento de preparación (a) puede realizarse en presencia de un aglutinante ácido, y como dicho aglutinante ácido pueden mencionarse como bases inorgánicas, hidruros, hidróxidos, carbonatos, bicarbonatos, etc. de metales alcalinos o metales alcalinotérreos, por ejemplo, hidruro sódico, hidruro de litio, hidrogenocarbonato sódico, hidrogenocarbonato potásico, carbonato sódico, carbonato potásico, hidróxido de litio, hidróxido sódico, hidróxido potásico, hidróxido de calcio, etc.; amidas inorgánicas de metal alcalino, por ejemplo, amida de litio, amida sódica, amida potásica, etc.; como bases orgánicas, aminas terciarias, dialquilaminoanilinas y piridinas, por ejemplo, trietilamina, 1,1,4,4-tetrametiletilendiamina (TMEDA), N,N-dimetilanilina, N,N-dietilanilina, piridina, 4-dimetilaminopiridina (DMAP), 1,4-diazabicyclo[2,2,2] octano (DABCO) y 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno (DBU), etc.

El procedimiento de preparación (a) puede realizarse en un intervalo de temperatura sustancialmente amplio. Sin embargo, es preferible realizarlo a temperaturas en el intervalo de generalmente de aproximadamente -100 a aproximadamente 60 °C, particularmente de aproximadamente -80 a aproximadamente 40 °C. Aunque dicha reacción se realiza deseablemente a presión normal, puede realizarse opcionalmente a presión elevada o a presión reducida.

Al realizar el procedimiento de preparación (a), puede obtenerse el compuesto pretendido, por ejemplo, haciendo reaccionar de 1 a 5 moles de cloruro de difluorometanosulfonilo con 1 mol del compuesto de fórmula (II) en un diluyente, por ejemplo, diclorometano en presencia de 1 a 5 moles de piridina.

La reacción del procedimiento de preparación (b) mencionado anteriormente puede realizarse en un diluyente apropiado. Como ejemplos del diluyente usado en este caso pueden mencionarse hidrocarburos alifáticos, alicíclicos y aromáticos (pueden estar opcionalmente clorados), por ejemplo, hexano, ciclohexano, ligroína, tolueno, xileno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, etc.; éteres, por ejemplo, éter etílico, metil etil éter, iso-propil éter, éter butílico, dioxano, dimetoxietano (DME), tetrahidrofurano (THF), dimetil éter de dietilenglicol (DGM), etc.; cetonas, por ejemplo, acetona, metil etil cetona (MEK), metil-isopropil cetona, metil isobutil cetona (MIBK), etc.; nitrilos, por ejemplo, acetonitrilo, propionitrilo, acrilonitrilo, etc.; ésteres, por ejemplo, acetato de etilo, acetato de amilo, etc.; amidas ácidas, por ejemplo, dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DMA), N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, triamida hexametilfosfórica (HMPA), etc.; sulfonas, sulfóxidos, por ejemplo, dimetilsulfóxido (DMSO), sulfolano, etc.; bases, por ejemplo, piridina, etc.

El procedimiento de preparación (b) puede realizarse en presencia de un aglutinante ácido, y como dicho aglutinante ácido pueden mencionarse como bases inorgánicas, hidruros, hidróxidos, carbonatos, bicarbonatos, etc. de metales alcalinos o metales alcalinotérreos, por ejemplo, hidruro sódico, hidruro de litio, hidrogenocarbonato sódico, hidrogenocarbonato potásico, carbonato sódico, carbonato potásico, hidróxido de litio, hidróxido sódico, hidróxido potásico, hidróxido de calcio, etc.; amidas inorgánicas de metal alcalino, por ejemplo, amida de litio, amida sódica, amida potásica, etc.; como bases orgánicas, alcoholatos, aminas terciarias, dialquilaminoanilinas y piridinas, por ejemplo, trietilamina, 1,1,4,4-tetrametiletilendiamina (TMEDA), N,N-dimetilanilina, N,N-dietilanilina, piridina, 4-dimetilaminopiridina (DMAP), 1,4-diazabicyclo[2,2,2]octano (DABCO) y 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno (DBU), etc.; compuestos orgánicos de litio, por ejemplo, metil litio, n-butillitio, sec-butillitio, terc-butillitio, fenilo litio, dimetil cobre litio, diisopropil amiduro de litio, ciclohexilo isopropil amiduro de litio, dicitlohexil amiduro de litio, n-butillitio · DABCO, n-butillitio · DBU, n-butillitio · TMEDA, etc.

El procedimiento de preparación (b) puede realizarse en un intervalo de temperatura sustancialmente amplio. Sin embargo, es preferible realizarlo a temperaturas en el intervalo de generalmente de aproximadamente -100 a aproximadamente 130 °C, particularmente de aproximadamente -80 a aproximadamente 130 °C. Aunque dicha reacción se realiza deseablemente a presión normal, puede realizarse opcionalmente a presión elevada o a presión reducida.

Al realizar el procedimiento de preparación (b), puede obtenerse el compuesto pretendido, por ejemplo, haciendo reaccionar de 1 a 5 moles del compuesto de fórmula (III) con 1 mol del compuesto de fórmula (IAb) en un diluyente, por ejemplo, acetonitrilo, en presencia de 2 a 5 moles de carbonato potásico.

En el caso en el que R<sup>6A</sup> representa acilo o un grupo SO<sub>2</sub>R<sup>5A</sup> en la fórmula (III), pueden usarse anhídridos de ácido

derivados de los compuestos de la fórmula (III) correspondiente, y en el caso en el que R<sup>6A</sup> representa acilo, pueden usarse ácidos carboxílicos derivados de los compuestos de la fórmula (III) correspondiente en presencia de un agente de condensación, por ejemplo, 1,1-carbonildiimidazol (CDI), 1,3-diciclohexilcarbodiimida, (DCC), clorhidrato de 1-(3-dimetildiaminopropil)-3-etilcarbodiimida (WSC), hexafluorofosfato de benzotriazol-1-iloxitris(dimetilamino)fosfonio (BOP), etc., y adicionalmente, en el caso en el que R<sup>6A</sup> representa alcoxicarbonilo, pueden usarse el alcohol correspondiente y un agente de condensación, por ejemplo, 1,1-carbonildiimidazol (CDI), para obtener cada compuesto objetivo.

La reacción del procedimiento de preparación (c) mencionado anteriormente puede realizarse en un diluyente apropiado. Como ejemplos del diluyente usado en este caso pueden mencionarse hidrocarburos alifáticos, alicíclicos y aromáticos (pueden estar opcionalmente clorados), por ejemplo, hexano, ciclohexano, ligroína, tolueno, xileno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, etc.; éteres, por ejemplo, éter etílico, metil etil éter, iso-propil éter, éter butílico, dioxano, dimetoxietano (DME), tetrahidrofurano (THF), dimetil éter de dietilenglicol (DGM), etc.; alcoholes, por ejemplo, metanol, etanol, isopropanol, butanol, etilenglicol, etc.; ácidos, por ejemplo, ácido acético, etc.

El procedimiento de preparación (c) puede realizarse en un intervalo de temperatura sustancialmente amplio. Sin embargo, es preferible realizarlo a temperaturas en el intervalo de generalmente de aproximadamente -100 a aproximadamente 80 °C, particularmente de aproximadamente -80 a aproximadamente 80 °C. Aunque dicha reacción se realiza deseablemente a presión normal, puede realizarse opcionalmente a presión elevada o a presión reducida. Al realizar el procedimiento de preparación (c), puede obtenerse el compuesto pretendido, por ejemplo, haciendo reaccionar de 1 a 8 moles de borohidruro sódico con 1 mol del compuesto de la fórmula (IAc) en un diluyente, por ejemplo, metanol, en presencia de 1 a 8 moles de cloruro de níquel (II) hexahidrato.

La reacción del procedimiento de preparación (d) mencionado anteriormente puede realizarse en un diluyente apropiado. Como ejemplos del diluyente usado en este caso pueden mencionarse agua; hidrocarburos alifáticos, alicíclicos y aromáticos (pueden estar opcionalmente clorados), por ejemplo, hexano, ciclohexano, ligroína, tolueno, xileno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, etc.; éteres, por ejemplo, éter etílico, metil etil éter, éter isopropílico, éter butílico, dioxano, dimetoxietano (DME), tetrahidrofurano (THF), dimetil éter de dietilenglicol (DGM), etc.; cetonas, por ejemplo, acetona, metil etil cetona (MEK), metil-isopropil cetona, metil isobutil cetona (MIBK), etc.; nitrilos, por ejemplo, acetonitrilo, propionitrilo, acrilonitrilo, etc.; ésteres, por ejemplo, acetato de etilo, acetato de amilo, etc.; amidas ácidas, por ejemplo, dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DMA), N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, triamida hexametilfosfórica (HMPA), etc.; sulfonas, sulfoxidos, por ejemplo, dimetilsulfoxido (DMSO), sulfolano, etc.; bases, por ejemplo, piridina etc.

El procedimiento de preparación (d) puede realizarse en presencia de un catalizador ácido y como ejemplos de dicho catalizador ácido pueden mencionarse ácidos minerales, por ejemplo, ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, ácido nítrico, ácido bromhídrico, hidrogenosulfito sódico, etc.; ácidos orgánicos, por ejemplo, ácido fórmico, ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido propiónico, ácido metanosulfónico, ácido bencenosulfónico, ácido p-toluenosulfónico, etc.

El procedimiento de preparación (d) puede realizarse en un intervalo de temperatura sustancialmente amplio. Sin embargo, es preferible realizarlo a temperaturas en el intervalo de generalmente de aproximadamente -100 a aproximadamente 150 °C, particularmente de aproximadamente 20 a aproximadamente 120 °C. Aunque dicha reacción se realiza deseablemente a presión normal, puede realizarse opcionalmente a presión elevada o a presión reducida.

Al realizar el procedimiento de preparación (d), puede obtenerse el compuesto pretendido, por ejemplo, haciendo reaccionar de 1 a 10 moles de óxido de cromo (VI) con 1 mol del compuesto de la fórmula (IAd) en un diluyente, por ejemplo, ácido acético.

La reacción del procedimiento de preparación (e) mencionado anteriormente puede realizarse en un diluyente apropiado. Como ejemplos del diluyente usado en este caso pueden mencionarse éteres, por ejemplo, éter etílico, metil etil éter, éter isopropílico, éter butílico, dioxano, dimetoxietano (DME), tetrahidrofurano (THF), dimetil éter de dietilenglicol (DGM), etc.;

El procedimiento de preparación (e) puede realizarse en un intervalo de temperatura sustancialmente amplio. Sin embargo, es preferible realizarlo a temperaturas en el intervalo de generalmente de aproximadamente -100 a aproximadamente 60 °C, particularmente de aproximadamente -80 a aproximadamente 30 °C. Aunque dicha reacción se realiza deseablemente a presión normal, puede realizarse opcionalmente a presión elevada o a presión reducida.

Al realizar el procedimiento de preparación (e), puede obtenerse el compuesto pretendido, por ejemplo, haciendo reaccionar de 1 a 4 moles del compuesto de la fórmula (IV) con 1 mol de un compuesto de la fórmula (IAe) en un diluyente, por ejemplo, tetrahidrofurano.

La reacción del procedimiento de preparación (f) mencionado anteriormente puede realizarse en un diluyente apropiado. Como ejemplos del diluyente usado en este caso pueden mencionarse agua; hidrocarburos alifáticos,

alicíclicos y aromáticos (puede estar opcionalmente clorado), por ejemplo, pentano, hexano, ciclohexano, éter de petróleo, ligroína, benceno, tolueno, xileno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, diclorobenceno, etc.; éteres, por ejemplo, éter etílico, metil etil éter, éter isopropílico, éter butílico, dioxano, dimetoxietano (DME), tetrahidrofurano (THF), dimetil éter de dietilenglicol (DGM), etc.; nitrilos, por ejemplo, acetónitrilo, propionitrilo, etc.; alcoholes, por ejemplo, metanol, etanol, isopropanol, butanol, etilenglicol, etc.; ésteres, por ejemplo, acetato de etilo, acetato de amilo, etc.; acidamidas, por ejemplo, dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DMA), N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, triamida hexametilfosfórica (HMPA), etc.; sulfonas, sulfóxidos, por ejemplo, dimetilsulfóxido (DMSO), sulfolano, etc.; bases, por ejemplo, piridina etc.

El procedimiento de preparación (f) puede realizarse en un intervalo de temperatura sustancialmente amplio. Sin embargo, es preferible realizarlo a temperaturas en el intervalo de generalmente de aproximadamente -100 a aproximadamente 60 °C, particularmente de aproximadamente -80 a aproximadamente 40 °C. Aunque dicha reacción se realiza deseablemente a presión normal, puede realizarse opcionalmente a presión elevada o a presión reducida.

Al realizar el procedimiento de preparación (f), puede obtenerse el compuesto pretendido, por ejemplo, haciendo reaccionar de 0,25 a 2 moles de borohidruro sódico con 1 mol del compuesto de la fórmula (IAe) en un diluyente, por ejemplo, metanol.

La reacción del procedimiento de preparación (g) mencionado anteriormente puede realizarse en un diluyente apropiado. Como ejemplos del diluyente usado en este caso pueden mencionarse hidrocarburos alifáticos, alicíclicos y aromáticos (pueden estar opcionalmente clorados), por ejemplo, hexano, ciclohexano, ligroína, tolueno, xileno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, etc.; éteres, por ejemplo, éter etílico, metil etil éter, iso-propil éter, éter butílico, dioxano, dimetoxietano (DME), tetrahidrofurano (THF), dimetil éter de dietilenglicol (DGM), etc. en el caso en el que se usa un agente de fluoración, por ejemplo, el trifluoruro de dietilamina azufre mencionado anteriormente etc. como un agente de halogenación, y pueden mencionarse hidrocarburos alifáticos, alicíclicos y aromáticos (pueden estar opcionalmente clorados), por ejemplo, hexano, ciclohexano, ligroína, benceno, tolueno, xileno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, etc.; éteres, por ejemplo, éter etílico, metil etil éter, éter isopropílico, éter butílico, dioxano, dimetoxietano (DME), tetrahidrofurano (THF), dimetil éter de dietilenglicol (DGM), etc.; amidas ácidas, por ejemplo, dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DMA), N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, triamida hexametilfosfórica (HMPA), etc. en el caso en el que se usa un agente de cloración, por ejemplo, el oxiclورو de fósforo, cloruro de tionilo mencionados anteriormente, etc. como un agente de halogenación.

El procedimiento de preparación (g) puede realizarse en un intervalo de temperatura sustancialmente amplio. Se prefiere realizarlo a temperaturas, por ejemplo, en el intervalo de generalmente de aproximadamente -100 a aproximadamente 30 °C, particularmente de aproximadamente -80 a aproximadamente 30 °C en el caso en el que los agentes de fluoración mencionados anteriormente se usan como el agente de halogenación. Aunque dicha reacción se realiza deseablemente a presión normal, puede realizarse opcionalmente a presión elevada o a presión reducida.

En el caso en el que los agentes de cloración mencionados anteriormente se usan como el agente de halogenación, es preferible realizarla a temperaturas en el intervalo de generalmente de aproximadamente -100 a aproximadamente 130 °C, particularmente de aproximadamente -80 a aproximadamente 130 °C. Aunque dicha reacción se realiza deseablemente a presión normal, puede realizarse opcionalmente a presión elevada o a presión reducida.

Al realizar el procedimiento de preparación (g), puede obtenerse el compuesto pretendido, por ejemplo, haciendo reaccionar de 1 a 5 moles de trifluoruro de dietilamina azufre con 1 mol del compuesto de la fórmula (IAg) en un diluyente, por ejemplo, diclorometano.

Además, al realizar el procedimiento de preparación (g), puede obtenerse el compuesto pretendido, por ejemplo, haciendo reaccionar 1 mol con una cantidad tal como si se usara él mismo como disolvente de cloruro de tionilo con 1 mol del compuesto de la fórmula (IAg) en un diluyente, por ejemplo, diclorometano.

La reacción del procedimiento de preparación (h) mencionado anteriormente puede realizarse en un diluyente apropiado. Como ejemplos del diluyente usado en este caso pueden mencionarse agua; hidrocarburos alifáticos, alicíclicos y aromáticos (pueden estar opcionalmente clorados), por ejemplo, hexano, ciclohexano, ligroína, tolueno, xileno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, etc.; éteres, por ejemplo, éter etílico, metil etil éter, éter isopropílico, éter butílico, dioxano, dimetoxietano (DME), tetrahidrofurano (THF), dimetil éter de dietilenglicol (DGM), etc.; nitrilos, por ejemplo, acetónitrilo, propionitrilo, acrilonitrilo, etc.; ésteres, por ejemplo, acetato de etilo, acetato de amilo, etc.; amidas ácidas, por ejemplo, dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DMA), N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, triamida hexametilfosfórica (HMPA), etc.; sulfonas, sulfóxidos, por ejemplo, dimetilsulfóxido (DMSO), sulfolano, etc.; bases, por ejemplo, piridina etc.

El procedimiento de preparación (h) puede realizarse en presencia de un aglutinante ácido, y como dicho aglutinante ácido pueden mencionarse como bases inorgánicas, hidruros, hidróxidos, carbonatos, bicarbonatos, etc. de metales

- alcalinos o metales alcalinotérreos, por ejemplo, hidruro sódico, hidruro de litio, hidrogenocarbonato sódico, hidrogenocarbonato potásico, carbonato sódico, carbonato potásico, hidróxido de litio, hidróxido sódico, hidróxido potásico, hidróxido de calcio, etc.; amidas inorgánicas de metal alcalino, por ejemplo, amida de litio, amida sódica, amida potásica, etc.; como bases orgánicas, aminas terciarias, dialquilaminoanilinas y piridinas, por ejemplo, trietilamina, 1,1,4,4-tetrametiletilendiamina (TMEDA), N,N-dimetilanilina, N,N-dietilanilina, piridina, 4-dimetilaminopiridina (DMAP), 1,4-diazabicyclo[2,2,2] octano (DABCO) y 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno (DBU), etc.; compuestos orgánicos de litio, por ejemplo, metil litio, n-butillitio, sec-butillitio, terc-butillitio, fenilo litio, dimetil cobre litio, diisopropil amiduro de litio, ciclohexilo isopropil amiduro de litio, dicitclohexil amiduro de litio, n-butillitio · DABCO, n-butillitio · DBU, n-butillitio · TMEDA, etc.
- 5
- 10 El procedimiento de preparación (h) puede realizarse en un intervalo de temperatura sustancialmente amplio. Sin embargo, es preferible realizarlo a temperaturas en el intervalo de generalmente de aproximadamente -100 a aproximadamente 130 °C, preferentemente de aproximadamente -80 a aproximadamente 130 °C. Aunque dicha reacción se realiza deseablemente a presión normal, puede realizarse opcionalmente a presión elevada o a presión reducida.
- 15 Al realizar el procedimiento de preparación (h), puede obtenerse el compuesto pretendido, por ejemplo, haciendo reaccionar de 1 a 3 moles del compuesto de la fórmula (V) con 1 mol de un compuesto de fórmula (IAh) en un diluyente, por ejemplo, N,N-dimetilformamida.
- Los compuestos del componente activo de fórmula (I), de acuerdo con la presente invención, muestran una fuerte acción germicida y, de hecho, pueden usarse para controlar patógenos de plantas indeseables.
- 20 Los compuestos del componente activo de fórmula (I), de acuerdo con la presente invención, pueden usarse en general como agentes germicidas contra diversas enfermedades de las plantas por Plasmodioforomicetos, Oomicetos, Zigomicetos, Ascomicetos, Basidiomicetos o Deuteromicetos, y muestran un excelente efecto de control particularmente contra patógenos de plantas tales como *Piricularia oryzae*, *Botrytis cinerea*, etc.
- Se mencionan como ejemplo algunos patógenos que causan enfermedades fúngicas que se pueden clasificar con los nombres genéricos indicados anteriormente, pero no a modo de limitación:
- 25
- Enfermedades por añublo en polvo tales como  
 Enfermedades por *Blumeria* provocadas, por ejemplo, por *Blumeria graminis*  
 Enfermedades por *Podosphaera* provocadas, por ejemplo, por *Podosphaera leucotricha*  
 Enfermedades por *Sphaerotheca* provocadas, por ejemplo, por *Sphaerotheca fuliginea*  
 30 Enfermedades por *Uncinula* provocadas, por ejemplo, por *Uncinula necator*
- Enfermedades por roya tales como  
 Enfermedades por *Gymnosporangium* provocadas, por ejemplo, por *Gymnosporangium sabiniae*  
 Enfermedades por *Hemileia* provocadas, por ejemplo, por *Hemileia vastatrix*  
 Enfermedades por *Phakopsora* provocadas, por ejemplo, por *Phakopsora pachyrhizi*  
 35 Enfermedades por *Puccinia* provocadas, por ejemplo, por *Puccinia recondita*;  
 Enfermedades por *Uromyces* provocadas, por ejemplo, por *Uromyces appendiculatus*;
- Enfermedades por oomicetos tales como  
 Enfermedades por *Bremia* provocadas, por ejemplo, por *Bremia lactucae*  
 Enfermedades por *Peronospora* provocadas, por ejemplo, por *Peronospora brassicae*  
 40 Enfermedades por *Phytophthora* provocadas, por ejemplo, por *Phytophthora infestans*  
 Enfermedades por *Plasmopara* provocadas, por ejemplo, por *Plasmopara viticola*  
 Enfermedades por *Pseudoperonospora* provocadas, por ejemplo, por *Pseudoperonospora cubensis*  
 Enfermedades por *Pythium* provocadas, por ejemplo, por *Pythium ultimum*
- Enfermedades tipo manchas en las hojas, ronchas en las hojas y roya en las hojas tales como  
 45 Enfermedades por *Alternaria* provocadas, por ejemplo, por *Alternaria solani*  
 Enfermedades por *Cercospora* provocadas, por ejemplo, por *Cercospora beticola*  
 Enfermedades por *Cladosporium* provocadas, por ejemplo, por *Cladosporium cuculnerinum*  
 Enfermedades por *Cochliobolus* provocadas, por ejemplo, por *Cochliobolus sativus*  
 Enfermedades por *Colletotrichum* provocadas, por ejemplo, por *Colletotrichum lindemutianum*  
 50 Enfermedades por *Cicloconium* provocadas, por ejemplo, por *Cicloconium oleaginum*  
 Enfermedades por *Diaporthe* provocadas, por ejemplo, por *Diaporthe citri*  
 Enfermedades por *Elsinoe* provocadas, por ejemplo, por *Elsinoe fawcettii*  
 Enfermedades por *Gloeosporium* provocadas, por ejemplo, por *Gloeosporium laeticolor*  
 Enfermedades por *Glomerella* provocadas, por ejemplo, por *Glomerella cingulata*  
 55 Enfermedades por *Guignardia* provocadas, por ejemplo, por *Guignardia bidwellii*  
 Enfermedades por *Leptosphaeria* provocadas, por ejemplo, por *Leptosphaeria maculans*  
 Enfermedades por *Magnaporthe* provocadas, por ejemplo, por *Magnaporthe grisea*  
 Enfermedades por *Mycosphaerella* provocadas, por ejemplo, por *Mycosphaerella graminicola*

