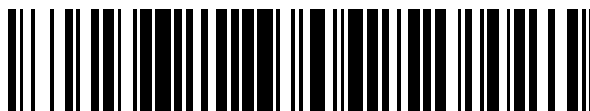


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 398 854**

51 Int. Cl.:

A01N 55/00 (2006.01)

A01N 47/10 (2006.01)

A01N 47/24 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **03.04.2008 E 08742588 (0)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **05.12.2012 EP 2129225**

54 Título: **Fungicidas de benceno sustituido**

30 Prioridad:

03.04.2007 US 921600 P

19.12.2007 US 8425 P

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

22.03.2013

73 Titular/es:

**E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY
(100.0%)
1007 MARKET STREET
WILMINGTON, DE 19898, US**

72 Inventor/es:

**FINKELSTEIN, BRUCE, LAWRENCE;
TAGGI, ANDREW, EDMUND;
LONG, JEFFREY, KEITH;
SHARPE, PAULA, LOUISE;
TSENG, CHI-PING;
MCCANN, STEPHEN, FREDERICK;
DING, AMY, X. y
SWANN JR, STEVEN, LEWIS**

74 Agente/Representante:

DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto

ES 2 398 854 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

Fungicidas de benceno sustituido

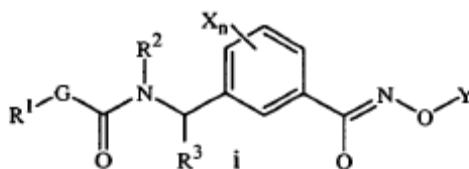
Campo de la invención

5 La presente invención se refiere a ciertos fungicidas de benceno, sus N-óxidos, sales y composiciones, y procedimientos de su uso como fungicidas.

Antecedentes de la invención

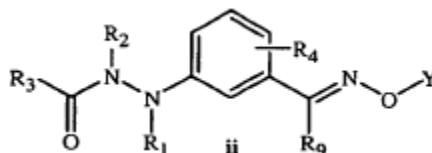
10 El control de enfermedades de plantas provocadas por patógenos micóticos de plantas es extremadamente importante en el logro de la eficiencia del cultivo. El daño de las enfermedades de plantas a cultivos ornamentales, vegetales, de campo, cereales, y frutas puede provocar significativa reducción en la productividad y de ese modo dar como resultado un incremento en los costos para el consumidor. Muchos productos están comercialmente disponibles para estos fines, pero continúa la necesidad de nuevos compuestos que sean más efectivos, menos costosos, menos tóxicos, ambientalmente más seguros o que tengan diferentes sitios de acción.

La Publicación de Patente Mundial WO 2001/010825 divulga ciertos derivados de carbamato de Fórmula i como fungicidas



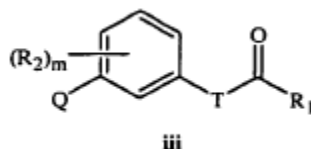
en la que, inter alia, R¹ es alquilo C₁-C₆; G es O, S o NR⁴; R² es H o alquilo C₁-C₆; R³ es H o alquilo C₁-C₆; X es halógeno; n es 0 a 4; Q es H o alquilo C₁-C₆; e Y es alquilo C₁-C₁₀.

La Publicación de Patente Mundial WO 2004/037770 divulga ciertos derivados de N-fenilhidrazina de Fórmula ii como fungicidas e insecticidas.



en la que, inter alia, cada R¹ y R² es independientemente H o alquilo C₁-C₆; R³ es alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆; R⁴ es H o halógeno; R⁹ es H o alquilo C₁-C₆; e Y es H o alquilo C₁-C₆.

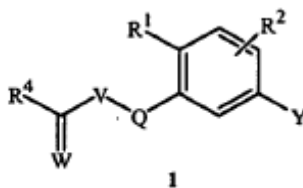
La Publicación de Patente Mundial WO 2005/051932 divulga ciertos derivados de arilheterociclo de Fórmula iii como fungicidas e insecticidas.



en la que, inter alia, R¹ es alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆; R² es halógeno; m es 0 a 4; T es un puente C-N o N-N sustituido; y Q es un N-heterociclo que también contiene como anillo miembros seleccionados de O y S.