- Enfermedades por *Phaeosphaeria* provocadas, por ejemplo, por *Phaeosphaeria nodorum*  
 Enfermedades por *Pirenofora* provocadas, por ejemplo, por *Pirenofora teres*  
 Enfermedades por *Ramularia* provocadas, por ejemplo, por *Ramularia colloocygni*  
 Enfermedades por *Rhynchosporium* provocadas, por ejemplo, por *Rhynchosporium secalis*  
 5 Enfermedades por *Septoria* provocadas, por ejemplo, por *Septoria apii*;  
 Enfermedades por *Typhula* provocadas, por ejemplo, por *Typhula incarnata*  
 Enfermedades por *Venturia* provocadas, por ejemplo, por *Venturia inaequalis*
- Enfermedades de la raíz y el tallo tales como  
 Enfermedades por *Corticium* provocadas, por ejemplo, por *Corticium graminarum*  
 10 Enfermedades por *Fusarium* provocadas, por ejemplo, por *Fusarium oxisporum*  
 Enfermedades por *Gaeumannomyces* provocadas, por ejemplo, por *Gaeumannomyces graminis*  
 Enfermedades por *Rhizoctonia* provocadas, por ejemplo, por *Rhizoctonia solani*  
 Enfermedades por *Tapesia* provocadas, por ejemplo, por *Tapesia acuformis*  
 Enfermedades por *Thielaviopsis* provocadas, por ejemplo, por *Thielaviopsis basicola*
- 15 Enfermedades de la mazorca y la panícula tales como  
 Enfermedades por *Alternaria* provocadas, por ejemplo, por *Alternaria spp.*  
 Enfermedades por *Aspergillus* provocadas, por ejemplo, por *Aspergillus flavus*  
 Enfermedades por provocadas, por ejemplo, por *Cladiosporium spp.*  
 Enfermedades por *Claviceps* provocadas, por ejemplo, por *Claviceps purpurea*  
 20 Enfermedades por *Fusarium* provocadas, por ejemplo, por *Fusarium culmorum*  
*Gibberella* enfermedades provocadas, por ejemplo, por *Gibberella zeae*  
 Enfermedades por *Monographella* provocadas, por ejemplo, por *Monographella nivalis*
- Enfermedades por tizón y añublo tales como  
 Enfermedades por *Sphacelotheca* provocadas, por ejemplo, por *Sphacelotheca reiliana*  
 25 Enfermedades por *Tilletia* provocadas, por ejemplo, por *Tilletia caries*  
 Enfermedades por *Urocistis* provocadas, por ejemplo, por *Urocistis occulta*  
 Enfermedades por *Ustilago* provocadas, por ejemplo, por *Ustilago nuda*;
- Enfermedades por podredumbre y moho de los frutos tales como  
 Enfermedades por *Aspergillus* provocadas, por ejemplo, por *Aspergillus flavus*  
 30 Enfermedades por *Botrytis* provocadas, por ejemplo, por *Botrytis cinerea*  
 Enfermedades por *Penicillium* provocadas, por ejemplo, por *Penicillium expansum*  
 Enfermedades por *Sclerotinia* provocadas, por ejemplo, por *Sclerotinia sclerotiorum*;  
 Enfermedades por *Verticillium* provocadas, por ejemplo, por *Verticillium alboatrum*
- Enfermedades de la semillas, putrefacción transmitida por el suelo, moho, marchitado, podredumbre y  
 35 descomposición de las plántulas  
 Enfermedades por *Fusarium* provocadas, por ejemplo, por *Fusarium culmorum*  
 Enfermedades por *Phytophthora* provocadas, por ejemplo, por *Phytophthora cactorum*  
 Enfermedades por *Pythium* provocadas, por ejemplo, por *Pythium ultimum*  
 Enfermedades por *Rhizoctonia* provocadas, por ejemplo, por *Rhizoctonia solani*  
 40 Enfermedades por *Sclerotium* provocadas, por ejemplo, por *Sclerotium rolfsii*
- Enfermedades por cancro, retama y podredumbre peduncular tales como  
 Enfermedades por *Nectria* provocadas, por ejemplo, por *Nectria galligena*
- Enfermedades por roya tales como  
 Enfermedades por *Monilinia* provocadas, por ejemplo, por *Monilinia laxa*
- 45 Enfermedades por sarna o rizadura de las hojas tales como  
 Enfermedades por *Taphrina* provocadas, por ejemplo, por *Taphrina deformans*
- Enfermedades por deterioro de plantas de madera tales como  
 Enfermedades por Esca provocadas, por ejemplo, por *Phaeomoniella clamydospora*
- Enfermedades de flores y semillas tales como  
 50 Enfermedades por *Botrytis* provocadas, por ejemplo, por *Botrytis cinerea*
- Enfermedades de tubérculos tales como  
 Enfermedades por *Rhizoctonia* provocadas, por ejemplo, por *Rhizoctonia solani*
- Los compuestos del componente activo de fórmula (I), de acuerdo con la presente invención, muestran una buena  
 55 compatibilidad con las plantas a la concentración del compuesto activo necesaria para controlar patógenos de  
 plantas y, en caso de usarlo, es posible el tratamiento químico de las partes aéreas de las plantas, el tratamiento  
 químico de troncos o semillas, y el tratamiento del suelo.

Además, los compuestos activos de fórmula (I), de acuerdo con la presente invención, son poco tóxicos contra los animales de sangre caliente y pueden usarse de forma segura.

5 Los compuestos activos de fórmula (I), de acuerdo con la presente invención, pueden formularse en formas de formulación habituales, en el caso en el que se usen como productos químicos agrícolas. Como las formas de formulación pueden mencionarse, por ejemplo, soluciones, polvos humedecibles, emulsiones, suspensiones, polvos, agentes de espumación, pastas, comprimidos, gránulos, aerosoles, sustancias naturales y sintéticas impregnadas con compuesto activo, microcápsulas, agentes de recubrimiento de semillas, ULV [neblina fría, neblina cálida], etc.

10 Estas formulaciones pueden prepararse por procedimientos conocidos por sí mismos, por ejemplo, mezclando los compuestos activos con extendedores, en concreto diluyentes líquidos, diluyentes sólidos o vehículos, y opcionalmente con agentes tensioactivos, en concreto emulsionantes y/o dispersantes y/o agentes formadores de espuma.

15 Como diluyentes o vehículos líquidos pueden mencionarse, en general, hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, xileno, tolueno, alquilnaftaleno, etc.), hidrocarburos aromáticos clorados o alifáticos clorados (por ejemplo, clorobencenos, cloruros de etileno, cloruro de metileno, etc.), hidrocarburos alifáticos [por ejemplo, ciclohexano etc. o parafinas (por ejemplo, fracciones de aceite mineral etc.)], alcoholes (por ejemplo, butanol, glicoles etc.) y sus éteres, ésteres, etc., cetonas (por ejemplo, acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona o ciclohexanona, etc.), disolventes fuertemente polares (por ejemplo, dimetilformamida, dimetilsulfóxido, etc.), y agua. En el caso de usar agua como extendedor, por ejemplo, pueden usarse disolventes orgánicos como disolventes auxiliares.

20 Como diluyentes sólidos pueden mencionarse, por ejemplo, minerales naturales molidos (por ejemplo, caolín, arcilla, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierras diatomeas, etc.), minerales sintéticos molidos (por ejemplo, ácido silícico altamente dispersado, alúmina, silicatos, etc.).

25 Como vehículos sólidos para gránulos pueden mencionarse, por ejemplo, rocas trituradas y fraccionadas (por ejemplo, calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, etc.) gránulos sintéticos de harinas orgánicas e inorgánicas, partículas de materiales orgánicos (por ejemplo, serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz, tallos de tabaco, etc.), etc.

Como emulsionantes y/o agentes formadores de espuma pueden mencionarse, por ejemplo, emulsionantes no iónicos y aniónicos [por ejemplo, ésteres de ácido graso de polioxietileno, ésteres de alcohol de ácido graso de polioxietileno (por ejemplo, éteres de alquilaril poliglicol, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, etc.)], productos de la hidrólisis de albúmina, etc.

30 Los dispersantes incluyen, por ejemplo, licor residual de sulfito de lignina, metil celulosa, etc.

Los adherentes pueden usarse también en preparaciones (polvos, gránulos, concentrados emulsionables). Como los adherentes utilizables en este caso pueden mencionarse, por ejemplo, carboximetil celulosa, polímeros naturales y sintéticos (por ejemplo, goma arábica, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, etc.).

35 También pueden usarse colorantes. Como dichos colorantes pueden mencionarse pigmentos inorgánicos (por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul de Prusia, etc.), colorantes orgánicos tales como colorantes de alizarina, colorantes azo o colorantes de ftalocianina metálica, y trazas adicionales de nutrientes tales como hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno, cinc o sales de tales metales.

Dichas formulaciones pueden contener los compuestos activos de fórmula (I) de la presente invención a las proporciones en el intervalo de generalmente el 0,1 al 95% en peso, preferentemente del 0,5 al 90% en peso.

40 Los compuestos activos de fórmula (I), de acuerdo con la presente invención, pueden existir, en las formulaciones o mencionadas anteriormente o diversas formas de aplicación, junto con otros compuestos activos conocidos, por ejemplo, germicidas (fungicidas, bactericidas), insecticidas, miticidas, nematocidas, herbicidas, repelentes de pájaros, reguladores del crecimiento, fertilizantes y/o agentes mejoradores del suelo.

45 Los compuestos activos de acuerdo con la invención pueden estar presentes en las formulaciones o en las diversas formas de uso como una mezcla con otros compuestos activos conocidos, tales como fungicidas, bactericidas, insecticidas, acaricidas, nematocidas, herbicidas, repelentes de pájaros, factores de crecimiento, nutrientes para las plantas y agentes para mejorar la estructura del suelo.

En muchos casos, se consiguen efectos sinérgicos, es decir, la actividad de la mezcla supera la actividad de los componentes individuales.

50 Los ejemplos de co-componentes en mezclas son los siguientes compuestos:

#### **Fungicidas:**

##### *1. Inhibición de la síntesis de ácido nucleico*

- 1.1 benalaxilo, benalaxil-M, bupirinato, quiralexilo, clozilación, dimetirimol, etirimol, furalaxilo, himexazol, metalaxil-M, ofurace, oxadixilo, ácido oxolínico
2. *Inhibición de la mitosis y la división celular:*
- 2.1 benomilo, carbendazim, dietofencarb, fuberidazol, pencicurón, metil tiofanato de tiabendazol, zoxamida
- 5 3. *Inhibición de la respiración*
- 3.1 CI: diflumetorim
- 3.2 CII: boscalid, carboxina, fenfuram, flutolanilo, furametpir, mepronilo, oxicarboxina, pentiopirad, tifluzamida
- 3.3 CIII: azoxistrobina, ciazofamid, dimoxistrobina, enestrobina, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobina, cresoxim-metilo, metominostrobina, orisastrobina, piraclostrobina, picoxistrobina, trifloxistrobina,
- 10 3.4 Desacopladores: dinocap, fluazinam
- 3.5 Inhibición de la producción de ATP: acetato de fentina, cloruro de fentina, hidróxido de fentina, siltiofam
4. *Inhibición de AA y biosíntesis de proteínas*
- 4.1 andoprim, blastidina-S, ciprodinilo, casugamicina, clorhidrato de casugamicina hidrato, mepanipirim, pirimetanilo,
- 15 5. *Inhibición de la transducción de señales*
- 5.1 fenciclonilo, fludioxonilo, quinoxifeno
6. *Inhibición de lípidos y síntesis de membranas*
- 6.1 clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolina
- 6.2 pirazofos, edifenfos, iprobenfos (IBP), isoprotioloano
- 20 6.3 tolclofos-metilo, bifenilo
- 6.4 yodocarb, propamocarb, clorhidrato de propamocarb
7. *Inhibición de la biosíntesis de ergosterol*
- 7.1 fenhexamid,
- 7.2 azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, paclobutrazol, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, uniconazol, voriconazol, imazalilo, sulfato de imazalilo, oxpoconazol, fenarimol, flurprimidol, nuarimol, pirifenox, triforina, pefurazoato, procloraz, triflumizol, viniconazol,
- 25 7.3 aldiform, dodemorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidina, spiroxamina
- 30 7.4 naftifina, piributicarb, terbinafina,
8. *Inhibición de la síntesis de la pared celular*
- 8.1 bentiavalicarb, bialafos, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, polioxins, polioxorim, validamicina A
9. *Inhibición de la biosíntesis de melanina*
- 35 9.1 carpropamid, diclocimet, fenoxanilo, ftalida, piroquilon, triciclazol,
10. *Inductor de la defensa del huésped*
- 10.1 acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinilo
11. *Multisitio*
- 11.1 captafol, captano, clorotalonilo, preparaciones de cobre tales como: hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, óxido de cobre, oxina-cobre y mezcla de Bordeaux, diclofluanida, ditianona, dodina, domina como base libre, ferbam, fluorofolpet, folpet, guazatina, acetato de guazatina, iminoctadina, albesilato de iminoctadina, triacetato de iminoctadina, mancobre, mancozeb, maneb, metiram, metiram cinc, propineb, azufre y preparaciones de azufre incluyendo polisulfuro de calcio, tiram, toliifluanida, zineb, ziram,
- 40 12. *Desconocido*
- 12.1 amibromdol, bentiazol, betoxazina, capsimicina, carvona, quinometionat, cloropicrina, cufraneb, ciflufenamid, cimoxanilo, dazomet, debacarb, diclomezina, diclorofeno, diclorano, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamina, etaboxam, ferimzona, flumetover, flusulfamida, fosetil-aluminio, fosetil-calcio, fosetil-
- 45



sodio, fluopicolida, fluoroimida, hexaclorobenceno, sulfato de 8-hidroxiquinolina, irumamicina, metasulfocarb, metrafenona, isotiocianato de metilo, mildiomicina, natamicina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitroal-isopropilo, octhilinea, oxamocarb, oxifentiina, sales de pentaclorofenoland, sales de 2-fenilfenoland, ácido fosforoso y sus sales, piperalina, propanosina-sódica, proquinazid, pirrolnitrina, quintozeno, tecloftalam, tecnazeno, triazóxido, triclamida, zarilamida y 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonyl)-piridina, N-(4-Cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metil-bencenosulfonamida, 2-amino-4-metil-N-fenil-5-tiazolcarboxamida, 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridin-carboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxamidin-3-il]piridina, cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol, 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo, 3,4,5-tricloro-2,6-piridinadicarbonitrilo, 2-[[[ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]tio]metil]-alfa-(metoxi-metilen)-bencenoacetato de metilo, 4-Cloro-alfa-propinilo-N-[2-[3-metoxi-4-(2-propinilo)fenil]etil]-bencenoacetamida, (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonyl)amino]-butanamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triamino[1,5-a]pirimidina, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-N-[(1R)-1,2,2-trimetilpropil][1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, 5-cloro-N-[(1R)-1,2-dimetil-propil]-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, N-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil-2,4-dicloronicotinamida, 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiranon-4-ona, N-((Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil)-2-fenil-acetamida, N-(3-etil-3,5,5-trimetil-ciclohexil)-3-formilamino-2-hidroxi-benzamida, 2-[[[1-[3(1-Fluoro-2-feniletil)oxi]fenil]etiliden]amino]oxi]metil]-alfa-(metoxiimino)-N-metil-alfa-E-bencenoacetamida, N-[2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil]-2-(trifluorometil)benzamida, N-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, ácido 1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1H-imidazol-1-carboxílico, ácido O-[1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil]-1H-imidazol-1-carbotioico, 2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-m etilacetamida

#### Bactericidas:

bronopol, diclorofeno, nitrapirina, dimetilditiocarbamato de níquel, casugamicina, octilina, ácido furancarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomina, tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

#### Insecticidas / acaricidas / nematocidas:

##### 1. Inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE)

1.1 carbamatos (por ejemplo alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, almentexicarb, aminocarb, azametifos, bendiocarb, benfuracarb, bufencarb, butacarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, cloetocarb, coumafos, cianofenos, cianofos, dimetilan, etiofencarb, fenobucarb, fenotiocarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metam-sódico, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, promecarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC, xililcarb)

1.2 organofosfatos (por ejemplo acefato, azametifos, azinfos (-metilo, -etilo), bromofos-etilo, bromfenvinfos (-metilo), butatofos, cadusafos, carbofenotona, cloroetoxifos, clorofenvinfos, cloromefos, cloropirifos (-metilo/-etilo), cumafos, cianofenos, cianofos, clorofenvinfos, demeton-s-metilo, demeton-s-metilsulfona, dialifos, diazinona, diclofentona, diclorovos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, dioxabenzofos, disulfotona, EPN, etiona, etoprofos, etrimfos, famfur, fenamifos, fenitrotiona, fensulfotona, fentona, flupirazofos, fonofos, formotona, fosmetilano, fostiazato, heptenofos, yodofenos, iprobenfos, isazofos, isofenos, o-salicilato de isopropilo, isoxationa, malationa, mecarbam, metacrifos, metamidofos, metidationa, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidometon-metilo, parationa (-metil/-etilo), fentoato, forato, fosadona, fosmet, fosamidona, fosfocarb, foxima, pirimifos (-metilo/-etilo), profenofos, propafos, propetamfos, protiofos, protoato, piraclofos, piridafentona, piridationa, quinalfos, sebufos, sulfotep, sulprofos, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorovinfos, tiometon, triazofos, triclorfon, vamidotona)

##### 2. Moduladores/bloqueadores del canal de sodio de canales de sodio dependientes de tensión

2.1 piretroides (por ejemplo acrinatrina, aletrina (d-cis-trans, d-trans), beta-ciflutrina, bifentrina, bioaletrina, bioaletrina-S-ciclopentilo-isómero, bioetanometrina, biopermetrina, bioresmetrina, clovaportrina, cis-cipermetrina, cis-resmetrina, cis-permetrina, clocitrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cipermetrina (alfa-, beta-, theta-, zeta-), cifenotrina, DDT, deltametrina, empentrina (isómero 1R), esfenvalerato, etofenprox, fenflutrina, fenpropatrina, fenpiritrina, fenvalerato, flubrocitrinato, flucitrinato, flufenprox, flumetrina, flualinato, fubfenprox, gamma-cihalotrina, imiprotrina, cadetrina, lambda-cihalotrina, metoflutrina, permetrina (cis-, trans-), fenotrina (isómero 1R-trans), praletrina, proflutrina, protrifenbuto, piresmetrina, resmetrina, RU 15525, silafluofeno, tau-fluvalinato, teflutrina, teraletrina, tetrametrina (isómero 1R), tralometrina, transflutrina, ZXI 8901, piretrinas (piretrum))

2.2 oxadiazinas (por ejemplo indoxacarb)

##### 3. Agonistas/antagonistas del receptor de acetilcolina

3.1 cloronicotinilos/neonicotinoides (por ejemplo acetamiprid, clotianidin, dinotefurano, imidacloprid, nitenpiram, nitiazina, tiacloprid, tiametoxam)

3.2 nicotina, bensultap, cartap

4. *Moduladores de receptor de acetilcolina*
- 4.1 espinosinas (por ejemplo, espinosad)
5. *Antagonistas de canales de cloruro controlados por GABA*
- 5.1 organocloros de ciclodieno (por ejemplo camfecloro, clorodano, endosulfano, gamma-HCH, HCH, heptacloro, lindano, metoxicloro)
- 5.2 fiproles (por ejemplo acetoprol, etiprol, fipronilo, vaniliprol)
6. *Activadores del canal de cloruro*
- 6.1 mectinas (por ejemplo abamectina, avermectina, emamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, milbemectina, milbemicina)
10. 7. *Miméticos de la hormona juvenil*
- (por ejemplo diofenolano, epofenonano, fenoxicarb, hidropreno, quinopreno, metopreno, piriproxifeno, tripreno)
8. *Agonistas/disruptores de ecdisona*
- 8.1 diacilhidrazinas (por ejemplo cromafenoazida, halofenoazida, metoxifenoazida, tebufenoazida)
9. *Inhibidores de la biosíntesis de quitina*
15. 9.1 benzoilureas (por ejemplo bistriflurona, clofluzurona, diflubenzurona, fluazurona, flucicloxurona, flufenoxurona, hexaflumurona, lufenurona, novalurbn, noviflumurona, penflurona, teflubenzurona, triflumurona)
- 9.2 buprofezina
- 9.3 ciromazina
10. *Inhibidores de la fosforilación oxidativa, disruptores de ATP*
20. 10.1 diafentiurona
- 10.2 organoestaños (por ejemplo azocicloestaño, cihexaestaño, óxido de fenbutaestaño)
11. *Desacopladores de la fosforilación oxidativa que actúan interrumpiendo el gradiente H-protones*
- 11.1 pirroles (por ejemplo, clorofenapir)
- 11.2 dinitrofenoles (por ejemplo, binapacril, dinobuton, dinocap, DNOC)
25. 12. *Inhibidores del transporte de electrones de Sitio I*
- 12.1 METIs (por ejemplo, fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridabeno, tebufenpirad, tolfenpirad)
- 12.2 hidrametilnona
- 12.3 dicofol
13. *Inhibidores del transporte de electrones de Sitio II*
30. 13.1 rotenono
14. *Inhibidores del transporte de electrones de Sitio III*
- 14.1 acequinocilo, fluacripirim
15. *Disruptores microbianos de la membrana intestinal de insectos*
- cepas de *Bacillus thuringiensis*
35. 16. *Inhibidores de la síntesis de grasas*
- 16.1 ácidos tetrónicos (por ejemplo, espirodiclofeno, espiromesifeno)
- 16.2 ácidos tetrámicos [por ejemplo, 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1-azaespiro-[4,5]dec-3-en-4-il etil carbonato (alias: ácido carbónico, 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1-azaespiro[4,5]dec-3-en-4-il etil éster, N° Reg. CAS: 382608-10-8) y ácido carbónico, cis-3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1-azaespiro[4,5]dec-3-en-4-il etil éster (N° Reg. CAS: 203313-25-1)]
40. 17. *Carboxamidas*
- (por ejemplo, flonicamid)
18. *Agonistas octopaminérgicos*

(por ejemplo, amitraz)

19. *Inhibidores de ATPasa estimulada por magnesio*

(por ejemplo, propargita)

20. *Ftalamidas*

- 5 (por ejemplo, N<sup>2</sup>-[1,1-dimetil-2-(metilsulfonil)etil]-3-yodo-N<sup>1</sup>-[2-metil-4-[1,2,2,2-tetra-fluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil]-1,2-bencenodicarboxamida (Nº Reg. CAS: 272451-65-7), flubendiamida)

21. *Análogos de nereistoxina*

(por ejemplo, hidrógeno oxalato de tiociclam, tiosultap-sódico)

22. *Productos biológicos, hormonas o feromonas*

- 10 (por ejemplo, azadiractina, Bacillus spec., Beauveria spec., Codlemona, Metarrhizium spec., Paecilomyces spec., Thuringiensin, Verticillium spec.)

23. *Compuestos activos con mecanismos de acción desconocidos o no específicos*

23.1 fumigantes (por ejemplo, fosfuro de aluminio, bromuro de metilo, fluoruro de sulfurilo)

23.2 Modificadores selectivos del comportamiento alimentario (por ejemplo, criolita, flonicamid, pymetrozina)

- 15 23.3 inhibidores del crecimiento de ácaros (por ejemplo, clofentezina, etoxazol, hexitiazox)

23.4 amidoflumet, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, buprofezina, quinometionat, clorodimeform, clorobencilato, cloropicrina, clotiazoben, ciclopreno, ciflumetofeno, diciclanilo, fenoxacrim, fentrifanilo, flubenzimina, flufenerim, flutenzina, gosiplure, hidrametilnona, japonilurae, metoxadiazona, petróleo, butóxido de piperonilo, oleato potásico, pirafluprol, piridalilo, piriprol, sulfluramid, tetradifon, tetrasul, triaratenó, verbutina,

- 20 adicionalmente el compuesto 3-metilfenil propilcarbamato (Tsumacida Z), el compuesto 3-(5-cloro-3-piridinil-8-(2,2,2-trifluoroetil)-8-azabicyclo[3,2,1]octano-3-carbonitrilo (Nº Reg. CAS 185982-80-3) y el isómero 3-endo correspondiente (Nº Reg. CAS 185984-60-5) (cf. documentos WO 96/37494, WO 98/25923), y preparaciones que comprenden extractos vegetales insecticidamente activos, nematodos, hongos o virus.

- 25 Una mezcla con otros compuestos activos conocidos, tales como herbicidas, o con fertilizantes y reguladores del crecimiento, protectores y/o semioquímicos también es posible.

Los compuestos activos pueden usarse tal cual o en forma de sus formulaciones o las formas de uso preparadas a partir de los mismos por dilución adicional, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, comprimidos, pastas, micro-cápsulas y gránulos listos para su uso. Éstos se usan de la manera habitual, por ejemplo por humedecimiento con agua, inmersión, pulverización, atomización, nebulización, vaporización, inyección, formación de una suspensión gaseosa, cepillado, pulverizado, dispersión, desinfección en seco, desinfección en húmedo, desinfección húmeda, desinfección en suspensión o incrustación.

- 30 En el tratamiento de partes de plantas, la concentración de compuestos activos en las formas de uso puede variar dentro de un intervalo sustancial. En general, son del 1 al 0,0001% en peso, preferentemente del 0,5 y el 0,001%. Para el tratamiento de las semillas, se emplean generalmente cantidades del compuesto activo de 0,1 a 10 g, especialmente de 1 a 5 g, por 1 kilogramo de semilla.

Para el tratamiento del suelo, se emplean generalmente concentraciones del compuesto activo, en el punto de acción, del 0,00001 al 0,1% en peso, especialmente del 0,0001 al 0,02%.

- 40 Como ya se ha mencionado anteriormente, todas las plantas y partes de plantas pueden tratarse de acuerdo con la invención.

- 45 En una realización preferida se tratan especies de plantas de origen natural y variedades de plantas o aquellas obtenidas por procedimientos de cultivo biológico convencionales, tales como cruzamiento o fusión protoplástica, así como partes de tales plantas. En una realización preferida adicional se tratan plantas transgénicas y variedades de plantas que se han obtenido por procedimientos de ingeniería genética, posiblemente junto con procedimientos convencionales (organismos modificados genéticamente) y partes de tales plantas. El término "partes" o "partes de plantas" o "partes de planta" se ha explicado anteriormente.

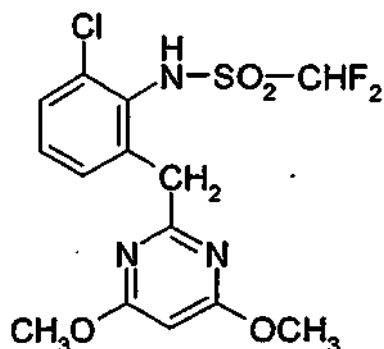
- 50 De acuerdo con la invención, las plantas de las variedades de plantas disponibles en el mercado o usadas en cualquier momento particular se tratan muy preferentemente. Se entiende que las variedades de plantas son plantas con propiedades específicas ("características fundamentales") que se han obtenido tanto por cultivo convencional, por mutagénesis o por técnicas de ADN recombinante. Pueden ser variedades, biotipos o genotipos.

Dependiendo de las especies o variedades de plantas, su locación y condiciones de crecimiento (los tipos de suelo, clima, periodo de vegetación y alimentación de interés), pueden darse efectos superaditivos ("sinérgicos") como resultado del tratamiento de acuerdo con la invención. Los efectos tales como, por ejemplo, tasas de aplicación reducidas y/o ensanchamiento de los espectros de actividad y/o aumento de la actividad de los compuestos y composiciones utilizables de acuerdo con la invención, crecimiento mejorado de las plantas, aumento de la tolerancia a temperaturas altas y bajas, aumento de la tolerancia a las condiciones secas o a los contenidos de sal del agua o el suelo, aumento de la capacidad de floración, favorecimiento de la recolección, aceleración de la madurez, aumento de los rendimientos del cultivo, mayor calidad y/o aumento del valor nutricional de los cultivos recolectados y aumento de la calidad del almacenamiento y/o procesabilidad de los cultivos recolectados son posibles, y son mayores que los esperados actualmente.

Las plantas transgénicas o variedades de plantas preferidas (obtenidas por ingeniería genética) que se van a tratar de acuerdo con la invención incluyen todas las plantas que, como resultado de la modificación genética en cuestión, han recibido material genético que les proporciona propiedades valiosas particularmente ventajosas ("características fundamentales"). Los ejemplos de tales propiedades son un crecimiento de la planta mejorado, aumento de la tolerancia a temperaturas altas y bajas, aumento de la tolerancia en condiciones secas o a los contenidos de sal en el agua o el suelo, aumento de la capacidad de floración, favorecimiento de la recolección, aceleración de la madurez, aumento de los rendimientos del cultivo, mayor calidad y/o aumento del valor nutricional de los cultivos recolectados y aumento de la calidad del almacenamiento y/o procesabilidad de los cultivos recolectados. Otros ejemplos adicionales y particularmente notables de tales propiedades son un aumento de la resistencia de las plantas a las plagas de animales y microbios, tales como insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus, así como un aumento de la tolerancia por las plantas de ciertos compuestos activos herbicidas. Los ejemplos que pueden mencionarse de plantas transgénicas son las plantas de cultivo importante tales como cereales (trigo y arroz), maíz, semillas de soja, patatas, algodón, colza y plantas frutales (que producen manzanas, peras, frutos cítricos y uvas), siendo las plantas de cultivo maíz, semillas de soja, patatas, algodón y colza particularmente notables. Son propiedades particularmente significativas ("características fundamentales") el aumento de la resistencia de las plantas a insectos debido a las toxinas que se forman en las plantas, y en particular aquellas que se producen en las plantas (denominado en lo sucesivo en el presente documento "plantas Bt") por el material genético obtenido de *Bacillus Thuringiensis* (por ejemplo, mediante los genes Cry1A(a), Cry1A(b), Cry1A(c), Cry1IA, CryIIIB2, Cry9cCry2Ab, Cry3Bb y CryIF y combinaciones de los mismos). Las propiedades particularmente significativas ("características fundamentales") son el aumento de la resistencia de las plantas a hongos, bacterias y virus debido a la resistencia adquirida sistémicamente (RAS), sistemina, fitoalexinas, genes suscitantos y de resistencia y las proteínas y toxinas expresadas correspondientemente. Las propiedades particularmente significativas ("características fundamentales") son también un aumento de la tolerancia por las plantas de ciertos compuestos activos herbicidas, tales como, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfotricina (por ejemplo, el gen "PAT"). Los genes correspondientes que imparten las propiedades requeridas ("características fundamentales") pueden aparecer en las plantas transgénicas en combinación de unos con otros. Los ejemplos que pueden mencionarse de "plantas Bt" son variedades de maíz, algodón, semillas de soja y patatas que se comercializan con los nombres comerciales YIELD GARD® (por ejemplo, maíz, algodón, semillas de soja), KnockOut® (por ejemplo, maíz), StarLink® (por ejemplo, maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón) y NewLeaf® (patatas). Los ejemplos que pueden mencionarse de plantas tolerantes a herbicidas son variedades de maíz, algodón y semillas de soja que se comercializan con los nombres comerciales Roundup Ready® (tolerancia de glifosato, por ejemplo, maíz, algodón, semillas de soja), Liberty Link® (tolerancia de fosfotricina, por ejemplo colza), IMI® (tolerancia de imidazolinonas) y STS® (tolerancia de sulfonilureas, por ejemplo maíz). Las plantas resistentes a herbicidas (cultivadas para tolerancia a herbicidas de una manera convencional) que pueden mencionarse son también las variedades (por ejemplo, maíz) comercializadas con el nombre Clearfield®. Las afirmaciones anteriores, por supuesto, se aplican también a cualquiera de las variedades de plantas que puedan desarrollarse en el futuro o lanzarse al mercado en el futuro y que tengan las propiedades genéticas ("características fundamentales") descritas anteriormente o desarrolladas en el futuro.

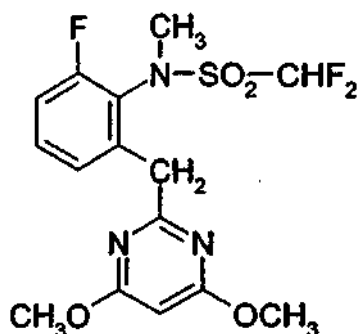
De acuerdo con la invención, las plantas mencionadas anteriormente pueden tratarse de forma particularmente ventajosa con los compuestos de fórmula general I o las mezclas de compuesto activo de acuerdo con la invención. Los intervalos preferidos mencionados anteriormente para los compuestos activos o mezclas se aplican también al tratamiento de estas plantas. Es particularmente ventajoso tratamiento de plantas con los compuestos o mezclas indicados específicamente en el presente texto.

Después, la preparación y uso de los compuestos de la presente invención se describirá más específicamente mediante los siguientes Ejemplos. La presente invención, sin embargo, no se restringirá a los mismos de ninguna manera.

**Ejemplo de Síntesis 1**

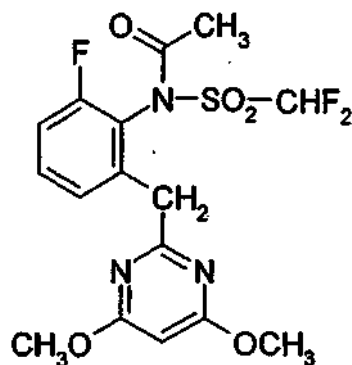
5 2-Cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]anilina 1,54 g (5,51 mmol) se disolvió en diclorometano (12 ml), a lo que después se añadió piridina 0,87 g (11,01 mmol). La solución se enfrió a -5 °C y se le añadió una solución de cloruro de difluorometanosulfonilo 1,66 g (11,01 mmol) en diclorometano (2 ml). La solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 4 días, después se le añadió agua y se extrajo tres veces con diclorometano. Después de que la fase orgánica se hubiera lavado con agua y secado, el diclorometano se retiró por destilación a presión reducida. La sustancia oleosa obtenida se trató con cromatografía en columna usando un disolvente mixto 1:6 de acetato de etilo y hexano como eluyente obteniendo la 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]-N-difluorometanosulfonilida objetivo, 1,2 g (rendimiento 55%) en forma de cristales blancos.

10 <sup>1</sup>H RMN (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 3,94 (6 H, s), 4,30 (2 H, s), 5,92 (1 H, s), 6,74 (1 H, t), 7,18-7,21 (1 H, m), 7,33-7,38 (2 H, m), 11,09 (1 H, a).

**Ejemplo de Síntesis 2**

15 A una solución de 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]-N-difluorometanosulfonilida 0,1 g (0,27 mmol) en acetonitrilo (3 ml), se le añadieron carbonato potásico 0,06 g (0,40 mmol) y yoduro de metilo 0,08 g y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 24 horas. La solución de reacción obtenida se filtró y los cristales en bruto, obtenidos por destilación del filtrado a presión reducida, se lavaron con un disolvente mixto 1:6 de éter y hexano obteniendo la 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]-N-metil-N-difluorometano-sulfonilida objetivo, 0,1 g (rendimiento 93%) en forma de cristales blancos.

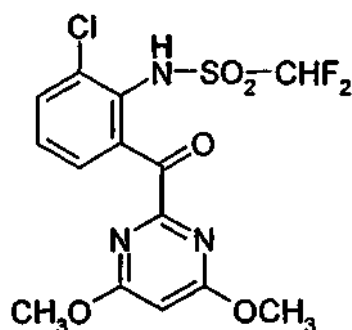
20 <sup>1</sup>H RMN (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 3,97 (6 H, s), 4,26 (2 H, s), 5,94 (1 H, s), 6,59 (1 H, t), 7,05-7,13 (1 H, m), 7,16-7,23 (2 H, m), 11,14 (1 H, a).

**Ejemplo de Síntesis 3**

Una solución de 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]-N-difluorometanosulfonilida 0,1 g (0,27 mmol) y trietilamina 0,04 g (0,40 mmol) en diclorometano (3 ml) se enfrió con hielo. A la solución, se le añadió cloruro de acetilo 0,03 g (0,32 mmol) y la solución mixta se agitó a temperatura ambiente durante 24 horas. Se añadió agua a la solución de reacción obtenida y la fase orgánica se separó. La fase acuosa se extrajo adicionalmente tres veces con diclorometano. Después de que la fase orgánica se hubiera lavado con agua y secado, el diclorometano se retiró por destilación a presión reducida, y los cristales en bruto obtenidos se lavaron con un disolvente mixto 1:6 de éter y hexano obteniendo la 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]-N-acetil-N-difluorometanosulfonilida objetivo, 0,1 g (rendimiento 89%) en forma de cristales blancos.

$^1\text{H}$  RMN (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1,94 (3 H, s), 3,87 (6 H, s), 4,10 (1 H, d, J = 15 Hz), 4,30 (1 H, d, J = 15 Hz), 5,89 (1 H, s), 6,97 (1 H, t), 7,14-7,17 (1 H, m), 7,33-7,45 (2 H, m).

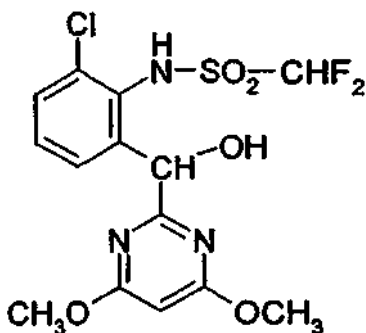
#### Ejemplo de Síntesis 4



2-Cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]-N-difluorometanosulfonilida 0,4 g (1,02 mmol) se disolvió en ácido acético (6 ml), a lo que después se añadió óxido de cromo (VI) 0,31 g (3,05 mmol), y la solución se calentó a 30 °C. La solución se agitó durante 6 horas y se agitó adicionalmente a temperatura ambiente durante 12 horas. La solución de reacción se diluyó con agua y se extrajo tres veces con éter dietílico. La fase orgánica se lavó con agua y se secó, y el éter dietílico se retiró por destilación a presión reducida. La sustancia oleosa obtenida se trató con cromatografía en columna usando un disolvente mixto 1:3 de acetato de etilo y hexano como eluyente obteniendo la 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]-N-difluoro-metanosulfonilida objetivo, 0,28 g (rendimiento 67%) en forma de cristales blancos.

$^1\text{H}$  RMN (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3,93 (6 H, s), 6,19 (1 H, s), 6,34 (1 H, t), 7,37-7,43 (1 H, m), 7,63-7,69 (2 H, m).

#### Ejemplo de Síntesis 5



2-Cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]-N-difluorometanosulfonilida 0,14 g (0,34 mmol) se disolvió en metanol 5 ml y la solución se enfrió a 5 °C, y se le añadió borohidruro sódico 0,026 g (0,69 mmol) mientras se agitaba. La solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas y después se destiló a presión reducida. Los cristales obtenidos se disolvieron en agua y diclorometano y se neutralizaron con ácido cítrico. La fase orgánica se separó y la fase acuosa se extrajo adicionalmente tres veces con diclorometano. Después de que la fase orgánica se hubiera lavado con agua y secado, el diclorometano se retiró por destilación a presión reducida obteniendo la 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)hidroximetil]-N-difluorometanosulfonilida objetivo, 0,11 g (rendimiento 78%) en forma de cristales blancos.

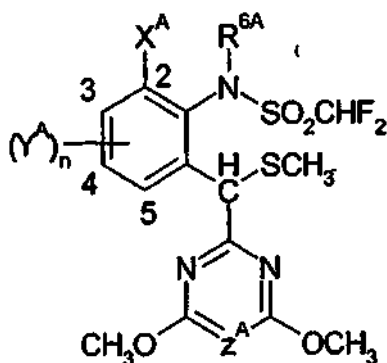
$^1\text{H}$  RMN-(300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3,99 (6 H, s), 4,99 (1 H, a), 5,99 (1 H, s), 6,24 (1 H, s), 6,76 (1 H, t), 7,27-7,30 (1 H, m), 7,39-7,42 (1 H, m), 7,64-7,67 (1 H, m), 10,62 (1 H, a).

Los ejemplos de los compuestos obtenidos de la misma manera que la mencionada anteriormente en los Ejemplos de Síntesis 1 a 5 y obtenidos fácilmente de acuerdo con los procedimientos de preparación generales de los procedimientos de preparación (a) a (h) mencionados anteriormente se muestran, junto con los compuestos de los

Ejemplos de Síntesis 1 a 5 mencionados anteriormente, en las siguientes Tablas 1 a 7, y sus propiedades físicas y químicas se muestran en la Tabla 8.

5 En las tablas Me representa metilo, Et representa etilo, iPr representa isopropilo, CH<sub>2</sub>Ph representa bencilo, cicloPr representa ciclopropilo, ciclohexilo representa ciclohexilo, OMe representa metoxi, OEt representa etoxi, OPh representa fenoxi, SMe representa metilitio, SOMe representa metilsulfonilo, SO<sub>2</sub>Me representa metilsulfonilo, COMe representa acetilo, COcPr representa ciclopropilcarbonilo, CO<sub>2</sub>Me o COOMe representa metoxycarbonilo, vinilo representa vinilo, alilo representa alilo, propargilo representa propargilo, MOM representa metoximetilo, y CH<sub>2</sub>OEt representa etoximetilo.

Tabla 1



10

Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
1-1	H	H	H	CH
1-2	H	H	CH <sub>3</sub>	CH
1-3	H	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH
1-4	H	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
1-5	H	H	COCH <sub>3</sub>	CH
1-6	H	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
1-7	H	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
1-8	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
1-9	H	H	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH
1-10	H	H	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
1-11	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	CH
1-12	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
1-13	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	CH
1-14	F	H	H	CH
1-15	F	H	CH <sub>3</sub>	CH
1-16	F	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH
1-17	F	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
1-18	F	H	COCH <sub>3</sub>	CH
1-19	F	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
1-20	F	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
1-21	F	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH

(continuación)

Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
1-22	F	H	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH
1-23	F	H	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
1-24	F	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	CH
1-25	F	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
1-26	F	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	CH
1-27	Cl	H	H	CH
1-28	Cl	H	CH <sub>3</sub>	CH
1-29	Cl	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH
1-30	Cl	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
1-31	Cl	H	COCH <sub>3</sub>	CH
1-32	Cl	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
1-33	Cl	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
1-34	Cl	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
1-35	Cl	H	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH
1-36	Cl	H	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
1-37	Cl	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	CH
1-38	Cl	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
1-39	Cl	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	CH
1-40	H	H	H	N
1-41	H	H	CH <sub>3</sub>	N
1-42	H	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
1-43	H	H	COCH <sub>3</sub>	N
1-44	H	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
1-45	H	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
1-46	F	H	H	N
1-47	F	H	CH <sub>3</sub>	N
1-48	F	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
1-49	F	H	COCH <sub>3</sub>	N
1-50	F	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
1-51	F	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
1-52	Cl	H	H	N
1-53	Cl	H	CH <sub>3</sub>	N
1-54	Cl	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
1-55	Cl	H	COCH <sub>3</sub>	N



## ES 2 393 496 T3

(continuación)

Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
1-56	Cl	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
1-57	Cl	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
1-58	H	H	H	C-CH <sub>3</sub>
1-59	F	H	H	C-CH <sub>3</sub>
1-60	Cl	H	H	C-CH <sub>3</sub>
1-61	H	3-F	H	CH
1-62	H	4-F	H	CH
1-63	H	5-F	H	CH
1-64	H	3-Cl	H	CH
1-65	H	4-Cl	H	CH
1-66	H	5-Cl	H	CH
1-67	H	3,5-F <sub>2</sub>	H	CH
1-68	H	3,5-Cl	H	CH
1-69	H	4,5-F <sub>2</sub>	H	CH
1-70	H	4,5-Cl <sub>2</sub>	H	CH
1-71	H	3-CH <sub>3</sub>	H	CH
1-72	H	4-CH <sub>3</sub>	H	CH
1-73	H	5-CH <sub>3</sub>	H	CH
1-74	H	3-CF <sub>3</sub>	H	CH
1-75	H	4-CF <sub>3</sub>	H	CH
1-76	H	5-CF <sub>3</sub>	H	CH
1-77	H	3-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	CH
1-78	H	4-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	CH
1-79	H	5-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	CH
1-80	H	3-OCH <sub>3</sub>	H	CH
1-81	H	4-OCH <sub>3</sub>	H	CH
1-82	H	5-OCH <sub>3</sub>	H	CH
1-83	H	3-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
1-84	H	4-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
1-85	H	5-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
1-86	H	3-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
1-87	H	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
1-88	H	5-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
1-89	H	3-SCF <sub>3</sub>	H	CH

## ES 2 393 496 T3

(continuación)

Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
1-90	H	4-SCF <sub>3</sub>	H	CH
1-91	H	5-SCF <sub>3</sub>	H	CH
1-92	H	3-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
1-93	H	4-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
1-94	H	5-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
1-95	H	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
1-96	H	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
1-97	H	5-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
1-98	H	3-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH
1-99	H	4-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH
1-100	H	5-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH
1-101	H	3-NO <sub>2</sub>	H	CH
1-102	H	4-NO <sub>2</sub>	H	CH
1-103	H	5-NO <sub>2</sub>	H	CH
1-104	H	3-CN	H	CH
1-105	H	4-CN	H	CH
1-106	H	5-CN	H	CH
1-107	H	3-COCH <sub>3</sub>	H	CH
1-108	H	4-COCH <sub>3</sub>	H	CH
1-109	H	5-COCH <sub>3</sub>	H	CH
1-110	F	3-F	H	CH
1-111	F	4-F	H	CH
1-112	F	5-F	H	CH
1-113	F	3-Cl	H	CH
1-114	F	4-Cl	H	CH
1-115	F	5-Cl	H	CH
1-116	F	3-CH <sub>3</sub>	H	CH
1-117	F	4-CH <sub>3</sub>	H	CH
1-118	F	5-CH <sub>3</sub>	H	CH
1-119	F	3-OCH <sub>3</sub>	H	CH
1-120	F	4-OCH <sub>3</sub>	H	CH
1-121	F	5-OCH <sub>3</sub>	H	CH
1-122	F	4-CN	H	CH
1-123	F	3,4-F <sub>2</sub>	H	CH

## ES 2 393 496 T3

(continuación)

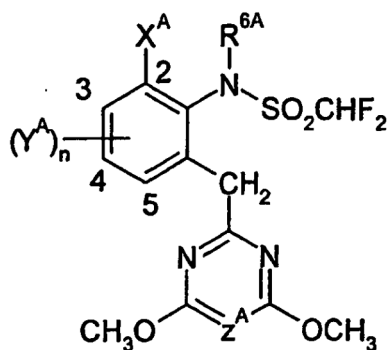
Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
1-124	F	4,5-F <sub>2</sub>	H	CH
1-125	F	4-F-3-Cl	H	CH
1-126	F	3-F-5-Cl	H	CH
1-127	F	5-F-4-CN	H	CH
1-128	F	3-F-4-CF <sub>3</sub>	H	CH
1-129	F	3-CF <sub>3</sub>	H	CH
1-130	F	5-CF <sub>3</sub>	H	CH
1-131	F	4-Br	H	CH
1-132	F	5-OCF <sub>3</sub> -4-F	H	CH
1-133	Cl	3-F	H	CH
1-134	Cl	4-F	H	CH
1-135	Cl	5-F	H	CH
1-136	Cl	3-Cl	H	CH
1-137	Cl	4-Cl	H	CH
1-138	Cl	5-Cl	H	CH
1-139	Cl	3-CH <sub>3</sub>	H	CH
1-140	Cl	4-CH <sub>3</sub>	H	CH
1-141	Cl	5-CH <sub>3</sub>	H	CH
1-142	Cl	3-OCH <sub>3</sub>	H	CH
1-143	Cl	4-OCH <sub>3</sub>	H	CH
1-144	Cl	5-OCH <sub>3</sub>	H	CH
1-145	Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
1-146	Cl	3-SCF <sub>3</sub>	H	CH
1-147	Cl	4-SCF <sub>3</sub>	H	CH
1-148	Cl	5-SCF <sub>3</sub>	H	CH
1-149	Cl	3-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
1-150	Cl	4-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
1-151	Cl	5-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
1-152	Cl	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
1-153	Cl	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
1-154	Cl	5-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
1-155	Cl	4-CN	H	CH
1-156	Cl	3,4-Cl <sub>2</sub>	H	CH
1-157	Cl	4,5-Cl <sub>2</sub>	H	CH