Compendio de la invención

30 La presente invención está dirigida a compuestos de Fórmula 1 (incluyendo todos los isómeros geométricos y estereoisómeros), N-óxidos, y sales de los mismos, composiciones agrícolas que contienen los mismos y su uso como fungicidas:



en la que

cada R^1 y R^2 es independientemente H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , trialquilsililo C_3-C_{15} o halotrialquilsililo C_3-C_{15} ;

5 V es un enlace directo o NR^3 ;

R^3 es H, alquilo C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_3 , alquilcarbonilo C_2-C_6 , haloalquilcarbonilo C_2-C_6 , alcocarbonilo C_2-C_6 o haloalcoxycarbonilo C_2-C_6 ;

R^4 es H, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , alquilamino C_1-C_6 , haloalquilamino C_1-C_6 , dialquilamino C_2-C_8 , halodialquilamino C_2-C_8 o cicloalquilamino C_3-C_6 ;

10 W es O o S;

Q es $CR^{6a}R^{6b}$, O, $C(=N)-O-R^7$ o $C(=O)$;

Y es $-C(R^5)=N-O-(CR^{8a}R^{8b})_p-X-(CR^{9a}R^{9b})_q-SiR^{10a}R^{10b}R^{10c}$;

R^5 es H, CN, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , trialquilsililo C_3-C_{15} o halotrialquilsililo C_3-C_{15} ;

15 R^{6a} es H, OH, halógeno, CN, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxialquilo C_2-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 o alquilsulfonilo C_1-C_6 ;

R^{6b} es H, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxialquilo C_2-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o haloalcoxi C_1-C_6 ; o

R^{6a} y R^{6b} se toman juntos con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo cicloalquilo C_3-C_6 o anillo halocicloalquilo C_3-C_6 ;

20 R^7 es H, alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alquilcarbonilo C_2-C_3 o haloalquilcarbonilo C_2-C_3 ;

cada R^{8a} y R^{9a} es independientemente H, OH, CN, halógeno, alquilo C_1-C_5 , haloalquilo C_1-C_5 o alcoxi C_1-C_5 ;

cada R^{8b} y R^{9b} es independientemente H, CN, halógeno, alquilo C_1-C_5 , haloalquilo C_1-C_5 o alcoxi C_1-C_5 ; o

cada par de R^{8a} y R^{8b} o R^{9a} y R^{9b} unidos al mismo átomo de carbono pueden tomarse independientemente juntos con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo cicloalquilo C_3-C_6 o halocicloalquilo C_3-C_6 ; o

25 cada R^{8a} , R^{8b} , R^{9a} o R^{9b} pueden tomarse independientemente juntos con un R^{8a} , R^{8b} , R^{9a} o R^{9b} unido a un átomo de carbono adyacente y los átomos de carbono a los que están unidos para formar un anillo cicloalquilo C_3-C_6 o halocicloalquilo C_3-C_6 ;

cada R^{10a} , R^{10b} y R^{10c} es independientemente alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alcoxialquilo C_2-C_8 , haloalcoxialquilo C_2-C_8 , alquenciloalquilo C_4-C_7 , alquilcicloalquilalquilo C_5-C_{10} , haloalquencilo C_2-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , alquilcarbonilo C_2-C_6 , alcocarbonilo C_2-C_6 , trialquilsililalquilo C_4-C_{12} o J;

35 cada J es independientemente un anillo fenilo; un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros; o un sistema anular bicíclico fusionado de 8, 9 o 10 miembros, o un anillo heterocíclico o carbocíclico no aromático de 3 a 6 miembros, dicho anillo o sistema anular incluyendo opcionalmente miembros anulares seleccionados del grupo que consiste en $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^{11})$, NR^{11} , $SiR^{12a}R^{12b}$ y $S(=O)_u(=NR^{11})_z$, y cada anillo o sistema anular opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes independientemente seleccionados de R13; o

dos de R^{10a} , R^{10b} o R^{10c} se toman juntos con el átomo de silicio al que están unidos para formar un anillo saturado que contiene de 3 a 6 átomos de carbono además del átomo de silicio como miembros anulares, el anillo opcionalmente sustituido en los átomos de carbono con halógeno;