## ES 2 393 496 T3

(continuación)

Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
1-158	Cl	3-Cl-4-CF <sub>3</sub>	H	CH
1-159	Cl	4-Cl-3-CH <sub>3</sub>	H	CH
1-160	Cl	5-OCF <sub>3</sub> -4-F	H	CH
1-161	Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
1-162	Cl	4-CF <sub>3</sub>	H	CH
1-163	Cl	5-CF <sub>3</sub>	H	CH
1-164	CHO	H	H	CH
1-165	COCH <sub>3</sub>	H	H	CH
1-166	COcPr	H	H	CH
1-167	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
1-168	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
1-169	CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	CH
1-170	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	CH
1-171	OCH <sub>3</sub>	H	H	CH
1-172	OCF <sub>3</sub>	H	H	CH
1-173	OCHF <sub>2</sub>	H	H	CH
1-174	OPh	H	H	CH
1-175	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
1-176	SCF <sub>3</sub>	H	H	CH
1-177	SOCF <sub>3</sub>	H	H	CH
1-178	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CH
1-179	CN	H	H	CH
1-180	NO <sub>2</sub>	H	H	CH
1-181	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
1-182	OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CH
1-183	OSO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	CH
1-184	OSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	H	H	CH
1-185	OSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CH
1-186	OSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	H	H	CH
1-187	COCH <sub>3</sub>	H	H	N
1-188	COcPr	H	H	N
1-189	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	N
1-190	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	N

Tabla 2



Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
2-1	H	H	H	CH
2-2	H	H	CH <sub>3</sub>	CH
2-3	H	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH
2-4	H	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
2-5	H	H	COCH <sub>3</sub>	CH
2-6	H	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
2-7	H	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
2-8	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
2-9	H	H	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH
2-10	H	H	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
2-11	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	CH
2-12	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
2-13	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	CH
2-14	F	H	CH <sub>3</sub>	CH
2-15	F	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
2-16	F	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH
2-17	F	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
2-18	F	H	COCH <sub>3</sub>	CH
2-19	F	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
2-20	F	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
2-21	F	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
2-22	F	H	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH
2-23	F	H	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
2-24	F	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	CH
2-25	F	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
2-26	F	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	CH

## ES 2 393 496 T3

(continuación)

Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
2-27	Cl	H	CH <sub>3</sub>	CH
2-28	Cl	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
2-29	Cl	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH
2-30	Cl	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
2-31	Cl	H	COCH <sub>3</sub>	CH
2-32	Cl	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
2-33	Cl	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
2-34	Cl	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
2-35	Cl	H	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH
2-36	Cl	H	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
2-37	Cl	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	CH
2-38	Cl	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
2-39	Cl	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	CH
2-40	H	H	H	N
2-41	H	H	CH <sub>3</sub>	N
2-42	H	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
2-43	H	H	COCH <sub>3</sub>	N
2-44	H	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
2-45	H	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
2-46	F	H	CH <sub>3</sub>	N
2-47	F	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	N
2-48	F	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
2-49	F	H	COCH <sub>3</sub>	N
2-50	F	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
2-51	F	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
2-52	Cl	H	CH <sub>3</sub>	N
2-53	Cl	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	N
2-54	Cl	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
2-55	Cl	H	COCH <sub>3</sub>	N
2-56	Cl	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
2-57	Cl	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
2-58	H	H	H	C-CH <sub>3</sub>
2-59	F	H	H	C-CH <sub>3</sub>
2-60	Cl	H	H	C-CH <sub>3</sub>

## ES 2 393 496 T3

(continuación)

Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
2-61	H	3-F	H	CH
2-62	H	4-F	H	CH
2-63	H	5-F	H	CH
2-64	H	3-Cl	H	CH
2-65	H	4-Cl	H	CH
2-66	H	5-Cl	H	CH
2-67	H	3,5-F <sub>2</sub>	H	CH
2-68	H	3,5-Cl	H	CH
2-69	H	4,5-F <sub>2</sub>	H	CH
2-70	H	4,5-Cl <sub>2</sub>	H	CH
2-71	H	3-CH <sub>3</sub>	H	CH
2-72	H	4-CH <sub>3</sub>	H	CH
2-73	H	5-CH <sub>3</sub>	H	CH
2-74	H	3-CF <sub>3</sub>	H	CH
2-75	H	4-CF <sub>3</sub>	H	CH
2-76	H	5-CF <sub>3</sub>	H	CH
2-77	H	3-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	CH
2-78	H	4-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	CH
2-79	H	5-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	CH
2-80	H	3-COCH <sub>3</sub>	H	CH
2-81	H	4-OCH <sub>3</sub>	H	CH
2-82	H	5-OCH <sub>3</sub>	H	CH
2-83	H	3-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
2-84	H	4-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
2-85	H	5-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
2-86	H	3-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
2-87	H	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
2-88	H	5-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
2-89	H	3-SCF <sub>3</sub>	H	CH
2-90	H	4-SCF <sub>3</sub>	H	CH
2-91	H	5-SCF <sub>3</sub>	H	CH
2-92	H	3-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
2-93	H	4-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
2-94	H	5-SOCF <sub>3</sub>	H	CH

## ES 2 393 496 T3

(continuación)

Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
2-95	H	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
2-96	H	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
2-97	H	5-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
2-98	H	3-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH
2-99	H	4-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH
2-100	H	5-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH
2-101	H	3-NO <sub>2</sub>	H	CH
2-102	H	4-NO <sub>2</sub>	H	CH
2-103	H	5-NO <sub>2</sub>	H	CH
2-104	H	3-CN	H	CH
2-105	H	4-CN	H	CH
2-106	H	5-CN	H	CH
2-107	H	3-COCH <sub>3</sub>	H	CH
2-108	H	4-COCH <sub>3</sub>	H	CH
2-109	H	5-COCH <sub>3</sub>	H	CH
2-110	F	3-F	H	CH
2-111	F	4-F	H	CH
2-112	F	5-F	H	CH
2-113	F	3-Cl	H	CH
2-114	F	4-Cl	H	CH
2-115	F	5-Cl	H	CH
2-116	F	3-CH <sub>3</sub>	H	CH
2-117	F	4-CH <sub>3</sub>	H	CH
2-118	F	5-CH <sub>3</sub>	H	CH
2-119	F	3-OCH <sub>3</sub>	H	CH
2-120	F	4-OCH <sub>3</sub>	H	CH
2-121	F	5-OCH <sub>3</sub>	H	CH
2-122	F	4-CN	H	CH
2-123	F	3,4-F <sub>2</sub>	H	CH
2-124	F	4,5-F <sub>2</sub>	H	CH
2-125	F	4-F-3-Cl	H	CH
2-126	F	3-F-5-Cl	H	CH
2-127	F	5-F-4-CN	H	CH
2-128	F	3-F-4-CF <sub>3</sub>	H	CH



## ES 2 393 496 T3

(continuación)

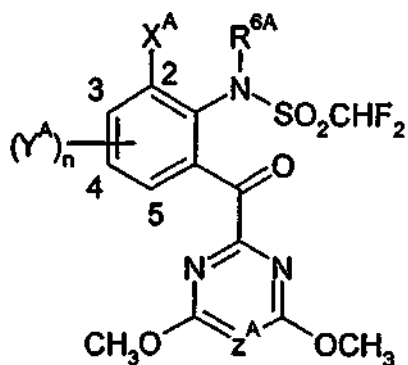
Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
2-129	F	3-CF <sub>3</sub>	H	CH
2-130	F	5-CF <sub>3</sub>	H	CH
2-131	F	4-Br	H	CH
2-132	F	5-OCF <sub>3</sub> -4-F	H	CH
2-133	Cl	3-F	H	CH
2-134	Cl	4-F	H	CH
2-135	Cl	5-F	H	CH
2-136	Cl	3-Cl	H	CH
2-137	Cl	4-Cl	H	CH
2-138	Cl	5-Cl	H	CH
2-139	Cl	3-CH <sub>3</sub>	H	CH
2-140	Cl	4-CH <sub>3</sub>	H	CH
2-141	Cl	5-CH <sub>3</sub>	H	CH
2-142	Cl	3-OCH <sub>3</sub>	H	CH
2-143	Cl	4-OCH <sub>3</sub>	H	CH
2-144	Cl	5-OCH <sub>3</sub>	H	CH
2-145	Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
2-146	Cl	3-SCF <sub>3</sub>	H	CH
2-147	Cl	4-SCF <sub>3</sub>	H	CH
2-148	Cl	5-SCF <sub>3</sub>	H	CH
2-149 9	Cl	3-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
2-150	Cl	4-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
2-151	Cl	5-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
2-152	Cl	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
2-153	Cl	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
2-154	Cl	5-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
2-155	Cl	4-CN	H	CH
2-156	Cl	3,4-Cl <sub>2</sub>	H	CH
2-157	Cl	4,5-Cl <sub>2</sub>	H	CH
2-158	Cl	3-Cl-4-CF <sub>3</sub>	H	CH
2-159	Cl	4-Cl-3-CH <sub>3</sub>	H	CH
2-160	Cl	5-OCF <sub>3</sub> -4-F	H	CH
2-161	Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
2-162	Cl	4-CF <sub>3</sub>	H	CH

## ES 2 393 496 T3

(continuación)

Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
2-163	Cl	5-CF <sub>3</sub>	H	CH
2-164	CHO	H	H	CH
2-165	COCH <sub>3</sub>	H	H	CH
2-166	COcPr	H	H	CH
2-167	CO <sub>2</sub> H	H	H	CH
2-168	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
2-169	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
2-170	CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	CH
2-171	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	CH
2-172	OCH <sub>3</sub>	H	H	CH
2-173	OCF <sub>3</sub>	H	H	CH
2-174	OCH <sub>2</sub>	H	H	CH
2-175	OPh	H	H	CH
2-176	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
2-177	SCF <sub>3</sub>	H	H	CH
2-178	SOCF <sub>3</sub>	H	H	CH
2-179	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
2-180	OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CH
2-181	OSO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	CH
2-182	OSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	H	H	CH
2-183	OSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CH
2-184	OSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	H	H	CH
2-185	COCH <sub>3</sub>	H	H	N
2-186	COcPr	H	H	N
2-187	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	N
2-188	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	N
2-189	H	4-CO <sub>2</sub> H	H	CH
2-190	H	3-F-4-CH <sub>3</sub>	H	CH
2-191	Cl	H	CO <sub>c</sub> Pr	CH
2-192	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>	H	CH
2-193	CH <sub>3</sub>	3-F	H	CH
2-194	CH <sub>3</sub>	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH

Tabla 3



Compuesto N°	x <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
3-1	H	H	CH <sub>3</sub>	CH
3-2	H	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH
3-3	H	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
3-4	H	H	COCH <sub>3</sub>	CH
3-5	H	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
3-6	H	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
3-7	F	H	CH <sub>3</sub>	CH
3-8	F	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH
3-9	F	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
3-10	F	H	COCH <sub>3</sub>	CH
3-11	F	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
3-12	F	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
3-13	F	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
3-14	F	H	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH
3-15	F	H	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
3-16	F	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	CH
3-17	F	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
3-18	F	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	CH
3-19	Cl	H	CH <sub>3</sub>	CH
3-20	Cl	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH
3-21	Cl	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
3-22	Cl	H	COCH <sub>3</sub>	CH
3-23	Cl	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
3-24	Cl	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
3-25	Cl	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
3-26	Cl	H	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH

## ES 2 393 496 T3

(continuación)

Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
3-27	Cl	H	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
3-28	Cl	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	CH
3-29	Cl	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
3-30	Cl	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	CH
3-31	H	H	H	N
3-32	H	H	CH <sub>3</sub>	N
3-33	H	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
3-34	H	H	COCH <sub>3</sub>	N
3-35	H	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
3-36	H	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
3-37	F	H	CH <sub>3</sub>	N
3-38	F	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
3-39	F	H	COCH <sub>3</sub>	N
3-40	F	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
3-41	F	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
3-42	Cl	H	CH <sub>3</sub>	N
3-43	Cl	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
3-44	Cl	H	COCH <sub>3</sub>	N
3-45	Cl	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
3-46	Cl	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
3-47	H	H	H	C-CH <sub>3</sub>
3-48	F	H	H	C-CH <sub>3</sub>
3-49	Cl	H	H	C-CH <sub>3</sub>
3-50	H	4-F	H	CH
3-51	H	5-F	H	CH
3-52	H	3-Cl	H	CH
3-53	H	4-Cl	H	CH
3-54	H	5-Cl	H	CH
3-55	H	3,5-F <sub>2</sub>	H	CH
3-56	H	3,5-Cl	H	CH
3-57	H	4,5-F <sub>2</sub>	H	CH
3-58	H	4,5-Cl <sub>2</sub>	H	CH
3-59	H	3-CH <sub>3</sub>	H	CH
3-60	H	4-CH <sub>3</sub>	H	CH

## ES 2 393 496 T3

(continuación)

Compuesto N <sup>o</sup>	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
3-61	H	5-CH <sub>3</sub>	H	CH
3-62	H	3-CF <sub>3</sub>	H	CH
3-63	H	4-CF <sub>3</sub>	H	CH
3-64	H	5-CF <sub>3</sub>	H	CH
3-65	H	3-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	CH
3-66	H	4-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	CH
3-67	H	5-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	CH
3-68	H	3-OCH <sub>3</sub>	H	CH
3-69	H	4-OCH <sub>3</sub>	H	CH
3-70	H	5-OCH <sub>3</sub>	H	CH
3-71	H	3-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
3-72	H	4-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
3-73	H	5-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
3-74	H	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
3-75	H	5-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
3-76	H	3-SCF <sub>3</sub>	H	CH
3-77	H	4-SCF <sub>3</sub>	H	CH
3-78	H	5-SCF <sub>3</sub>	H	CH
3-79	H	3-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
3-80	H	4-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
3-81	H	5-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
3-82	H	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
3-83	H	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
3-84	H	5-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
3-85	H	3-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH
3-86	H	4-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH
3-87	H	5-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH
3-88	H	3-NO <sub>2</sub>	H	CH
3-89	H	4-NO <sub>2</sub>	H	CH
3-90	H	5-NO <sub>2</sub>	H	CH
3-91	H	3-CN	H	CH
3-92	H	4-CN	H	CH
3-93	H	5-CN	H	CH
3-94	H	3-COCH <sub>3</sub>	H	CH

## ES 2 393 496 T3

(continuación)

Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
3-95	H	4-COCH <sub>3</sub>	H	CH
3-96	H	5-COCH <sub>3</sub>	H	CH
3-97	F	3-F	H	CH
3-98	F	4-F	H	CH
3-99	F	5-F	H	CH
3-100	F	3-Cl	H	CH
3-101	F	4-Cl	H	CH
3-102	F	5-Cl	H	CH
3-103	F	3-CH <sub>3</sub>	H	CH
3-104	F	4-CH <sub>3</sub>	H	CH
3-105	F	5-CH <sub>3</sub>	H	CH
3-106	F	3-OCH <sub>3</sub>	H	CH
3-107	F	4-OCH <sub>3</sub>	H	CH
3-108	F	5-OCH <sub>3</sub>	H	CH
3-109	F	4-CN	H	CH
3-110	F	3,4-F <sub>2</sub>	H	CH
3-111	F	4,5-F <sub>2</sub>	H	CH
3-112	F	4-F-3-Cl	H	CH
3-113	F	3-F-5-Cl	H	CH
3-114	F	5-F-4-CN	H	CH
3-115	F	3-F-4-CF <sub>3</sub>	H	CH
3-116	F	3-CF <sub>3</sub>	H	CH
3-117	F	5-CF <sub>3</sub>	H	CH
3-118	F	4-Br	H	CH
3-119	F	5-OCF <sub>3</sub> -4-F	H	CH
3-120	Cl	3-F	H	CH
3-121	Cl	4-F	H	CH
3-122	Cl	5-F	H	CH
3-123	Cl	3-Cl	H	CH
3-124	Cl	4-Cl	H	CH
3-125	Cl	5-Cl	H	CH
3-126	Cl	3-CH <sub>3</sub>	H	CH
3-127	Cl	4-CH <sub>3</sub>	H	CH
3-128	Cl	5-CH <sub>3</sub>	H	CH

## ES 2 393 496 T3

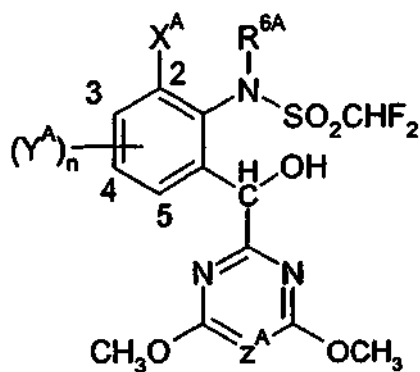
(continuación)

Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
3-129	Cl	3-OCH <sub>3</sub>	H	CH
3-130	Cl	4-OCH <sub>3</sub>	H	CH
3-131	Cl	5-OCH <sub>3</sub>	H	CH
3-132	Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
3-133	Cl	3-SCF <sub>3</sub>	H	CH
3-134	Cl	4-SCF <sub>3</sub>	H	CH
3-135	Cl	5-SCF <sub>3</sub>	H	CH
3-136	Cl	3-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
3-137	Cl	4-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
3-138	Cl	5-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
3-139	Cl	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
3-140	Cl	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
3-141	Cl	5-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
3-142	Cl	4-CN	H	CH
3-143	Cl	3,4-Cl <sub>2</sub>	H	CH
3-144	Cl	4,5-Cl <sub>2</sub>	H	CH
3-145	Cl	3-Cl-4-CF <sub>3</sub>	H	CH
3-146	Cl	4-C-3-CH <sub>3</sub>	H	CH
3-147	Cl	5-OCF <sub>3</sub> -4-F	H	CH
3-148	Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
3-149	Cl	4-CF <sub>3</sub>	H	CH
3-150	Cl	5-CF <sub>3</sub>	H	CH
3-151	CHO	H	H	CH
3-152	COCH <sub>3</sub>	H	H	CH
3-153	COcPr	H	H	CH
3-154	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
3-155	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
3-156	CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	CH
3-157	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	CH
3-158	OCH <sub>3</sub>	H	H	CH
3-159	OCF <sub>3</sub>	H	H	CH
3-160	OCHF <sub>2</sub>	H	H	CH
3-161	OPh	H	H	CH
3-162	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH

(continuación)

Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
3-163	SCF <sub>3</sub>	H	H	CH
3-164	SOCF <sub>3</sub>	H	H	CH
3-165	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CH
3-166	CN	H	H	CH
3-167	NO <sub>2</sub>	H	H	CH
3-168	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
3-169	OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CH
3-170	OSO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	CH
3-171	OSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	H	H	CH
3-172	OSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CH
3-173	OSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	H	H	CH
3-174	COCH <sub>3</sub>	H	H	N
3-175	COcPr	H	H	N
3-176	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	N
3-177	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	N

Tabla 4



5

Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
4-1	H	H	CH <sub>3</sub>	CH
4-2	H	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH
4-3	H	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
4-4	H	H	COCH <sub>3</sub>	CH
4-5	H	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
4-6	H	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
4-7	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH



## ES 2 393 496 T3

(continuación)

Compuesto N°	x <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	z <sup>A</sup>
4-8	H	H	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH
4-9	H	H	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
4-10	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	CH
4-11	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
4-12	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	CH
4-13	F	H	CH <sub>3</sub>	CH
4-14	F	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH
4-15	F	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
4-16	F	H	COCH <sub>3</sub>	CH
4-17	F	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
4-18	F	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
4-19	F	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
4-20	F	H	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH
4-21	F	H	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
4-22	F	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C	CH
4-23	F	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
4-24	F	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	CH
4-25	Cl	H	CH <sub>3</sub>	CH
4-26	Cl	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH
4-27	Cl	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
4-28	Cl	H	COCH <sub>3</sub>	CH
4-29	Cl	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
4-30	Cl	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
4-31	Cl	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH
4-32	Cl	H	SO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH
4-33	Cl	H	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
4-34	Cl	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	CH
4-35	Cl	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
4-36	Cl	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	CH
4-37	H	H	H	N
4-38	H	H	CH <sub>3</sub>	N
4-39	H	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
4-40	H	H	COCH <sub>3</sub>	N
4-41	H	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N

## ES 2 393 496 T3

(continuación)

Compuesto N°	x <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	z <sup>A</sup>
4-42	H	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
4-43	F	H	CH <sub>3</sub>	N
4-44	F	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
4-45	F	H	COCH <sub>3</sub>	N
4-46	F	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
4-47	F	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
4-48	Cl	H	CH <sub>3</sub>	N
4-49	Cl	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
4-50	Cl	H	COCH <sub>3</sub>	N
4-51	Cl	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
4-52	Cl	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N
4-53	H	H	H	C-CH <sub>3</sub>
4-54	F	H	H	C-CH <sub>3</sub>
4-55	Cl	H	H	C-CH <sub>3</sub>
4-56	H	5-Cl	H	CH
4-57	H	3,5-F <sub>2</sub>	H	CH
4-58	H	3,5-Cl	H	CH
4-59	H	4,5-F <sub>2</sub>	H	CH
4-60	H	4,5-Cl <sub>2</sub>	H	CH
4-61	H	3-CH <sub>3</sub>	H	CH
4-62	H	4-CH <sub>3</sub>	H	CH
4-63	H	5-CH <sub>3</sub>	H	CH
4-64	H	3-CF <sub>3</sub>	H	CH
4-65	H	4-CF <sub>3</sub>	H	CH
4-66	H	5-CF <sub>3</sub>	H	CH
4-67	H	3-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	CH
4-68	H	4-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	CH
4-69	H	5-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	CH
4-70	H	3-OCH <sub>3</sub>	H	CH
4-71	H	4-OCH <sub>3</sub>	H	CH
4-72	H	5-OCH <sub>3</sub>	H	CH
4-73	H	3-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
4-74	H	4-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
4-75	H	5-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH

## ES 2 393 496 T3

(continuación)

Compuesto N°	x <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	z <sup>A</sup>
4-76	H	3-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
4-77	H	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
4-78	H	5-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
4-79	H	3-SCF <sub>3</sub>	H	CH
4-80	H	4-SCF <sub>3</sub>	H	CH
4-81	H	5-SCF <sub>3</sub>	H	CH
4-82	H	3-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
4-83	H	4-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
4-84	H	5-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
4-85	H	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
4-86	H	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
4-87	H	5-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
4-88	H	3-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH
4-89	H	4-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH
4-90	H	5-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH
4-91	H	3-NO <sub>2</sub>	H	CH
4-92	H	4-NO <sub>2</sub>	H	CH
4-93	H	5-NO <sub>2</sub>	H	CH
4-94	H	3-CN	H	CH
4-95	H	4-CN	H	CH
4-96	H	5-CN	H	CH
4-97	H	3-COCH <sub>3</sub>	H	CH
4-98	H	4-COCH <sub>3</sub>	H	CH
4-99	H	5-COCH <sub>3</sub>	H	CH
4-100	F	3-F	H	CH
4-101	F	4-F	H	CH
4-102	F	5-F	H	CH
4-103	F	3-Cl	H	CH
4-104	F	4-Cl	H	CH
4-105	F	5-Cl	H	CH
4-106	F	3-CH <sub>3</sub>	H	CH
4-107	F	4-CH <sub>3</sub>	H	CH
4-108	F	5-CH <sub>3</sub>	H	CH
4-109	F	3-OCH <sub>3</sub>	H	CH

## ES 2 393 496 T3

(continuación)

Compuesto N°	x <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	z <sup>A</sup>
4-110	F	4-OCH <sub>3</sub>	H	CH
4-111	F	5-OCH <sub>3</sub>	H	CH
4-112	F	4-CN	H	CH
4-113	F	3,4-F <sub>2</sub>	H	CH
4-114	F	4,5-F <sub>2</sub>	H	CH
4-115	F	4-F-3-Cl	H	CH
4-116	F	3-F-5-Cl	H	CHO
4-117	F	5-F-4-CN	H	CH
4-118	F	3-F-4-CF <sub>3</sub>	H	CH
4-119	F	3-CF <sub>3</sub>	H	CH
4-120	F	5-CF <sub>3</sub>	H	CH
4-121	F	4-Br	H	CH
4-122	F	5-OCF <sub>3</sub> -4-F	H	CH
4-123	Cl	3-F	H	CH
4-124	Cl	4-F	H	CH
4-125	Cl	5-F	H	CH
4-126	Cl	3-Cl	H	CH
4-127	Cl	4-Cl	H	CH
4-128	Cl	5-Cl	H	CH
4-129	Cl	3-CH <sub>3</sub>	H	CH
4-130	Cl	4-CH <sub>3</sub>	H	CH
4-131	Cl	5-CH <sub>3</sub>	H	CH
4-132	Cl	3-OCH <sub>3</sub>	H	CH
4-133	Cl	4-OCH <sub>3</sub>	H	CH
4-134	Cl	5-OCH <sub>3</sub>	H	CH
4-135	Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
4-136	Cl	3-SCF <sub>3</sub>	H	CH
4-137	Cl	4-SCF <sub>3</sub>	H	CH
4-138	Cl	5-SCF <sub>3</sub>	H	CH
4-139	Cl	3-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
4-140	Cl	4-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
4-141	Cl	5-SOCF <sub>3</sub>	H	CH
4-142	Cl	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
4-143	Cl	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH

## ES 2 393 496 T3

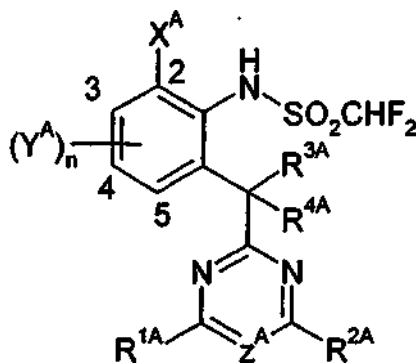
(continuación)

Compuesto N°	x <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	z <sup>A</sup>
4-144	Cl	5-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
4-145	Cl	4-CN	H	CH
4-146	Cl	3,4-Cl <sub>2</sub>	H	CH
4-147	Cl	4,5-Cl <sub>2</sub>	H	CH
4-148	Cl	3-Cl-4-CF <sub>3</sub>	H	CH
4-149	Cl	4-Cl-3-CH <sub>3</sub>	H	CH
4-150	Cl	5-OCF <sub>3</sub> -4-F	H	CH
4-151	Cl	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
4-152	Cl	4-CF <sub>3</sub>	H	CH
4-153	Cl	5-CF <sub>3</sub>	H	CH
4-154	CHO	H	H	CH
4-155	COCH <sub>3</sub>	H	H	CH
4-156	COcPr	H	H	CH
4-157	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
4-158	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
4-159	CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	CH
4-160	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	CH
4-161	OCH <sub>3</sub>	H	H	CH
4-162	OCF <sub>3</sub>	H	H	CH
4-163	OCHF <sub>2</sub>	H	H	CH
4-164	OPh	H	H	CH
4-165	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
4-166	SCF <sub>3</sub>	H	H	CH
4-167	SOCF <sub>3</sub>	H	H	CH
4-168	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CH
4-169	CN	H	H	CH
4-170	NO <sub>2</sub>	H	H	CH
4-171	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
4-172	OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CH
4-173	OSO <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	CH
4-174	OSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	H	H	CH
4-175	OSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CH
4-176	OSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	H	H	CH

(continuación)

Compuesto N°	x <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
4-177	COCH <sub>3</sub>	H	H	N
4-178	COcPr	H	H	N
4-179	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	N
4-180	CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	N
4-181	H	4-F	H	CH
4-182	H	3-F-4-CH <sub>3</sub>	H	CH
4-183	H	5-F-4-CH <sub>3</sub>	H	CH
4-184	CH <sub>3</sub>	3-F	H	CH
4-185	H	5-F	H	CH
4-186	H	3-F	H	CH
4-187	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub>	H	CH

Tabla 5



5

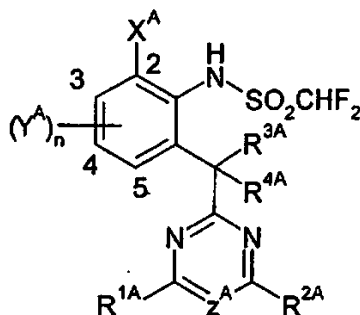
Compuesto N°	x <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>3A</sup>	R <sup>4A</sup>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
5-1	H	H	Cl	H	H	CH
5-2	F	H	Cl	H	H	CH
5-3	Cl	H	Cl	H	H	CH
5-4	COCH <sub>3</sub>	H	Cl	H	H	CH
5-5	H	H	Cl	H	H	N
5-6	F	H	Cl	H	H	N
5-7	Cl	H	Cl	H	H	N
5-8	H	H	F	H	H	CH
5-9	F	H	F	H	H	CH
5-10	Cl	H	F	H	H	CH
5-11	COCH <sub>3</sub>	H	F	H	H	CH
5-12	H	H	F	H	H	N

## ES 2 393 496 T3

(continuación)

Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>3A</sup>	R <sup>4A</sup>	R <sup>6A</sup>	Z <sup>A</sup>
5-13	F	H	F.		H	N
5-14	Cl	H	F	H	H	N
5-15	H	H	OCH <sub>3</sub>	H	H	CH
5-16	F	H	OCH <sub>3</sub>	H	H	CH
5-17	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	H	H	CH
5-18	H	H	CH <sub>3</sub>	H	H	CH
5-19	F	H	CH <sub>3</sub>	H	H	CH
5-20	Cl	H	CH <sub>3</sub>	H	H	CH
5-21	H	H	OH	CH <sub>3</sub>	H	CH
5-22	H	H	OH	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
5-23	H	H	OH	iPr	H	CH
5-24	F	H	OH	CH <sub>3</sub>	H	CH
5-25	F	H	OH	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
5-26	F	H	OH	iPr	H	CH
5-27	Cl	H	OH	CH <sub>3</sub>	H	CH
5-28	Cl	H	OH	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
5-29	Cl	H	OH	iPr	H	CH
5-30	H	H	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH
5-31	F	H	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH
5-32	Cl	H	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH
5-33	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
5-34	F	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
5-35	Cl	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
5-36	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	N
5-37	F	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	N
5-38	Cl	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	N

Tabla 6



Compuesto N <sup>o</sup>	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>1A</sup>	R <sup>2A</sup>	R <sup>3A</sup>	R <sup>4A</sup>	Z <sup>A</sup>
6-1	H	H	H	H	H	H	CH
6-2	H	H	H	Cl	H	H	CH
6-3	H	H	H	CH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-4	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	CH
6-5	H	H	H	OCH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-6	H	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-7	H	H	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CH
6-8	H	H	H	SCH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-9	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	H	H	CH
6-10	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-11	H	H	CH <sub>3</sub>	iPr	H	H	CH
6-12	H	H	CH <sub>3</sub>	cicloPr	H	H	CH
6-13	H	H	CH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	H	H	CH
6-14	H	H	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	CH
6-15	H	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-16	H	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-17	H	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CH
6-18	H	H	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-19	H	H	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	H	CH
6-20	H	H	OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	CH
6-21	H	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-22	H	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CH
6-23	H	H	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-24	H	H	CF <sub>3</sub>	Cl	H	H	CH
6-25	H	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	CH
6-26	H	H	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-27	H	H	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CH



ES 2 393 496 T3

(continuación)

Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>1A</sup>	R <sup>2A</sup>	R <sup>3A</sup>	R <sup>4A</sup>	Z <sup>A</sup>
6-28	H	H	CF <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-29	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	H	H	CH
6-30	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-31	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-32	H	H	SCH <sub>3</sub>	H	H	H	CH
6-33	H	H	SCH <sub>3</sub>	Cl	H	H	CH
6-34	F	H	CH <sub>3</sub>	Cl	H	H	CH
6-35	F	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-36	F	H	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	CH
6-37	F	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-38	F	H	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-39	F	H	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	H	CH
6-40	F	H	OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	CH
6-41	F	H	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-42	F	H	CF <sub>3</sub>	Cl	H	H	CH
6-43	F	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	CH
6-44	F	H	CF <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-45	F	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	H	H	CH
6-46	F	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-47	F	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-48	F	H	SCH <sub>3</sub>	Cl	H	H	CH
6-49	F	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	CH
6-50	Cl	H	CH <sub>3</sub>	Cl	H	H	CH
6-51	Cl	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-52	Cl	H	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	CH
6-53	Cl	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-54	Cl	H	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-55	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	H	CH
6-56	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	CH
6-57	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-58	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CH
6-59	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-60	Cl	H	CF <sub>3</sub>	Cl	H	H	CH
6-61	Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	CH

(continuación)

Compuesto Nº	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>1A</sup>	R <sup>2A</sup>	R <sup>3A</sup>	R <sup>4A</sup>	Z <sup>A</sup>
6-62	Cl	H	CF <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-63	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	H	H	CH
6-64	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-65	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	H	CH
6-66	Cl	H	SCH <sub>3</sub>	Cl	H	H	CH
6-67	Cl	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	CH
6-68	F	H	CH <sub>3</sub>	Cl		C=O	CH
6-69	F	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>		C=O	CH
6-70	F	H	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>		C=O	CH
6-71	F	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>		C=O	CH
6-72	F	H	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>		C=O	CH
6-73	F	H	OCH <sub>3</sub>	Cl		C=O	CH
6-74	F	H	OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>		C=O	CH
6-75	F	H	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>		C=O	CH
6-76	F	H	CF <sub>3</sub>	Cl		C=O	CH
6-77	F	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>		C=O	CH
6-78	F	H	CF <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>		C=O	CH
6-79	F	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl		C=O	CH
6-80	F	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		C=O	CH
6-81	F	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>		C=O	CH
6-82	F	H	SCH <sub>3</sub>	Cl		C=O	CH
6-83	F	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		C=O	CH
6-84	Cl	H	CH <sub>3</sub>	Cl		C=O	CH
6-85	Cl	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>		C=O	CH
6-86	Cl	H	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>		C=O	CH
6-87	Cl	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>		C=O	CH
6-88	Cl	H	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>		C=O	CH
6-89	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	Cl		C=O	CH
6-90	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>		C=O	CH
6-91	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		C=O	CH
6-92	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		C=O	CH
6-93	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>		C=O	CH
6-94	Cl	H	CF <sub>3</sub>	Cl		C=O	CH
6-95	Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>		C=O	CH

ES 2 393 496 T3

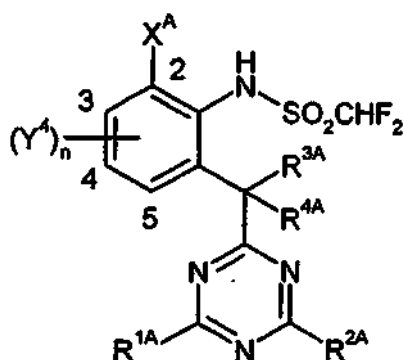
(continuación)

Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>1A</sup>	R <sup>2A</sup>	R <sup>3A</sup>	R <sup>4A</sup>	Z <sup>A</sup>
6-96	Cl	H	CF <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>		C=O	CH
6-97	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl		C=O	CH
6-98	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		C=O	CH
6-99	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>		C=O	CH
6-100	Cl	H	SCH <sub>3</sub>	Cl		C=O	CH
6-101	Cl	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		C=O	CH
6-102	F	H	CH <sub>3</sub>	Cl	OH	H	CH
6-103	F	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OH	H	CH
6-104	F	H	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OH	H	CH
6-105	F	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OH	H	CH
6-106	F	H	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	OH	H	CH
6-107	F	H	OCH <sub>3</sub>	Cl	OH	H	CH
6-108	F	H	OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OH	H	CH
6-109	F	H	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	OH	H	CH
6-110	F	H	CF <sub>3</sub>	Cl	OH	H	CH
6-111	F	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OH	H	CH
6-112	F	H	CF <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	OH	H	CH
6-113	F	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	OH	H	CH
6-114	F	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	H	CH
6-115	F	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	OH	H	CH
6-116	F	H	SCH <sub>3</sub>	Cl	OH	H	CH
6-117	F	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH	H	CH
6-118	Cl	H	CH <sub>3</sub>	Cl	OH	H	CH
6-119	Cl	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OH	H	CH
6-120	Cl	H	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OH	H	CH
6-121	Cl	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OH	H	CH
6-122	Cl	H	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	OH	H	CH
6-123	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	Cl	OH	H	CH
6-124	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OH	H	CH
6-125	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	H	CH
6-126	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OH	H	CH
6-127	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	OH	H	CH
6-128	Cl	H	CF <sub>3</sub>	Cl	OH	H	CH
6-129	Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OH	H	CH

(continuación)

Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>1A</sup>	R <sup>2A</sup>	R <sup>3A</sup>	R <sup>4A</sup>	Z <sup>A</sup>
6-130	Cl	H	CF <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	OH	H	CH
6-131	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	OH	H	CH
6-132	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	H	CH
6-133	Cl	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	OH	H	CH
6-134	Cl	H	SCH <sub>3</sub>	Cl	OH	H	CH
6-135	Cl	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH	H	CH

Tabla 7



Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>1A</sup>	R <sup>2A</sup>	R <sup>3A</sup>	R <sup>4A</sup>
7-1	F	H	H	H	H	H
7-2	F	H	CH <sub>3</sub>	Cl	H	H
7-3	F	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H
7-4	F	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H
7-5	F	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H
7-6	F	H	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	H
7-7	F	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H
7-8	F	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H
7-9	F	H	H	H		C=O
7-10	F	H	CH <sub>3</sub>	Cl		C=O
7-11	F	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>		C=O
7-12	F	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>		C=O
7-13	F	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		C=O
7-14	F	H	OCH <sub>3</sub>	Cl		C=O
7-15	F	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		C=O
7-16	F	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		C=O
7-17	F	H	H	H	OH	H
7-18	F	H	CH <sub>3</sub>	Cl	OH	H

ES 2 393 496 T3

(continuación)

Compuesto N°	X <sup>A</sup>	(Y <sup>A</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>1A</sup>	R <sup>2A</sup>	R <sup>3A</sup>	R <sup>4A</sup>
7-19	F	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH	H
7-20	F	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OH	H
7-21	F	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OH	H
7-22	F	H	OCH <sub>3</sub>	Cl	OH	H
7-23	F	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OH	H
7-24	F	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH	H
7-25	Cl	H	H	H	H	H
7-26	Cl	H	CH <sub>3</sub>	Cl	H	H
7-27	Cl	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H
7-28	Cl	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H
7-29	Cl	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H
7-30	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	H
7-31	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H
7-32	Cl	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H
7-33	Cl	H	H	H		C=O
7-34	Cl	H	CH <sub>3</sub>	Cl		C=O
7-35	Cl	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>		C=O
7-36	Cl	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>		C=O
7-37	Cl	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		C=O
7-38	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	Cl		C=O
7-39	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		C=O
7-40	Cl	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		C=O
7-41	Cl	H	H	H	OH	H
7-42	Cl	H	CH <sub>3</sub>	Cl	OH	H
7-43	Cl	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OH	H
7-44	Cl	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OH	H
7-45	Cl	H	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OH	H
7-46	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	Cl	OH	H
7-47	Cl	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OH	H
7-48	Cl	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH	H

# ES 2 393 496 T3

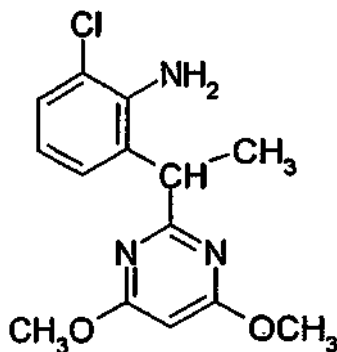
Tabla 8

Compuesto N°	Propiedades Físicas y Químicas (pf (°C), n <sub>D</sub> <sup>20</sup> o <sup>1</sup> H RMN (300 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ)
1-14	2,07 (3 H, s), 3,98 (6 H, s), 5,30 (1 H, s), 5,95 (1 H, s), 6,62 (1 H, t), 7,09-7,16 (1 H, m), 7,20-7,25 (1 H, m), 7,45-7,47 (1 H, m)
1-27	2,07 (3 H, s), 3,94 (6 H, s), 5,63 (1 H, s), 5,90 (1 H, s), 6,76 (1 H, t), 7,26-7,31 (1 H, m), 7,38-7,41 (1 H, m), 7,90-7,93 (1 H, m), 9,97 (1 H, a)
1-46	2,08 (3 H, s), 4,10 (6 H, s), 5,31 (1 H, s), 6,63 (1 H, t), 7,15-7,73 (3 H), 9,75 (1 H, a)
1-64	2,04 (3 H, s), 3,98 (6 H, s), 5,25 (1 H, s), 5,94 (1 H, s), 6,45 (1 H, t), 7,24 (1 H, m), 7,64 (2 H, m), 11,04 (1 H, sa)
1-65	2,04 (3 H, s), 3,93 (6 H, s), 5,26 (1 H, s), 5,94 (1 H, s), 6,42 (1 H, t), 7,28 (1 H, m), 7,55 (1 H, m), 7,76 (1 H, m), 10,91 (1 H, sa)
1-72	2,02 (3 H, s), 2,34 (3 H, s), 3,98 (6 H, s), 5,26 (1 H, s a), 5,92 (1 H, s a), 6,41 (1 H, t, J = 54 Hz), 7,10-7,30 (1 H, m), 7,50 (2 H, m), 10,8 (1 H, s a)
1-112	2,17 (3 H, s), 4,00 (6 H, s), 5,60 (1 H, s), 6,00 (1 H, s), 6,62 (1 H, t), 6,95-7,03 (1 H, m), 7,07-7,15 (1 H, m), 11,73 (1 H, a)
1-117	2,08 (3 H, s), 2,35 (3 H, s), 3,98 (6 H, s), 5,26 (1 H, s), 5,95 (1 H, s), 6,58 (1 H, t, J = 54 Hz), 6,94 (1 H, da, J = 11 Hz), 7,26 (1 H, s), 10,7 (1 H, s a)
2-1	100-104
2-14	3,34 (3 H, s), 3,88 (6 H, s), 4,09 (1 H, d, J=15 Hz), 4,40 (1 H, d, J=15 Hz), 5,88 (1 H, s), 6,40 (1 H, t), 7,03-7,09 (1 H, m), 7,27-7,34 (2 H, m)
2-18	1,94 (3 H, s), 3,87 (6 H, s), 4,10 (1 H, d, J=15 Hz), 4,30 (1 H, d, J=15 Hz), 5,89 (1 H, s), 6,97 (1 H, t), 7,14-7,17 (1 H, m), 7,33-7,45 (2 H, m)
2-31	1,91 (3 H, s), 3,86 (6 H, s), 4,33 (2 H, s), 5,90 (1 H, s), 7,05 (1 H, t), 7,35-7,48 (3 H, m)
2-32	3,38 (3 H, m), 3,88 (6 H, s), 4,12 (1 H, d), 4,34 (1 H, d), 5,89 (1 H, s), 6,58 (1 H, t), 7,28-7,44 (3 H, m)
2-40	4,06 (6 H, s), 4,14 (2 H, s), 6,33 (1 H, t), 7,20 (1 H), 7,31 (1 H), 7,36 (1 H), 7,60 (1 H), 10,75 (1 H, s)
2-46	3,27 (3 H, s), 4,06-4,14 (8 H), 6,21 (1 H, t), 7,39 (1 H), 7,64 (1 H), 7,66 (1 H)
2-61	76-80
2-62	78-81
2-63	98-100
2-64	4,11 (6 H, s), 4,47 (2 H, s), 6,43 (1 H, s), 6,82 (1 H, t), 7,25 (1 H, m), 7,52 (2 H, m)
2-65	3,97 (6 H, s), 4,13 (2 H, s), 5,93 (1 H, s), 6,32 (1 H, t), 7,22-7,54 (3 H, m), 11,36 (1 H, sa)
2-66	3,97 (6 H, m), 4,43 (2 H, s), 5,94 (1 H, s), 6,33 (1 H, t), 7,16-7,54 (3 H, m), 11,50 (1 H, sa)
2-67	106-109
2-68	3,94 (6 H, s), 4,37 (2 H, s), 5,95 (1 H, s), 6,35 (1 H, t), 7,31 (1 H, s), 7,55 (1 H, s), 11,63 (1 H, sa)
2-71	106-109
2-72	116-117
2-73	106-109
2-110	3,96 (6 H, s), 4,20 (2 H, s), 5,94 (1 H, s), 6,56 (1 H, t), 6,95-7,20 (2 H, m)
2-111	3,96 (6 H, s), 4,23 (2 H, s), 5,95 (1 H, s), 6,51 (1 H, t), 6,85 (1 H, m), 6,98 (1 H, m)
2-112	3,96 (6 H, s), 4,31 (2 H, s), 5,95 (1 H, s), 6,76 (1 H, t), 6,95-7,1 (2 H, m), 11,24 (1 H, a)
2-114	3,96 (6 H, s), 4,21 (2 H, s), 5,95 (1 H, s), 6,53 (1 H, t), 7,10-7,23 (2 H, m), 11,1 (1 H, sa)
2-115	3,96 (6 H), 4,48 (2 H, s), 5,95 (1 H, s), 7,03 (1 H), 7,30 (1 H), 11,25 (1 H, s)
2-117	145-149
2-118	131-133
2-124	121-122
2-125	111-115
2-131	137-140
2-136	3,95 (6 H, s), 4,28 (2 H, s), 5,94 (1 H, s), 6,70 (1 H, t), 7,29 (1 H, d), 7,37 (1 H, d), 11,25 (1 H, a)
2-137	3,95 (6 H, s), 4,26 (2 H, s), 5,95 (1 H, s), 6,67 (1 H, t), 7,35 (1 H, d), 7,40 (1 H, d), 11,03 (1 H, s)
2-138	3,95 (6 H, s), 4,56 (2 H, s), 5,95 (1 H, s), 6,72 (1 H, t), 7,31-7,32 (2 H, m), 11,23 (1 H, a)
2-140	132-136
2-164	3,99 (6 H, s), 4,33 (2 H, s), 5,97 (1 H, s), 6,46 (1 H, t), 7,41 (1 H, t), 7,67 (1 H, dd), 7,91 (1 H, dd), 10,31 (1 H, s)
2-167	3,91 (6 H, s), 4,37 (2 H, s), 5,99 (1 H, s), 6,91 (1 H, t), 7,41 (1 H, t), 7,66 (1 H, dd), 7,87 (1 H, dd)
2-168	3,92 (3 H, s), 3,96 (6 H, s), 4,28 (2 H, s), 5,93 (1 H, s), 6,46 (1 H, t), 7,26-7,31 (1 H, m), 7,54-7,56 (1 H, m), 7,75-7,78 (1 H, m), 11,27 (1 H, a)