40 X es un enlace directo, O, NR^{11} , $C(=O)$, $C(=S)$ o $C(=NR^{11})$; o un anillo fenilo, un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un anillo heterocíclico o carbocíclico no aromático de 3 a 8 miembros, dicho anillo incluyendo opcionalmente miembros anulares seleccionados del grupo que consiste en $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^{11})$, NR^{11} ,

$\text{SiR}^{12a}\text{R}^{12b}$ y $\text{S}(=\text{O})_u(\text{=NR}^{11})_z$, y opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes independientemente seleccionados de R13;

cada R^{11} es independientemente H, CN, NH_2 , OH, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_8$, alquilcarbonilo $\text{C}_2\text{-C}_6$, haloalquilcarbonilo $\text{C}_2\text{-C}_6$ o alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$;

- 5 cada R^{12a} y R^{12b} es independientemente alquilo $\text{C}_1\text{-C}_5$, alquenilo $\text{C}_2\text{-C}_5$, alquinilo $\text{C}_2\text{-C}_5$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_8$, halocicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, cicloalquilalquilo $\text{C}_4\text{-C}_{10}$, alquilocicloalquilo $\text{C}_4\text{-C}_7$, alquilocicloalquilalquilo $\text{C}_5\text{-C}_8$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_5$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_5$ o haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_5$;

- 10 cada R^{13} es independientemente halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquenilo $\text{C}_2\text{-C}_6$, alquinilo $\text{C}_2\text{-C}_6$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, halocicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, alquilocicloalquilo $\text{C}_4\text{-C}_7$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquenilo $\text{C}_2\text{-C}_6$, ciano, nitro, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquiltio $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquilsulfinilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquilsulfonilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquiltio $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquilsulfinilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquilsulfonilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquilamino $\text{C}_1\text{-C}_6$, dialquilamino $\text{C}_2\text{-C}_6$, alquilcarbonilo $\text{C}_2\text{-C}_6$, alcoxycarbonilo $\text{C}_2\text{-C}_6$, alquilaminocarbonilo $\text{C}_2\text{-C}_6$, dialquilaminocarbonilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, trialquilsililo $\text{C}_3\text{-C}_{15}$ o halotrialquilsililo $\text{C}_3\text{-C}_{15}$;

p y q son independientemente un número entero de 0 a 5; siempre que cuando p es 0, después X es distinto de 0 o NR^{11} ; y

- 15 u y z en cada caso de $\text{S}(=\text{O})_u(\text{=NR}^{11})_z$ son independientemente 0, 1 o 2, siempre que la suma de u y z en cada caso de $\text{S}(=\text{O})_u(\text{=NR}^{11})_z$ es 0, 1 o 2.

Más particularmente, la presente invención se refiere a un compuesto de Fórmula 1 incluyendo todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, un N-óxido o sal del mismo.

- 20 La presente invención también se refiere a una composición fungicida que comprende una cantidad fungicidamente efectiva de un compuesto de la invención y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos.

La presente invención también se refiere a una composición fungicida que comprende (a) un compuesto de la invención y (b) al menos otro fungicida (por ejemplo, al menos otro fungicida que tiene igual o diferente sitio de acción).

- 25 La presente invención además se refiere a un procedimiento para controlar enfermedades de plantas provocadas por patógenos micóticos de plantas que comprende aplicar a la planta o parte de la misma, o a la semilla de la planta, una cantidad fungicidamente efectiva de un compuesto de la invención (por ejemplo, como una composición que se describe en la presente memoria).

Detalles de la invención

- 30 Tal como se utiliza en la presente memoria, los términos "comprende," "que comprende," "incluye," "que incluye," "tiene," "que tiene", "contiene" o "que contiene" o cualquier otra variación de los mismos, están previstos para contemplar una inclusión no exclusiva. Por ejemplo, una composición, proceso, procedimiento, artículo, o equipo que comprende una lista de elementos no se limitan necesariamente a solamente aquellos elementos sino pueden incluir otros elementos no detallados expresamente o inherentes a dicha composición, proceso, procedimiento,
- 35 artículo, o equipo. Además, a menos que se establezca expresamente lo contrario, "o" se refiere a inclusive o y no a una o exclusiva. Por ejemplo, una condición A o B es satisfecha por uno cualquiera de los siguientes: A es verdadero (o está presente) y B es falso (o no está presente), A es falso (o no está presente) y B es verdadero (o está presente), y ambos A y B son verdaderos (o están presentes).