# ES 2 393 496 T3

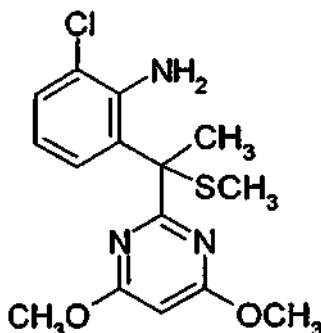
(continuación)

Compuesto N°	Propiedades Físicas y Químicas (pf (°C), nD20 o 1H RMN (300 MHz, CDCl3) δ)
2-173	3,95 (6 H, s), 4,30 (2 H, s), 5,94 (1 H, s), 6,55 (1 H, t), 7,25-7,29 (2 H), 7,37 (1 H), 11,15 (1 H, s)
2-190	120-124
2-191	0,48-0,55 (1 H, m), 0,78-0,86 (1 H, m), 0,99-1,08 (3 H, m), 3,85 (6 H, s), 4,14 (1 H, d), 4,39 (1 H, d), 5,87 (1 H, s), 7,05 (1 H, t), 7,36-7,52 (3 H, m)
2-192	1,519
2-193	2,38 (3 H, s a), 3,95 (6 H, s), 4,22 (2 H, s), 5,91 (1 H, s), 6,36 (1 H, t, J = 54 Hz), 6,94 (1 H, dd, J = 8,6, 8,6 Hz), 7,20 (1 H, dd, J = 8,6, 6,2 Hz), 11,2 (1 H, s a)
3-19	3,37 (3 H, s), 3,94 (6 H, s), 6,18 (1 H, s), 6,25 (1 H, t), 7,43 (1 H, t), 7,61 (1 H, dd), 7,67 (1 H, dd)
3-22	2,91 (3 H, s), 3,93 (6 H, s), 6,20 (1 H, s), 6,77 (1 H, t), 7,53 (1 H, t), 7,62 (1 H, dd), 7,78 (1 H, dd)
3-31	4,11 (6 H, s) 6,35 (1 H, t) 7,21 (1 H) 7,60-7,67 (2 H) 7,87 (1 H) 11,14 (1 H, s)
3-37	3,27 (3 H, s), 4,12 (6 H, s), 6,20 (1 H, s), 7,27 (1 H), 7,53 (1 H), 7,65 (1 H)
3-98	3,86 (6 H, s), 5,89 (1 H, t), 6,15 (1 H, s), 6,98-7,08 (2 H, m) (en CD <sub>3</sub> CN)
4-37	4,07 (6 H, s) 4,62 (1 H, s) 6,00 (1 H, s) 6,32 (1 H, t) 7,26-7,35 (2 H) 7,61(1 H) 7,67(1 H) 10,19(1 H, s)
4-57	3,95 (6 H, s), 6,01 (1 H, s), 6,11 (1 H, s), 6,29 (1 H, t, J = 54 Hz), 6,81 - 6,85 (2 H, m)
4-59	4,01 (6 H, s), 5,95 (1 H, s), 6,02 (1 H, s), 6,32 (1 H, t, J = 54 Hz), 7,43 - 7,57 (2 H, m)
4-61	100-103
4-63	2,57 (3 H, s), 3,92 (6 H, s), 5,95 (1 H, s), 6,20 (1 H, t, J = 54 Hz), 7,03 (1 H, d, J = 7,0 Hz), 7,17 (1 H, dd, J = 7,7, 7,0 Hz), 7,39 (1 H, d, J = 7,7 Hz)
4-101	4,01 (6 H, s), 5,00 (1 H, s), 6,03 (1 H, s), 6,12 (1 H, sa), 6,53 (1 H, t), 6,87 (1 H, m), 7,30 (1 H, m)
4-107	2,34 (3 H, s), 4,00 (6 H, s), 4,93 (1 H, s a), 5,99 (1 H, s), 6,10 (1 H, s), 6,57 (1 H, t, J = 54 Hz), 6,92 (1 H, da, J = 11 Hz), 7,32 (1 H, s a), 10,4 (1 H, s a)
4-130	182-183
4-184	2,39 (3 H, s), 3,97 (6 H, s), 4,90 (1 H, s a), 5,94 (1 H, s), 6,17 (1 H, s a), 6,39 (1 H, t, J = 54 Hz), 7,02 (1 H, dd, J = 9,0, 9,0 Hz), 7,54 (1 H, dd, J = 9,0, 6,0 Hz), 10,6 (1 H, s a)
4-186	96-99
4-187	1,5543
5-2	4,01 (6 H, s), 6,01 (1 H, s), 6,04 (1 H, s), 6,63 (1 H, t), 7,16-7,37 (3 H, m), 11,09 (1 H, a)
5-3	3,98 (6 H, s), 5,97 (1 H, s), 6,37 (1 H, s), 6,78 (1 H, t), 7,31 (1 H, t), 7,47 (1 H, dd), 7,75 (1 H, dd), 9,66 (1 H, a)
5-31	1,73 (3 H, s), 2,09 (3 H, s), 3,84 (6 H, s), 5,96 (1 H, s), 6,49 (1 H, t), 7,14-7,32 (3 H, m), 8,26 (1 H, sa)
5-33	3,13 (3 H, s) 3,97 (6 H, s) 5,92 (1 H, s) 6,08 (1 H, s) 6,41 (1 H, t) 7,30 (1 H) 7,43 (1 H) 7,69-7,75 (2 H) 8,65 (1 H, s)
6-35	141-143
6-51	119-123
6-103	109-119

Ejemplo de Referencia 1 (Preparación de un intermedio)

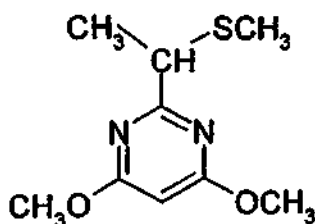
5 A una solución de 2-{1-metil-1-(2-amino-3-clorofenil)etil}-4,6-dimetoxipirimidina 3 g (8,8 mmol) en 100 ml de metanol, se le añadió cloruro de níquel (II) hexahidrato 4,2 g (17,7 mmol) a 0 °C y la mezcla se agitó durante 30 minutos. Después, a la misma temperatura, se añadió borohidruro sódico 1,35 g (35 mmol) poco a poco a la misma. La solución se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora y después el disolvente se retiró por destilación. Se añadió ácido clorhídrico 2 N al residuo y después se añadió amoniaco acuoso al 28% y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con una solución acuosa de hidróxido sódico y el disolvente se retiró por destilación. Después de lavar con hexano, los cristales depositados se filtraron obteniendo 2-{1-(2-amino-3-clorofenil)etil}-4,6-dimetoxipirimidina 2,12 g (82%).

10  $^1\text{H}$  RMN (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1,71 (3 H, d) 3,90 (6 H, s) 4,3 (1 H, c) 5,09 (1 H, sa) 5,85 (1 H, s) 6,67 (1 H, m) 7,25 (2 H, m).

Ejemplo de Referencia 2 (Preparación de un intermedio)

15 Se disolvió 2-cloroanilina 7 g (32,7 mmol) en diclorometano 100 ml y la solución se enfrió a -65 °C. A la solución se le añadió gota a gota una solución de hipoclorito de t-butilo 3,55 g (32,7 mmol) en diclorometano 10 ml y la solución se agitó a la misma temperatura durante 10 minutos. Después, una solución de 2-(1-metil-1-etil)4,6-dimetoxipirimidina en diclorometano se añadió a la misma gota a gota y la solución se agitó a la misma temperatura durante 1 hora. Después de que una solución en metanol de metóxido sódico 12,6 g (65,3 mmol) se hubiera añadido gota a gota y la solución mixta se hubiera agitado a la misma temperatura durante 10 minutos, la solución de reacción se agitó hasta que alcanzó la temperatura ambiente. La solución de reacción se vertió en agua y se extrajo con diclorometano. El disolvente se retiró por destilación y el residuo se purificó con cromatografía en columna (hexano/acetato de etilo = 5/1) obteniendo 2-{1-metil-1-(2-amino-3-clorofenil)etil}-4,6-dimetoxipirimidina 10,0 g (90%).

25  $^1\text{H}$  RMN (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1,76 (3 H, s) 2,07 (3 H, s) 3,85 (6 H, s) 4,76 (2 H, sa) 5,88 (1 H, s) 6,65 (1 H, m) 7,25 (2 H, m).

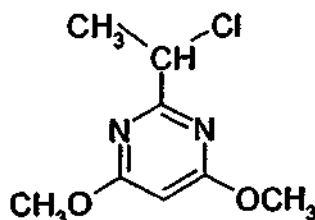
Ejemplo de Referencia 3 (Preparación de un intermedio)



Se disolvió 2-(1-cloroetil)4,6-dimetoxipirimidina 15,5 g (76,5 mmol) en DMF 200 ml y se añadió sal sódica de metilmercaptano 5,4 g (76,5 mmol) a la misma a temperatura ambiente. La solución se agitó a 50 °C durante 1 hora. La solución de reacción se vertió en agua y se extrajo con acetato de etilo. El disolvente se retiró por destilación y el residuo se purificó con cromatografía en columna (hexano/acetato de etilo = 5/1) obteniendo 2-(1-metiltioetil)-4,6-dimetoxipirimidina 14,8 g (90%).

$^1\text{H RMN}$  (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1,66 (3 H, d) 2,15 (3 H, s) 3,9 (1 H, c) 3,94 (6 H, s) 5,9 (1 H, s).

Ejemplo de Referencia 4 (Preparación de un intermedio)

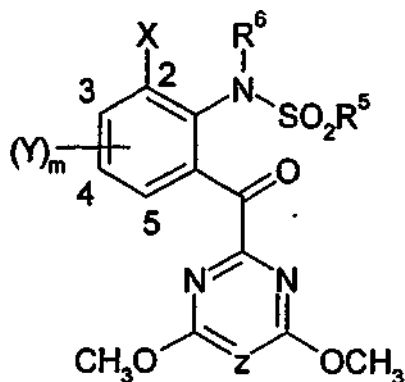


Una solución mixta de una solución acuosa de carbonato potásico (carbonato potásico 109 g, 791 mmol, agua 200 ml) y diclorometano 400 ml se enfrió a -15 °C y se agitó con un agitador mecánico. Se añadió poco a poco diimidato de dimetil malonato 25,7 g (198 mmol) a la misma y la mezcla se agitó durante 1 hora. A la solución a la misma temperatura se le añadió una solución de cloruro de cloropropionilo 21,6 ml (218 mmol) en diclorometano 40 ml gota a gota. La solución se llevó a temperatura ambiente y se agitó durante 3 horas. La solución de reacción se vertió en agua y se extrajo con diclorometano. El disolvente se retiró por destilación y el residuo se purificó con cromatografía en columna (hexano/acetato de etilo = 5/1) obteniendo 2-(1-cloroetil)-4,6-dimetoxipirimidina 15,5 g (39%).

$^1\text{H RMN}$  (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1,87 (3 H, d) 3,97 (6 H, s) 4,98 (1 H, c) 5,94 (1 H, s).

Entonces, los ejemplos de los compuestos de las sulfonamidas fungicidas de la fórmula (I) mencionada anteriormente, que incluyen compuestos conocidos, se muestran en las siguientes Tablas 9-21, y sus propiedades físicas y químicas se muestran en la Tabla 22. Las abreviaturas de cada grupo en las tablas son las mismas que las descritas en las Tablas 1-7 mencionadas anteriormente.

Tabla 9



	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Z
9-1	H	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
9-2	F	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
9-3	Cl	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
9-4	F	4-F	CH <sub>3</sub>	H	CH
9-5	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
9-6	F	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
9-7	Cl	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH

ES 2 393 496 T3

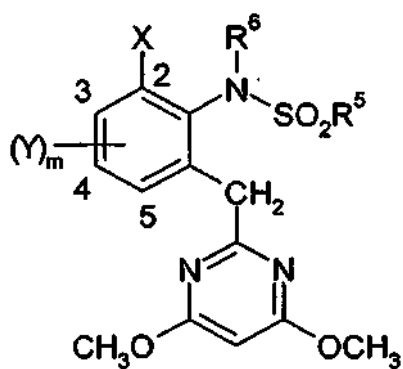
(continuación)

	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Z
9-8	F	4-F	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
9-9	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
9-10	F	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
9-11	Cl	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
9-12	H	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
9-113	F	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
9-14	Cl	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
9-15	F	4-F	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
9-16	H	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
9-17	F	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
9-18	Cl	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
9-19	F	4-F	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
9-20	H	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
9-21	F	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
9-22	Cl	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
9-23	F	4-F	CF <sub>3</sub>	H	CH
9-24	H	H	CHF <sub>2</sub>	H	CH
9-25	F	H	CHF <sub>2</sub>	H	CH
9-26	Cl	H	CHF <sub>2</sub>	H	CH
9-27	H	H	CH <sub>2</sub> Ph	H	CH
9-28	F	H	CH <sub>2</sub> Ph	H	CH
9-29	Cl	H	CH <sub>2</sub> Ph	H	CH
9-30	H	H	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
9-31	F	H	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
9-32	Cl	H	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
9-33	H	H	CH <sub>3</sub>	H	N
9-34	F	H	CH <sub>3</sub>	H	N
9-35	Cl	H	CH <sub>3</sub>	H	N
9-36	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	N
9-37	F	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	N
9-38	Cl	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	N
9-39	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	N
9-40	F	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	N
9-41	Cl	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	N

(continuación)

	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Z
9-42	H	H	CH <sub>2</sub> CN	H	N
9-43	F	H	CH <sub>2</sub> CN	H	N
9-44	Cl	H	CH <sub>2</sub> CN	H	N
9-45	H	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N
9-46	F	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N
9-47	Cl	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N
9-48	H	H	CHF <sub>2</sub>	H	N
9-49	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH

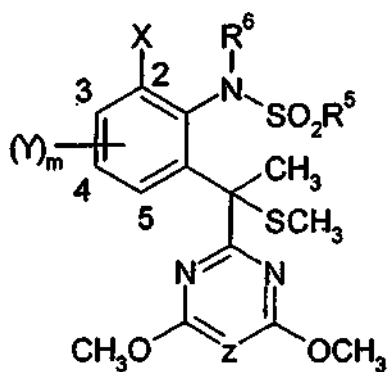
Tabla 10



5

	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
10-1	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
10-2	F	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
10-3	Cl	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
10-4	H	H	CH <sub>2</sub> CN	CH <sub>3</sub>
10-5	F	H	CH <sub>2</sub> CN	CH <sub>3</sub>
10-6	Cl	H	CH <sub>2</sub> CN	CH <sub>3</sub>
10-7	H	H	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
10-8	F	H	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
10-9	Cl	H	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
10-10	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>3</sub>
10-11	F	H	CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>3</sub>
10-12	Cl	H	CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>3</sub>

Tabla 11

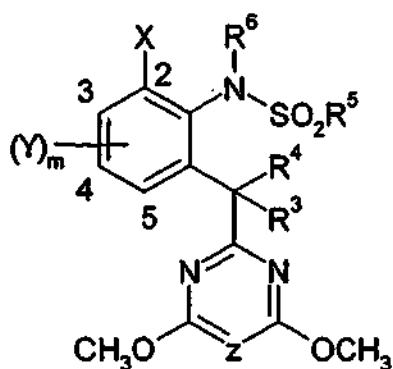


	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Z
11-1	H	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
11-2	F	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
11-3	F	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
11-4	Cl	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
11-5	F	4-F	CH <sub>3</sub>	H	CH
11-6	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
11-7	F	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
11-8	Cl	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
11-9	F	4-F	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
11-10	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
11-11	F	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
11-12	Cl	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
11-13	H	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
11-14	F	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
11-15	Cl	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
11-16	F	4-F	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
11-17	H	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
11-18	F	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
11-19	Cl	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
11-20	F	4-F	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
11-21	H	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
11-22	F	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
11-23	Cl	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
11-24	F	4-F	CF <sub>3</sub>	H	CH
11-25	H	H	CH <sub>2</sub> Ph	H	CH

(continuación)

	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Z
11-26	F	H	CH <sub>2</sub> Ph	H	CH
11-27	Cl	H	CH <sub>2</sub> Ph	H	CH
11-28	H	H	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
11-29	F	H	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
11-30	Cl	H	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
11-31	H	H	CH <sub>3</sub>	H	N
11-32	F	H	CH <sub>3</sub>	H	N
11-33	Cl	H	CH <sub>3</sub>	H	N
11-34	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	N
11-35	F	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	N
11-36	Cl	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	N
11-37	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	N
11-38	F	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	N
11-39	Cl	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	N
11-40	H	H	CH <sub>2</sub> CN	H	N
11-41	F	H	CH <sub>2</sub> CN	H	N
11-42	Cl	H	CH <sub>2</sub> CN	H	N
11-43	H	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N
11-44	F	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N
11-45	Cl	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N

Tabla 12



5

	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Z
12-1	F	3-F	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
12-2	F	3-F	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH

## ES 2 393 496 T3

(continuación)

	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Z
12-3	F	3-F	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-4	F	3-F	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
12-5	F	3-F	SCH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-6	F	3-F	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
12-7	F	3-F	SCH <sub>3</sub>	H	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
12-8	F	4-Cl	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
12-9	F	4-Cl	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
12-10	F	4-Cl	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-11	F	4-Cl	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
12-12	F	4-Cl	SCH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-13	F	3,4-F <sub>2</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
12-14	F	3,4-F <sub>2</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
12-15	F	3,4-F <sub>2</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-16	F	3,4-F <sub>2</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
12-17	F	3,4-F <sub>2</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-18	Cl	4-F	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
12-19	Cl	4-F	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
12-20	Cl	4-F	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-21	Cl	4-F	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
12-22	Cl	4-F	SCH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-23	Cl	4-CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
12-24	Cl	4-CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
12-25	Cl	4-CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-26	Cl	4-CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
12-27	Cl	4-CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-28	Cl	3-Cl	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
12-29	Cl	3-Cl	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
12-30	Cl	3-Cl	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-31	Cl	3-Cl	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
12-32	Cl	3-Cl	SCH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-33	Cl	4-Cl	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
12-34	Cl	4-Cl	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
12-35	Cl	4-Cl	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-36	Cl	4-Cl	SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH

## ES 2 393 496 T3

(continuación)

	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Z
12-37	Cl	4-Cl	SCH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-38	F	H	H	H	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H	CH
12-39	F	H	H	H	propargilo	H	CH
12-40	F	H	H	H	ciclohexilo	H	CH
12-41	F	3-F	H	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
12-42	F	3-F	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
12-43	F	3-F	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-44	F	3-F	H	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
12-45	F	3-F	H	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-46	F	3-F	H	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
12-47	F	3-F	H	H	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
12-48	F	4-Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
12-49	F	4-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
12-50	F	4-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-51	F	4-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
12-52	F	4-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-53	F	5-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-54	F	5-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-55	F	3,4-F <sub>2</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
12-56	F	3,4-F <sub>2</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
12-57	F	3,4-F <sub>2</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-58	F	3,4-F <sub>2</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
12-59	F	3,4-F <sub>2</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-60	Cl	H	H	H	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H	CH
12-61	Cl	H	H	H	propargilo	H	CH
12-62	Cl	H	H	H	ciclohexilo	H	CH
12-63	Cl	4-F	H	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
12-64	Cl	4-F	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
12-65	Cl	4-F	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-66	Cl	4-F	H	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
12-67	Cl	4-F	H	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-68	Cl	4-CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
12-69	Cl	4-CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
12-70	Cl	4-CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH

ES 2 393 496 T3

(continuación)

	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Z
12-71	Cl	4-CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
12-72	Cl	4-CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-73	Cl	3-Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
12-74	Cl	3-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
12-75	Cl	3-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-76	Cl	3-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
12-77	Cl	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-78	Cl	4-Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
12-79	Cl	4-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
12-80	Cl	4-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-81	Cl	4-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-82	F	H	OH	H	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H	CH
12-83	F	H	OH	H	propargilo	H	CH
12-84	F	H	OH	H	ciclohexilo	H	CH
12-85	F	3-F	OH	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
12-86	F	3-F	OH	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
12-87	F	3-F	OH	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-88	F	3-F	OH	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
12-89	F	3-F	OH	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-90	F	3-F	OH	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
12-91	F	3-F	OH	H	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
12-92	F	4-Cl	OH	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
12-93	F	4-Cl	OH	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
12-94	F	4-Cl	OH	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-95	F	4-Cl	OH	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
12-96	F	4-Cl	OH	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-97	F	3,4-F <sub>2</sub>	OH	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
12-98	F	3,4-F <sub>2</sub>	OH	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
12-99	F	3,4-F <sub>2</sub>	OH	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-100	F	3,4-F <sub>2</sub>	OH	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
12-101	F	3,4-F <sub>2</sub>	OH	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-102	Cl	H	OH	H	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H	CH
12-103	Cl	H	OH	H	propargilo	H	CH
12-104	Cl	H	OH	H	ciclohexilo	H	CH

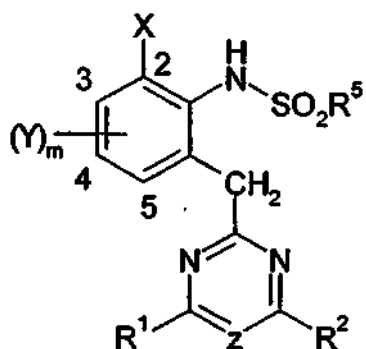


## ES 2 393 496 T3

(continuación)

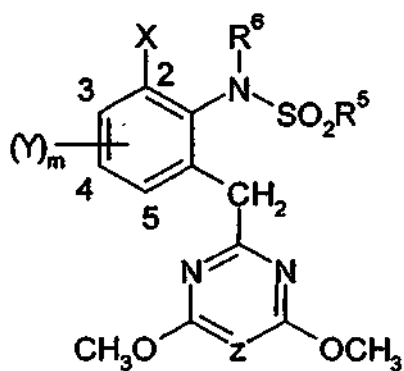
	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Z
12-105	Cl	4-F	OH	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
12-106	Cl	4-F	OH	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
12-107	Cl	4-F	OH	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-108	Cl	4-F	OH	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
12-109	Cl	4-F	OH	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-110	Cl	4-CH <sub>3</sub>	OH	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
12-111	Cl	4-CH <sub>3</sub>	OH	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
12-112	Cl	4-CH <sub>3</sub>	OH	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-113	Cl	4-CH <sub>3</sub>	OH	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
12-114	Cl	4-CH <sub>3</sub>	OH	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-115	Cl	3-Cl	OH	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
12-116	Cl	3-Cl	OH	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
12-117	Cl	3-Cl	OH	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-118	Cl	3-Cl	OH	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
12-119	Cl	3-Cl	OH	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-120	Cl	4-Cl	OH	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
12-121	Cl	4-Cl	OH	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
12-122	Cl	4-Cl	OH	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-123	Cl	4-Cl	OH	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
12-124	Cl	4-Cl	OH	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-125	Cl	H	CH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-126	I	H	OH	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-127	F	H	Cl	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-128	CF <sub>3</sub>	H	OH	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
12-129	F	4-CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-130	Cl	4-CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-131	F	4-CH <sub>3</sub>	OH	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-132	H	4-CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-133	F	3-F-4-CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-134	Cl	3-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-135	F	5-F	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
12-136	F	H	H	H	CHCl <sub>2</sub>	H	CH
12-137	CH <sub>3</sub>	3-F	OH	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH

Tabla 13



	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>5</sup>	Z
13-1	F	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
13-2	Cl	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH
13-3	H	4-Cl	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH
13-4	H	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH
13-5	H	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
13-6	H	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
13-7	CH <sub>3</sub>	3-F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH
13-8	CH <sub>3</sub>	3-F	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH
13-9	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH

Tabla 14



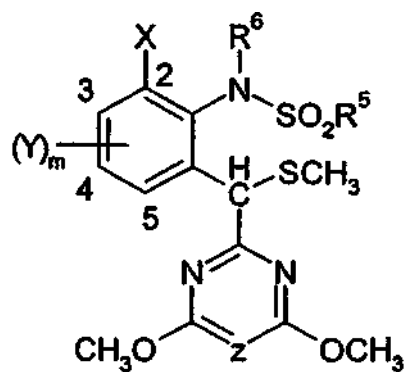
	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Z
14-1	H	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
14-2	H	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
14-3	H	4-Cl	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
14-4	H	4-F	CH <sub>3</sub> CN	H	CH
14-5	H	4-F	CF <sub>3</sub>	H	CH
14-6	H	4-Br	CF <sub>3</sub>	H	CH

## ES 2 393 496 T3

(continuación)

	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Z
14-7	F	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
14-8	F	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
14-9	F	H	CH <sub>2</sub> Br	H	CH
14-10	F	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
14-11	F	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
14-12	F	4-F	CH <sub>3</sub>	H	CH
14-13	F	4-F	CF <sub>3</sub>	H	CH
14-14	F	4-F	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
14-15	F	4-F	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
14-16	F	4-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub> CN	H	CH
14-17	F	4-OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
14-18	F	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
14-19	Cl	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
14-20	Cl	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
14-21	Cl	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
14-22	Cl	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
14-23	Cl	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
14-24	Cl	4-Cl	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
14-25	OCH <sub>3</sub>	4-F	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
14-26	H	H	CF <sub>3</sub>	H	N
14-27	H	H	CH <sub>2</sub> CN	H	N
14-28	F	H	CH <sub>3</sub> CN	H	N
14-29	F	H	CF <sub>3</sub>	H	N
14-30	Cl	H	CF <sub>3</sub>	H	N
14-31	Cl	H	CH <sub>2</sub> CN	H	N
14-32	Cl	4-Cl	CH <sub>2</sub> CN	H	N
14-33	F	H	CHF <sub>2</sub>	H	CH
14-34	F	H	CHF <sub>2</sub>	H	N
14-35	Cl	H	CHF <sub>2</sub>	H	CH
14-36	Cl	H	CHF <sub>2</sub>	H	N
14-37	CH <sub>3</sub>	H	CHF <sub>2</sub>	H	CH
14-38	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	CHF <sub>2</sub>	H	CH
14-39	CH <sub>3</sub>	H	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	CH
14-40	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-F	CBF <sub>2</sub>	H	CH

Tabla 15



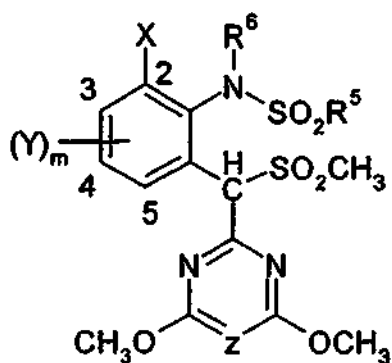
	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Z
15-1	H	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
15-2	F	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
15-3	Cl	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
15-4	F	4-F	CH <sub>3</sub>	H	CH
15-5	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
15-6	F	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
15-7	Cl	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
15-8	F	4-F	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
15-9	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
15-10	F	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
15-11	Cl	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
15-12	H	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
15-13	F	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
15-14	Cl	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
15-15	F	4-F	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
15-16	H	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
15-17	F	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
15-18	Cl	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
15-19	F	4-F	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
15-20	H	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
15-21	F	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
15-22	Cl	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
15-23	F	4-F	CF <sub>3</sub>	H	CH
15-24	H	H	CH <sub>2</sub> Ph	H	CH
15-25	F	H	CH <sub>2</sub> Ph	H	CH

## ES 2 393 496 T3

(continuación)

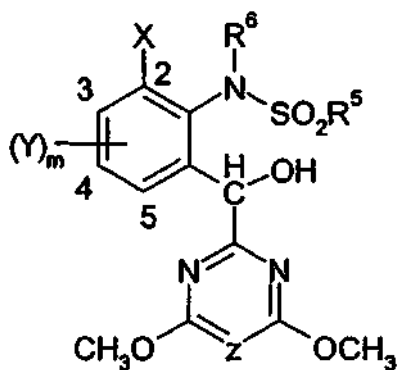
	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Z
15-26	Cl	H	CH <sub>2</sub> Ph	H	CH
15-27	H	H	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
15-28	F	H	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
15-29	Cl	H	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
15-30	H	H	CH <sub>3</sub>	H	N
15-31	F	H	CH <sub>3</sub>	H	N
15-32	Cl	H	CH <sub>3</sub>	H	N
15-33	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	N
15-34	F	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	N
15-35	Cl	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	N
15-36	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	N
15-37	F	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	N
15-38	Cl	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	N
15-39	H	H	CH <sub>2</sub> CN	H	N
15-40	F	H	CH <sub>2</sub> CN	H	N
15-41	Cl	H	CH <sub>2</sub> CN	H	N
15-42	H	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N
15-43	F	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N
15-44	Cl	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N
15-45	H	H	CF <sub>3</sub>	H	N
15-46	F	H	CF <sub>3</sub>	H	N
15-47	Cl	H	CF <sub>3</sub>	H	N
15-48	F	4-F	CF <sub>3</sub>	H	N
15-49	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CHF <sub>2</sub>	H	CH
15-50	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	ChF <sub>2</sub>	H	CH

Tabla 17



	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Z
17-1	H	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
17-2	F	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
17-3	Cl	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
17-4	F	4-F	CH <sub>3</sub>	H	CH
17-5	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
17-6	F	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
17-7	Cl	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
17-8	F	4-F	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
17-9	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
17-10	F	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
17-11	Cl	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
17-12	H	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
17-13	F	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
17-14	Cl	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
17-15	H	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
17-16	F	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
17-17	Cl	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
17-18	H	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
17-19	F	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
17-20	Cl	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
17-21	F	4-F	CF <sub>3</sub>	H	CH
17-22	H	H	CH <sub>2</sub> Ph	H	CH
17-23	F	H	CH <sub>2</sub> Ph	H	CH
17-24	Cl	H	CH <sub>2</sub> Ph	H	CH
17-25	H	H	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
17-26	F	H	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
17-27	Cl	H	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH

Tabla 18



	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Z
18-1	H	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
18-2	F	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
18-3	Cl	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
18-4	F	4-F	CH <sub>3</sub>	H	CH
18-5	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
18-6	F	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
18-7	Cl	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
18-8	F	4-F	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
18-9	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
18-10	F	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
18-11	Cl	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
18-12	H	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
18-13	F	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
18-14	Cl	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
18-15	F	4-F	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
18-16	H	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
18-17	F	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
18-18	Cl	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
18-19	F	4-F	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
18-20	H	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
18-21	F	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
18-22	Cl	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
18-23	F	4-F	CF <sub>3</sub>	H	CH
18-24	H	H	CHF <sub>2</sub>	H	CH
18-25	F	H	CHF <sub>2</sub>	H	CH
18-26	Cl	H	CHF <sub>2</sub>	H	CH

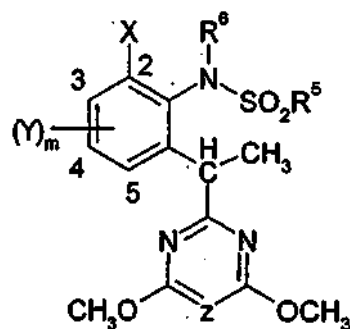
## ES 2 393 496 T3

(continuación)

	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Z
18-27	H	H	CH <sub>2</sub> Ph	H	CH
18-28	F	H	CH <sub>2</sub> Ph	H	CH
18-29	Cl	H	CH <sub>2</sub> Ph	H	CH
18-30	H	H	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
18-31	F	H	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
18-32	Cl	H	NHCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
18-33	H	H	CH <sub>3</sub>	H	N
18-34	F	H	CH <sub>3</sub>	H	N
18-35	Cl	H	CH <sub>3</sub>	H	N
18-36	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	N
18-37	F	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	N
18-38	Cl	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	N
18-39	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	N
18-40	F	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	N
18-41	Cl	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	N
18-42	H	H	CH <sub>2</sub> CN	H	N
18-43	F	H	CH <sub>2</sub> CN	H	N
18-44	Cl	H	CH <sub>2</sub> CN	H	N
18-45	H	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N
18-46	F	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N
18-47	Cl	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N
18-48	H	H	CF <sub>3</sub>	H	N
18-49	F	H	CF <sub>3</sub>	H	N
18-50	Cl	H	CF <sub>3</sub>	H	N
18-51	F	H	CHF <sub>2</sub>	H	N
18-52	Cl	H	CHF <sub>2</sub>	H	N
18-53	CH <sub>3</sub>	H	CHF <sub>2</sub>	H	N

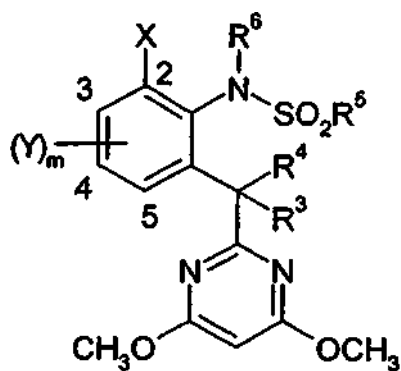


Tabla 19



	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Z
19-1	H	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
19-2	Cl	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH

Tabla 20

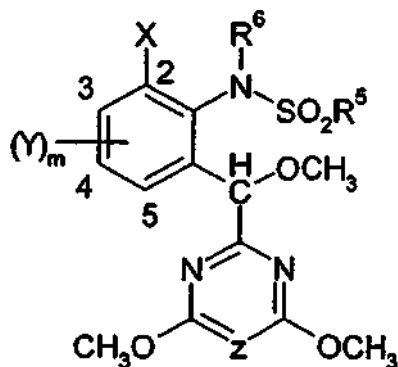


	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Z
20-1	F	H	NHCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> Cl	H
20-2	F	H	NHCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CN	H
20-3	F	H	NHCH <sub>3</sub>	H	CHF <sub>2</sub>	H
20-4	F	H	NHCH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H
20-5	Cl	H	NHCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> Cl	H
20-6	Cl	H	NHCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CN	H
20-7	Cl	H	NHCH <sub>3</sub>	H	CHF <sub>2</sub>	H
20-8	Cl	H	NHCH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H
20-9	F	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> Cl	H
20-10	F	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CN	H
20-11	F	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CHF <sub>2</sub>	H
20-12	F	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H
20-13	Cl	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> Cl	H

(continuación)

	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Z
20-14	Cl	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub> CN	H
20-15	Cl	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CHF <sub>2</sub>	H
20-16	Cl	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H

Tabla 21



5

	X	(Y) <sub>m</sub>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Z
21-1	H	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
21-2	F	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
21-3	Cl	H	CH <sub>3</sub>	H	CH
21-4	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
21-5	F	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
21-6	Cl	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	CH
21-7	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
21-8	F	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
21-9	Cl	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH
21-10	H	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
21-11	F	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
21-12	Cl	H	CH <sub>2</sub> CN	H	CH
21-13	H	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
21-14	F	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
21-15	Cl	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
21-16	H	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
21-17	F	H	CF <sub>3</sub>	H	CH
21-18	Cl	H	CF <sub>3</sub>	H	CH

Tabla 22

Compuesto N°	Propiedades Físicas y Químicas (pf (°C), n <sub>D</sub> <sup>20</sup> o <sup>1</sup> H RMN (300 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ)
9-25	3,97 (6 H, s), 6,20 (1 H, s), 6,51 (1 H, t), 7,29-7,34 (1 H, m), 7,39-7,46 (1 H, m), 7,55-7,58 (1 H, m), 11,14 (1 H, a)
9-26	3,93 (6 H, s), 6,19 (1 H, s), 6,34 (1 H, t), 7,37-7,43 (1 H, m), 7,63-7,69 (2 H, m)
9-48	4,10 (6 H, s), 6,48 (1 H, t), 7,34 (1 H), 7,45 (1 H), 7,55 (1 H), 9,08 (1 H, s)
12-127	3,99 (6 H, s), 6,00 (1 H, s), 6,13 (1 H, s), 7,16-7,33 (2 H, m), 7,42-7,44 (1 H, m)
12-131	141-145
12-136	3,98 (6 H, s), 4,27 (2 H, s), 5,92 (1 H, s), 6,73 (1 H, d), 7,04-7,23 (2 H, m)
12-137	134-136
13-8	143-148
14-8	3,98 (6 H, s), 4,25 (2 H, s), 4,83 (2 H, s), 5,92 (1 H, s), 7,03-7,22 (2 H, m), 10,52 (1 H, a)
14-33	3,97 (6 H, s), 4,26 (2 H, s), 5,94 (1 H, s), 6,59 (1 H, t), 7,05-7,13 (1 H, m), 7,16-7,23 (2 H, m), 11,14 (1 H, a)
14-34	4,05 (6 H, s), 4,22 (2 H, s), 6,56 (1 H, t), 7,07-7,27 (3 H), 10,16 (1 H, s)
14-35	3,94 (6 H, s), 4,30 (2 H, s), 5,92 (1 H, s), 6,74 (1 H, t), 7,18-7,21 (1 H, m), 7,33-7,38 (2 H, m), 11,09 (1 H, a)
14-36	4,02 (6 H, s), 4,34 (2 H, s), 6,68 (1 H, t), 7,22 (1 H), 7,32 (1 H), 7,41 (1 H), 9,98 (1 H, a)
14-37	2,48 (3 H, s), 3,95 (6 H, s), 4,26 (2 H, s), 5,90 (1 H, s), 6,37 (1 H, t), 7,15-7,26 (4 H), 10,97 (1 H, s).
14-40	3,33 (3 H, s), 3,94 (6 H, s), 4,27 (2 H, s), 4,68 (2 H, s), 5,92 (1 H, s), 6,75 (1 H, t, J = 54 Hz), 7,02 (1 H, dd, J = 9,0, 9,0 Hz), 7,37 (1 H, dd, J = 9,0, 6,0 Hz).
18-20	4,00 (6 H, s), 5,97 (1 H, s), 6,00 (1 H, s), 7,28-7,35 (2 H, m), 7,57-7,60 (1 H, m), 7,71-7,74 (1 H, m), 11,28 (1 H, a)
18-26	3,99 (6 H, s), 4,99 (1 H, a), 5,99 (1 H, s), 6,24 (1 H, s), 6,76 (1 H, t), 7,27-7,30 (1 H, m), 7,39-7,42 (1 H, m), 7,64-7,67 (1 H, m), 10,62 (1 H, a)
18-53	2,49 (3 H, s) 3,98 (6 H, s) 4,97 (1 H, d) 5,40 (1 H, s) 5,97 (1 H, s) 6,42 (1 H, t) 7,20-7,27 (2 H) 7,54 (1 H) 10,33 (1 H, s)

Ejemplo de Ensayo 1: Ensayo para el efecto de la aplicación al follaje contra *Piricularia oryzae*

## Preparación del compuesto de ensayo

- 5            Compuesto activo: 5 partes en peso  
 Disolvente orgánico: Acetona 142,5 partes en peso  
 Emulsionante: alquil fenil éter de polioxietileno 7,5 partes en peso

El compuesto activo mencionado anteriormente, la acetona y el emulsionante se mezclaron, se diluyeron a una concentración prescrita con agua y se usaron para el ensayo

## 10    Procedimiento de ensayo

- Se cultivó arroz paddy (variedad: KOSHIKKARI) en una maceta de plástico de 4 cm de diámetro. En su fase de 1,5 a 2 hojas una solución diluida preparada previamente de un compuesto activo de la concentración prescrita se pulverizó en una cantidad de 6 ml por cada 3 macetas. Un día después de la pulverización, una suspensión de esporas de *Piricularia oryzae* cultivada artificialmente se inoculó por pulverización (una vez) y se infectó manteniéndolo a 25 °C y 100% de humedad relativa. Siete días después de la inoculación, la tasa de contracción por maceta se clasificó y evaluó para obtener el valor controlante (%). La fitotoxicidad también se estudió al mismo tiempo. Este ensayo es un promedio de los resultados de 1 sección de 3 macetas.

La evaluación de tasa de contracción y el procedimiento de cálculo del valor controlante son como sigue:

Tasa de contracción	Proporción de área con lesión (%)
0	0
0,5	menor de 2
1	2-menor de 5
2	5-menor de 10
3	10-menor de 20
4	20-menor de 40
5	mayor de 40

$$\text{Valor controlante (\%)} = (1 - \{\text{tasa de contracción de la sección tratada} + \text{tasa de contracción de la sección no tratada}\}) \times 100$$

Resultados del ensayo

- 5 Los compuestos con los números de compuesto 2-31, 2-32, 2-61, 2-62, 2-125, 2-190, 2-191, 2-193, 3-22, 4-130, 4-184, 5-2, 12-127, 12-131, 12-137, 14-37, 18-2, 18-6, 18-10, 18-21, 18-24 y 18-53 como ejemplos específicos mostraron valores controlantes de más del 80% a la concentración del componente activo (500 ppm). No se observó fitotoxicidad.

Ejemplo de Ensayo Biológico 2: Ensayo para el efecto de la aplicación al follaje contra Botrytis cinerea

- 10 Procedimiento de ensayo

Se cultivó pepino (variedad: SAGAMI HANPAKU) en una maceta de plástico de 4 cm de diámetro. Una solución diluida de un compuesto activo de la concentración prescrita, preparada de una manera similar a la del Ejemplo de Ensayo 1 mencionado anteriormente, se pulverizó a las plantas de semillero alcanzando el cotiledón en una cantidad de 6 ml por cada 2 macetas. Un día después de la pulverización, un inoculante, preparado mezclando una suspensión de esporas cultivadas artificialmente de Botrytis cinerea y gel de agar ( $2 \times 10^4$  esporas/ ml de gel), se puso sobre los cotiledones para inocularlos e infectarlos en una caja húmeda mantenida a 20 °C. Cuatro días después de la inoculación, la tasa de contracción por cotiledón se clasificó y evaluó de acuerdo con el siguiente patrón para obtener el valor controlante (%). La fitotoxicidad también se estudió al mismo tiempo. Este ensayo es un promedio de los resultados de 2 secciones de 4 cotiledones.

- 20 La evaluación de tasa de contracción y el procedimiento de cálculo del valor controlante son como sigue:

Tasa de contracción	Proporción de área con lesión (%)
0	0
0,5	menor de 2
1	2-menor de 5
2	5-menor de 10
3	10-menor de 20
4	20-menor de 40
5	mayor de 40

$$\text{Valor controlante (\%)} = (1 - \{\text{tasa de contracción de la sección tratada} + \text{tasa de contracción de la sección no tratada}\}) \times 100$$

- 25 Resultados del ensayo

Los compuestos con los números de compuesto 1-14, 2-1, 2-18, 2-31, 2-110, 2-138, 2-191, 2-192, 3-31, 4-107, 4-130, 4-186, 4-187, 9-25, 9-26, 9-48, 12-136, 13-8, 14-2, 14-8, 14-20, 14-22, 14-35, 14-37, 14-40, 18-6, 18-10, 18-20, 18-24, 18-25, 18-26 y 18-51 como ejemplos específicos mostraron valores controlantes mayores del 80% a la concentración del componente activo (500 ppm). No se observó fitotoxicidad.

- 30 Ejemplo de Formulación 1 (Gránulo)

A una mezcla del compuesto de la presente invención N° 14-33 (10 partes), se le añade bentonita (montmorillonita) (30 partes), talco (58 partes) y sal sulfonato de lignina (2 partes), agua (25 partes), se amasa bien, se forma en gránulos de malla 10-40 mediante un granulador de extrusión y se seca a 40-50 °C obteniendo gránulos.

Ejemplo de Formulación 2 (Gránulos)

- 35 Partículas de arcilla mineral que tienen una distribución del tamaño de partícula en el intervalo de 0,2-2 mm (95 partes) se ponen en una mezcladora rotatoria. Mientras se hacen rotar, los compuestos de la presente invención N° 18-24 (5 partes) se pulverizan junto con un diluyente líquido, se humedecen uniformemente y se secan a 40-50 °C obteniendo gránulos.

Ejemplo de Formulación 3 (Concentrado emulsionable)

El compuesto de la presente invención N° 18-6 (30 partes), xileno (55 partes), alquil fenil éter de polioxietileno (8 partes) y alquilbencenosulfonato cálcico (7 partes) se mezclan y agitan obteniendo un concentrado emulsionable.

Ejemplo de Formulación 4 (Polvo humedecible)

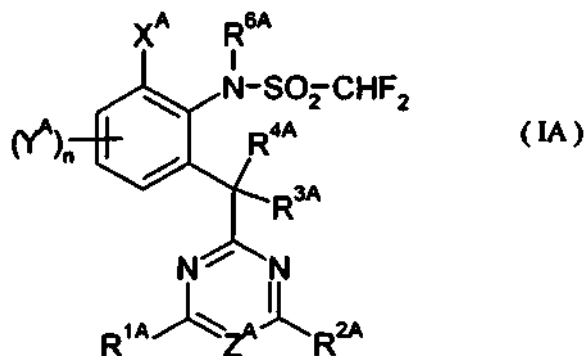
- 5 El compuesto de la presente invención N° 14-35 (15 partes), una mezcla de carbón blanco (polvo fino de óxido de silicio amorfo hidratado) y arcilla en polvo (1:5) (80 partes), alquilbencenosulfonato sódico (2 partes) y un condensado de alquil-naftalenosulfonato sódico-formalina (3 partes) se trituran y mezclan obteniendo un polvo humedecible.

Ejemplo de Formulación 5 (Gránulo dispersable en agua)

- 10 El compuesto de la presente invención N° 18-51 (20 partes), ligninsulfonato sódico (30 partes), bentonita (15 partes) y tierras diatomeas calcinadas en polvo (35 partes) se mezclan bien, se les añade agua, se extruyen con un tamiz de 0,3 mm y se secan obteniendo gránulos dispersables en agua.