- 40 También, los artículo indefinidos "un" y "una" que preceden un elemento o componente de la invención están previstos para ser no restrictivo con respecto al número de casos (es decir apariciones) del elemento o componente. Por ello "un" o "una" debe leerse como que incluye uno o al menos uno, y la forma de palabra singular del elemento o componente también incluye el plural a meno que el número obviamente quiera decir singular.

- 45 Según lo referido en la presente divulgación y reivindicaciones, "planta" incluye los miembros del Reino Vegetal, particularmente las plantas simientes (Spermatopsida), en todas la etapas de vida, que incluyen plantas jóvenes (por ejemplo, semillas de germinación que se desarrollan en plántulas) y las etapas madura, reproductiva (por ejemplo, planta que producen flores y semillas). Las porciones de plantas incluyen miembros geotrópicos que típicamente crecen debajo de la superficie del medio de crecimiento (por ejemplo, tierra), tal como raíces, tubérculos y bulbos, y también los miembros que crecen arriba del medio de crecimiento, tal como follaje (que incluye tallos y hojas), flores, frutos y semillas.

- 50 Según lo referido en la presente memoria, el término "plántula", utilizado solo o en una combinación de palabras significa una planta joven que se desarrolla del embrión de una emilla.

En las recitaciones más arriba, el término "alquilo", utilizado solo o en palabras de compuestos tal como "alquiltio" o "haloalquilo" incluye alquilo de cadena lineal o ramificada, tal como, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, o los diferentes isómeros de butilo, pentilo o hexilo. "Alquenilo" incluye alquenos de cadena lineal o ramificada tal como etenilo, 1-