## REIVINDICACIONES

1. Compuestos representados por la fórmula



en la que

- 5  $X^A$  representa hidrógeno, flúor, cloro, alquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>-carbonilo, alquil C<sub>1-6</sub>-carbonilo, cicloalquil C<sub>3-7</sub>-carbonilo, di(alquil C<sub>1-6</sub>)aminocarbonilo, alcoxi C<sub>1-6</sub>, alquil C<sub>1-6</sub>sulfonilo, alquil C<sub>1-6</sub>sulfoniloxi, di(alquil C<sub>1-6</sub>)amino, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalquil C<sub>1-6</sub>tio, haloalquil C<sub>1-6</sub>sulfinilo, haloalquil C<sub>1-6</sub>sulfonilo, haloalquil C<sub>1-6</sub>sulfoniloxi, formilo, carboxi, ciano, nitro o fenoxi,  
 $Y^A$  representa flúor, cloro, alquilo C<sub>1-6</sub>, al menos uno de cuyos hidrógenos puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi C<sub>1-6</sub>-alquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>-carbonilo, alquil C<sub>1-6</sub>-carbonilo, alcoxi C<sub>1-6</sub>, alquil C<sub>1-6</sub>sulfonilo, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalquil C<sub>1-6</sub>tio, haloalquil C<sub>1-6</sub>sulfinilo, haloalquil C<sub>1-6</sub>sulfonilo, di(alquil C<sub>1-6</sub>)amino, ciano o nitro, y 2  $Y^A$  pueden ser iguales o diferentes entre sí en el caso en el que n es 2,  $Z^A$  representa C-R<sup>7A</sup> o N, n representa 0, 1 o 2,  
 $R^{1A}$  y  $R^{2A}$  representa cada uno independientemente hidrógeno, cloro, alquilo C<sub>1-6</sub>, al menos uno de cuyos hidrógenos puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, cicloalquilo C<sub>3-7</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub> o alquil C<sub>1-6</sub>tio,  
 $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  representa cada uno independientemente hidrógeno, flúor, cloro, alquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, alquil C<sub>1-6</sub>tio o alquil C<sub>1-6</sub>sulfonilo,  
 $R^{3A}$  representa hidroxilo y  $R^{4A}$  representa hidrógeno o alquilo C<sub>1-6</sub>, o  
 $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  pueden formar juntos C=O con el átomo de carbono al que están unidos,  
 $R^{6A}$  representa hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, al menos uno de cuyos hidrógenos puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi C<sub>1-6</sub>-alquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>-carbonilo, alquil C<sub>1-6</sub>-carbonilo, cicloalquil C<sub>3-7</sub>-carbonilo, o un grupo -SO<sub>2</sub>R<sup>5A</sup>,  
 $R^{5A}$  representa alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub> o alquilo C<sub>1-6</sub> sustituido con ciano, y  
 $R^{7A}$  representa hidrógeno o alquilo C<sub>1-6</sub>,

con la excepción de los siguientes casos (T-1) - (T-3) ;

- (T-1) el caso en el que  $X^A$  represente alquilo C<sub>1-6</sub>, y n representa 0,  
(T-2) el caso en el que  $X^A$  represente hidrógeno, n representa 0,  $Z^A$  representa CH,  $R^{1A}$  y  $R^{2A}$  representan metoxi,  $R^{3A}$  representa hidroxilo y  $R^{4A}$  representa hidrógeno, o  $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  forman juntos C=O con el tomo de carbono al que están unidos, y  $R^{6A}$  representa hidrógeno,  
30 (T-3) el caso en el que  $X^A$  represente flúor o cloro, n representa 0,  $Z^A$  representa CH o N,  $R^{1A}$  y  $R^{2A}$  representan metoxi,  $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  representan hidrógeno,  $R^{3A}$  representa hidroxilo y  $R^{4A}$  representa hidrógeno, o  $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  forman juntos C=O con el átomo de carbono al que están unidos, y  $R^{6A}$  representa hidrógeno.

2. Los compuestos definidos en la reivindicación 1, en los que

- 35  $X^A$  representa hidrógeno, flúor, cloro, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>-carbonilo, alquil C<sub>1-4</sub>-carbonilo, cicloalquil C<sub>3-5</sub>-carbonilo, di(alquil C<sub>1-4</sub>)aminocarbonilo, alcoxi C<sub>1-4</sub>, alquil C<sub>1-4</sub>sulfonilo, alquil C<sub>1-4</sub>sulfoniloxi, di(alquil C<sub>1-4</sub>)amino, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquil C<sub>1-4</sub>tio, haloalquil C<sub>1-4</sub>sulfinilo, haloalquil C<sub>1-4</sub>sulfonilo, haloalquil C<sub>1-4</sub>sulfoniloxi, formilo, carboxi, ciano, nitro o fenoxi,  
 $Y^A$  representa flúor, cloro, alquilo C<sub>1-4</sub>, al menos uno de cuyos hidrógenos puede estar opcionalmente sustituido con flúor, alcoxi C<sub>1-4</sub>-alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>-carbonilo, alquil C<sub>1-4</sub>-carbonilo, alcoxi C<sub>1-4</sub>, alquil C<sub>1-4</sub>sulfonilo, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquil C<sub>1-4</sub>tio, haloalquil C<sub>1-4</sub>sulfinilo, haloalquil C<sub>1-4</sub>sulfonilo, di(alquil C<sub>1-4</sub>)amino, ciano o nitro, y 2  $Y^A$  pueden ser iguales o diferentes entre sí en el caso en el que n es 2,  $Z^A$  representa C-R<sup>7A</sup> o N, n representa 0, 1 o 2,  
 $R^{1A}$  y  $R^{2A}$  representa cada uno independientemente hidrógeno, cloro, alquilo C<sub>1-4</sub>, al menos uno de cuyos hidrógenos puede estar opcionalmente sustituido con flúor, cicloalquil C<sub>3-5</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub> o alquil C<sub>1-4</sub>tio,  
45  $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  representa cada uno independientemente hidrógeno, flúor, cloro, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, alquil C<sub>1-4</sub>tio

o alquil C<sub>1-4</sub>sulfonilo,

R<sup>3A</sup> representa hidroxilo y R<sup>4A</sup> represente hidrógeno o alquilo C<sub>1-4</sub>, o

R<sup>3A</sup> y R<sup>4A</sup> pueden formar juntos C=O con el átomo de carbono al que están unidos,

5 R<sup>6A</sup> represente hidrógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, al menos uno de cuyos hidrógenos puede estar opcionalmente sustituido con flúor, alcoxi C<sub>1-4</sub>-alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>-carbonilo, alquil C<sub>1-4</sub>-carbonilo, cicloalquil C<sub>3-5</sub>-carbonilo, o un grupo-SO<sub>2</sub>R<sup>5A</sup>,

R<sup>5A</sup> represente alquilo C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub> o alquilo C<sub>1-4</sub> sustituido con ciano, y

R<sup>7A</sup> represente hidrógeno o alquilo C<sub>1-4</sub>,

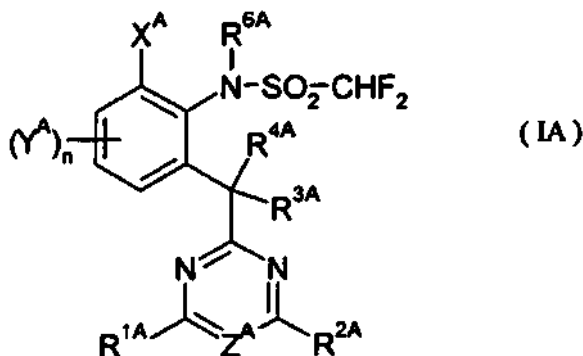
con la excepción de los siguientes casos (T-1) - (T-3);

10 (T-1) el caso en el que X<sup>A</sup> representa alquilo C<sub>1-4</sub>, y n representa 0,

(T-2) el caso en el que X<sup>A</sup> representa hidrógeno, n representa 0, Z<sup>A</sup> representa CH, R<sup>1A</sup> y R<sup>2A</sup> representan metoxi, R<sup>3A</sup> representa hidroxilo y R<sup>4A</sup> representa hidrógeno, o R<sup>3A</sup> y R<sup>4A</sup> forman juntos C=O con el átomo de carbono al que están unidos, y R<sup>6A</sup> representa hidrógeno,

15 (T-3) el caso en el que X<sup>A</sup> representa flúor o cloro, n representa 0, Z<sup>A</sup> representa CH o N, R<sup>1A</sup> y R<sup>2A</sup> representan metoxi, R<sup>3A</sup> y R<sup>4A</sup> representan hidrógeno, R<sup>3A</sup> representa hidroxilo y R<sup>4A</sup> representa hidrógeno, o R<sup>3A</sup> y R<sup>4A</sup> forman juntos C=O con el átomo de carbono al que están unidos, y R<sup>6A</sup> representa hidrógeno.

3. Un procedimiento para las preparaciones de los compuestos de fórmula (IA)



en la que

20 X<sup>A</sup> representa hidrógeno, flúor, cloro, alquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>-carbonilo, alquil C<sub>1-6</sub>-carbonilo, cicloalquil C<sub>3-7</sub>-carbonilo, di(alquil C<sub>1-6</sub>)aminocarbonilo, alcoxi C<sub>1-6</sub>, alquil C<sub>1-6</sub>sulfonilo, alquil C<sub>1-6</sub>sulfonilo, di(alquil C<sub>1-6</sub>)amino, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalquil C<sub>1-6</sub>tio, haloalquil C<sub>1-6</sub>sulfonilo, haloalquil C<sub>1-6</sub>sulfonilo, haloalquil C<sub>1-6</sub>sulfonilo formilo, carboxi, ciano, nitro o fenoxi,

25 Y<sup>A</sup> representa flúor, cloro, alquilo C<sub>1-6</sub>, al menos uno de cuyos hidrógenos puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi C<sub>1-6</sub>-alquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>-carbonilo, alquil C<sub>1-6</sub>-carbonilo, alcoxi C<sub>1-6</sub>, alquil C<sub>1-6</sub>sulfonilo, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalquil C<sub>1-6</sub>tio, haloalquil C<sub>1-6</sub>sulfonilo, haloalquil C<sub>1-6</sub>sulfonilo, di(alquil C<sub>1-6</sub>)amino, ciano o nitro, y 2 Y<sup>A</sup> pueden ser iguales o diferentes entre sí en el caso en el que n es 2, Z<sup>A</sup> representa C-R<sup>7A</sup> o N, n representa 0, 1 o 2,

30 R<sup>1A</sup> y R<sup>2A</sup> representa cada uno independientemente hidrógeno, cloro, alquilo C<sub>1-6</sub>, al menos uno de cuyos hidrógenos puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, cicloalquilo C<sub>3-7</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub> o alquil C<sub>1-6</sub>tio,

R<sup>3A</sup> y R<sup>4A</sup> representa cada uno independientemente hidrógeno, flúor, cloro, alquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, alquil C<sub>1-6</sub>tio o alquil C<sub>1-6</sub>sulfonilo,

35 R<sup>3A</sup> representa hidroxilo y R<sup>4A</sup> representa hidrógeno o alquilo C<sub>1-6</sub>, o

R<sup>3A</sup> y R<sup>4A</sup> pueden formar juntos C=O con el átomo de carbono al que están unidos,

R<sup>6A</sup> representa hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, al menos uno de cuyos hidrógenos puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi C<sub>1-6</sub>-alquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>-carbonilo, alquil C<sub>1-6</sub>-carbonilo, cicloalquil C<sub>3-7</sub>-carbonilo, o un grupo-SO<sub>2</sub>R<sup>5A</sup>,

40 R<sup>5A</sup> representa alquilo C<sub>1-6</sub>, C<sub>1-6</sub>haloalquilo o sustituido con ciano alquilo C<sub>1-6</sub>, y

R<sup>7A</sup> representa hidrógeno o alquilo C<sub>1-6</sub>,

con la excepción de los siguientes casos (T-1) - (T-3) ;

(T-1) el caso en el que X<sup>A</sup> represente alquilo C<sub>1-6</sub>, y n representa 0,

(T-2) el caso en el que X<sup>A</sup> represente hidrógeno, n representa 0, Z<sup>A</sup> representa CH, R<sup>1A</sup> y R<sup>2A</sup> representan metoxi, R<sup>3A</sup> representa hidroxilo y R<sup>4A</sup> represente hidrógeno, o R<sup>3A</sup> y R<sup>4A</sup> forman juntos C=O con el átomo de carbono al que están unidos, y R<sup>6A</sup> representa hidrógeno,

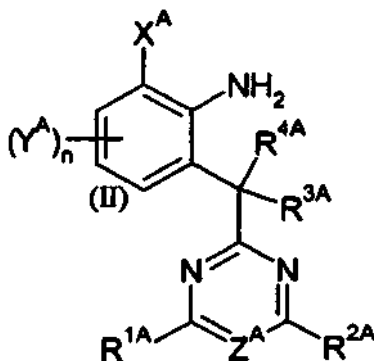
45 (T-3) el caso en el que X<sup>A</sup> represente flúor o cloro, n representa 0, Z<sup>A</sup> representa CH o N, R<sup>1A</sup> y R<sup>2A</sup> representan metoxi, R<sup>3A</sup> y R<sup>4A</sup> representan hidrógeno, R<sup>3A</sup> representa hidroxilo y R<sup>4A</sup> representa hidrógeno, o R<sup>3A</sup> y R<sup>4A</sup> forman

juntos C=O con el átomo de carbono al que están unidos, y  $R^{6A}$  representa hidrógeno,

**caracterizado porque**

a) En el caso en el que  $R^{6A}$  represente hidrógeno o difluorometanosulfonilo:

compuestos de fórmula (II)



5

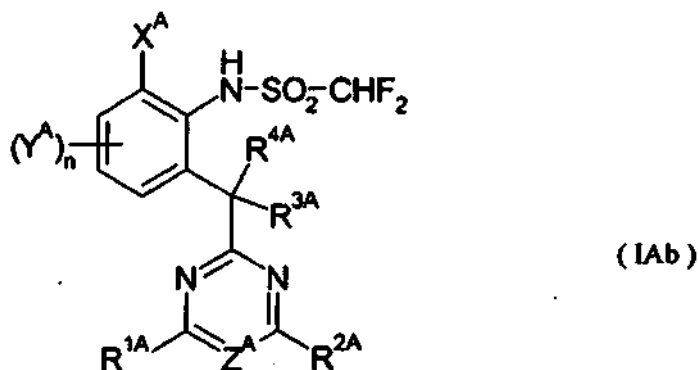
en la que

$X^A$ ,  $Y^A$ ,  $Z^A$ ,  $n$ ,  $R^{1A}$ ,  $R^{2A}$ ,  $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  tienen la misma definición que la mencionada anteriormente,

se hacen reaccionar con cloruro de difluorometanosulfonilo en presencia de disolventes inertes y, si fuera apropiado, en presencia de un aglutinante ácido, o,

10 b) En el caso en el que  $R^{6A}$  represente alquilo  $C_{1-6}$ , al menos uno de cuyos hidrógenos puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi  $C_{1-6}$ -alquilo  $C_{1-6}$ , alcoxi  $C_{1-6}$ -carbonilo, alquil  $C_{1-6}$ -carbonilo, cicloalquil  $C_{3-7}$ -carbonilo, o un grupo  $-SO_2R^{5A}$ :

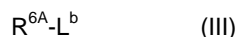
compuestos de fórmula (IAb)



15 en la que

$X^A$ ,  $Y^A$ ,  $Z^A$ ,  $n$ ,  $R^{1A}$ ,  $R^{2A}$ ,  $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  tienen la misma definición que la mencionada anteriormente,

se hacen reaccionar con compuestos de fórmula (III)



en la que

20  $R^{6A}$  representa alquilo  $C_{1-6}$ , al menos uno de cuyos hidrógenos puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi  $C_{1-6}$ -alquilo  $C_{1-6}$ , alcoxi  $C_{1-6}$ -carbonilo, alquil  $C_{1-6}$ -carbonilo, cicloalquil  $C_{3-7}$ -carbonilo, o un grupo  $-SO_2R^{5A}$

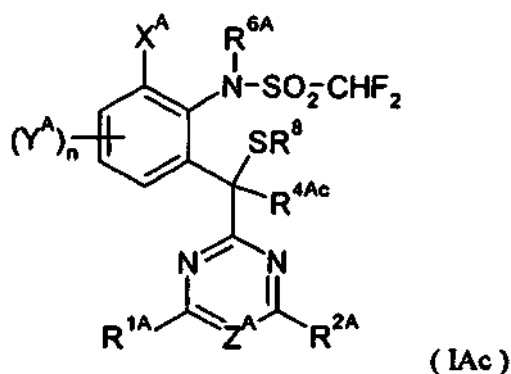
$L^b$  representa halógeno,

en presencia de disolventes inertes y, si fuera apropiado, en presencia de un aglutinante ácido, o,

c) En el caso en el que  $R^{3A}$  represente hidrógeno y  $R^{4A}$  represente hidrógeno o alquilo  $C_{1-6}$ :

25 compuestos de fórmula (IAC)





en la que

$R^{4Ac}$  representa hidrógeno o alquilo  $C_{1-6}$ ,  $R^8$  representa alquilo  $C_{1-6}$ ,

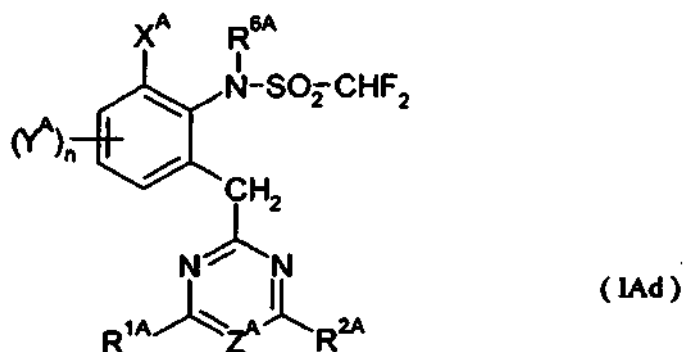
$X^A$ ,  $Y^A$ ,  $Z^A$ ,  $n$ ,  $R^{1A}$ ,  $R^{2A}$  y  $R^{6A}$  tienen la misma definición que la mencionada anteriormente,

5 se hacen reaccionar con un agente reductor en presencia de disolventes inertes,

o,

d) En el caso en el que  $R^{3A}$  y  $R^{4A}$  forman juntos  $C=O$  con el átomo de carbono al que están unidos:

compuestos de fórmula (IAe)



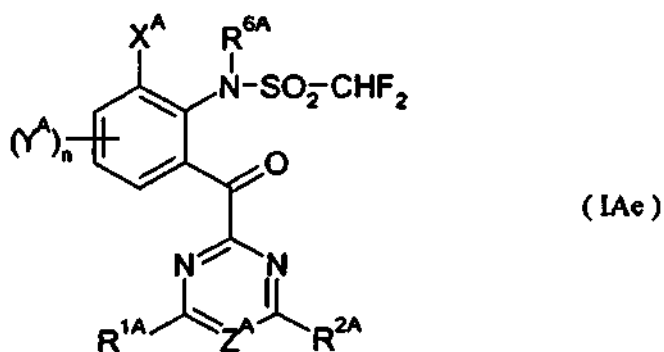
10 en la que

$X^A$ ,  $Y^A$ ,  $Z^A$ ,  $n$ ,  $R^{1A}$ ,  $R^{2A}$  y  $R^{6A}$  tienen la misma definición que la mencionada anteriormente, se hacen reaccionar con un agente oxidante en los disolventes inertes y, si fuera apropiado, en presencia de un catalizador ácido,

o,

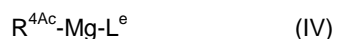
e) En el caso en el que  $R^{3A}$  represente hidroxilo y  $R^{4A}$  representa alquilo  $C_{1-6}$ :

15 compuestos de fórmula (IAe)



en la que

$X^A$ ,  $Y^A$ ,  $Z^A$ ,  $n$ ,  $R^{1A}$ ,  $R^{2A}$  y  $R^{6A}$  tienen la misma definición que la mencionada anteriormente, se hacen reaccionar con compuestos de fórmula (IV)



en la que

5  $R^{4Ae}$  represente alquilo  $C_{1-6}$ ,

$L^e$  represente halógeno,

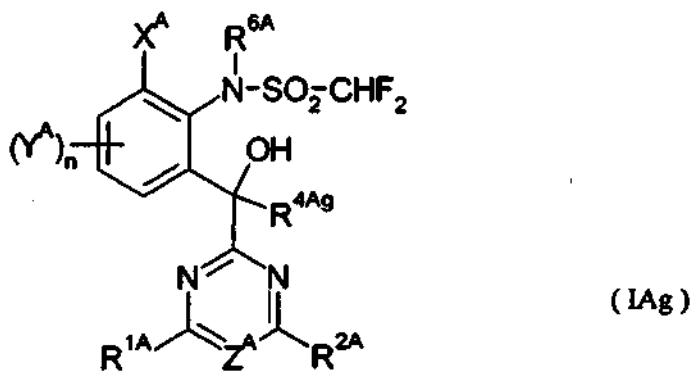
en presencia de disolventes inertes, o,

10 f) En el caso en el que  $R^{3A}$  represente hidroxilo y  $R^{4A}$  represente hidrógeno: compuestos de la fórmula (IAe) mencionada anteriormente se hacen reaccionar con un compuesto de complejo de hidruro de metal alcalino o complejo de borano en presencia de disolventes inertes,

o,

g) En el caso en el que  $R^{3A}$  represente hidrógeno y  $R^{4A}$  represente hidrógeno o alquilo  $C_{1-6}$ :

compuestos de fórmula (IAg)



15 en la que

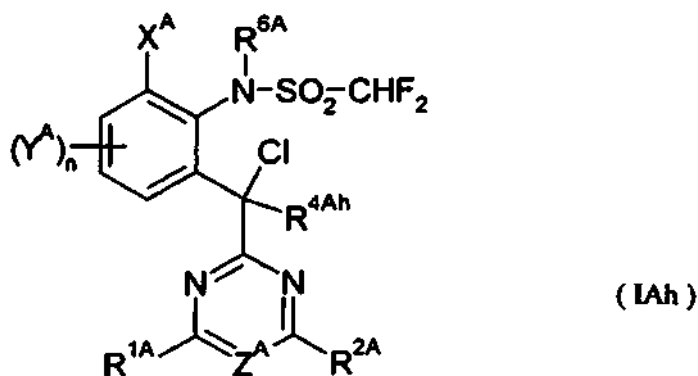
$R^{4Ag}$  represente hidrógeno o alquilo  $C_{1-6}$ ,

$X^A$ ,  $Y^A$ ,  $Z^A$ ,  $n$ ,  $R^{1A}$ ,  $R^{2A}$  y  $R^{6A}$  tienen la misma definición que la mencionada anteriormente, se hacen reaccionar con un agente de halogenación en presencia de disolventes inertes,

o,

20 h) En el caso en el que  $R^{3A}$  represente alcoxi  $C_{1-6}$  o alquil  $C_{1-6}$  y  $R^{4A}$  represente hidrógeno o alquilo  $C_{1-6}$ :

compuestos de fórmula (IAh)



en la que

$R^{4Ah}$  represente hidrógeno o alquilo  $C_{1-6}$ ,

$X^A$ ,  $Y^A$ ,  $Z^A$ ,  $n$ ,  $R^{1A}$ ,  $R^{2A}$  y  $R^{6A}$  tienen la misma definición que la mencionada anteriormente, se hacen reaccionar con compuestos de fórmula (V)



en la que

5  $R^{3Ah}$  representa alcoxi  $C_{1-6}$  o alquil  $C_{1-6}$ tio,

M representa hidrógeno o metal alcalino,

en presencia de disolventes inertes y, si fuera apropiado, en presencia de un aglutinante ácido.

10 4. Procedimiento para controlar patógenos indeseables de plantas que provocan enfermedades fúngicas, **caracterizado porque** los compuestos de fórmula (IA) de acuerdo con la reivindicación 1 se aplican a patógenos de plantas y/o su hábitat.

5. Uso de compuestos de fórmula (IA) de acuerdo con la reivindicación 1 para el control de patógenos indeseables de plantas que provocan enfermedades fúngicas.

6. Procedimiento para la preparación de formas de formulación de uso, **caracterizado porque** los compuestos de fórmula (IA) de acuerdo con la reivindicación 1 se mezclan con extendedores y/o agentes tensioactivos.