- propenilo, 2-propenilo, y los diferentes isómeros de butenilo, pentenilo y hexenilo. "Alquenilo" también incluye polienos tal como 1,2-propadienilo y 2,4-hexadienilo. "Alquinilo" incluye alquinos de cadena lineal o ramificada tal como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo y los diferentes isómeros de butinilo, pentinilo y hexinilo. "Alquinilo" también puede incluir restos compuesto de múltiple enlaces triples tales como 2,5-hexadinilo. "Alquileno" indica un alcanediolo de cadena lineal o ramificada. Los ejemplos de "alquileno" incluyen CH_2 , CH_2CH_2 , $\text{CH}(\text{CH}_3)$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$ y los isómeros diferentes de butileno.
- "Alcoxi" incluye, por ejemplo, metoxi, etoxi, n-propiloxi, isopropiloxi y los diferentes isómeros de butoxi, pentoxi y hexiloxi. "Alcoxialquilo" indica la sustitución alcoxi en el alquilo. Los ejemplos de "alcoxialquilo" incluyen CH_3OCH_2 , $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$. "Alcoxialcoxi" indica la sustitución alcoxi de cadena lineal o ramificada en un alcoxi de cadena lineal o ramificada. Los ejemplos de "alcoxialcoxi" incluyen $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{O}$ -, $\text{CH}_3\text{OCH}_2(\text{CH}_3\text{O})\text{CHCH}_2\text{O}$ - y $(\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ -. "Alqueniloxi" incluye restos alqueniloxi de cadena lineal o ramificada. Los ejemplos de "alqueniloxi" incluyen $\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$, $(\text{CH}_3)_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$, $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}$, $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{O}$ y $\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{O}$. "Alquiniloxi" incluye restos alquiniloxi de cadena lineal o ramificada. Los ejemplos de "alquiniloxi" incluyen $\text{HC}=\text{CCH}_2\text{O}$, $\text{CH}_3\text{C}=\text{CCH}_2\text{O}$ y $\text{CH}_3\text{C}=\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}$.
- "Alquiltio" incluye restos alquiltio de cadena lineal o ramificada tales como metiltio, etiltio, y los diferentes isómeros de propiltio, butiltio, pentiltio y hexiltio.
- "Alquilsulfinito" incluye ambos enantiómeros de un grupo alquilsulfinito. Los ejemplos de "alquilsulfinito" incluyen $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})$ -, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ -, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ -, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})$ - y los diferentes isómeros de butilsulfinito, pentilsulfinito y hexilsulfinito. Los ejemplos de "alquilsulfonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2$ -, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ -, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ -, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2$ -, y los diferentes isómeros de butilsulfonilo, pentilsulfonilo y hexilsulfonilo. "Alquilamino" y "dialquilamino" y similares, se definen en forma análoga a los ejemplos anteriores.
- "Trialkilsililo" incluye 3 radicales alquilo de cadena lineal y/o ramificada unidos a y conectados a través de un átomo de silíce, tal como trimetilsililo, trietilsililo y terc-butildimetilsililo.
- "Cicloalquilo" incluye, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. El término "alquilocicloalquilo" indica la sustitución de alquilo en un resto cicloalquilo e incluye, por ejemplo, etilciclopropilo, i-propilciclobutilo, 3-metilciclopentilo y 4-metilciclohexilo. El término "cicloalquilalquilo" indica la sustitución de cicloalquilo en un resto alquilo. Los ejemplos de "cicloalquilalquilo" incluyen ciclopropilmetilo, ciclopentiletilo, y otros restos cicloalquilo unidos a grupos alquilo de cadena lineal o ramificada.
- El término "cicloalcoxi" indica cicloalquilo unido a través de un átomo de oxígeno tal como ciclopentiloxi y ciclohexiloxi. "Cicloalquilalcoxi" indica cicloalquilalquilo unido a través de un átomo de oxígeno. Los ejemplos de "cicloalquilalcoxi" incluyen ciclopropilmetoxi, ciclopentiletoxi, y otros restos cicloalquilo unidos a los grupos alcoxi de cadena lineal o ramificada.
- "Alquilcarbonilo" indica restos alquilo de cadena lineal o ramificada unidos a un resto $\text{C}(\text{=O})$. Los ejemplos de "alquilcarbonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{C}(\text{=O})$ -, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{=O})$ - y $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(\text{=O})$ -. Los ejemplos de "alcoxicarbonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{OC}(\text{=O})$ -, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(\text{=O})$ -, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(\text{=O})$ -, $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(\text{=O})$ - y los diferentes isómeros de butoxi- o pentoxycarbonilo. Los ejemplos de "alquilaminocarbonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{NHC}(\text{=O})$ -, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}(\text{=O})$ -, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(\text{=O})$ -, $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC}(\text{=O})$ - y los diferentes isómeros de butilamino- o pentilaminocarbonilo. Los ejemplos de "dialquilaminocarbonilo" incluyen $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(\text{=O})$ -, $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{NC}(\text{=O})$ -, $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(\text{=O})$ -, $(\text{CH}_3)_2\text{CHN}(\text{CH}_3)\text{C}(\text{=O})$ - y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(\text{=O})$ -.
- "Cicloalquilamino" indica cicloalquilo unido a través de un grupo amina tal como ciclopropilamino, ciclobutilamino, ciclopentilamino y ciclohexilamino.
- El término "halógeno", solo o en las palabras del compuesto tal como "haloalquilo", o cuando se utiliza en descripciones tal como "alquilo sustituido con halógeno" incluye flúor, cloro, bromo o yodo. Además, cuando se utiliza en la palabras del compuesto tal como "haloalquilo", o cuando se utiliza en descripciones tal como "alquilo sustituido con halógeno" dicho alquilo puede ser parcialmente o completamente sustituido con átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. Los ejemplos de "haloalquilo" o "alquilo sustituido con halógeno" incluyen F_3C -, ClCH_2 , CF_3CH_2 - y CF_3CCl_2 -. Los términos "halocicloalquilo", "haloalcoxi", "haloalquiltio", "haloalquenilo", "haloalqueniloxi" y "haloalquiniloxi" y similares, se definen en forma análoga al término "haloalquilo". Los ejemplos de "haloalcoxi" incluyen CF_3O -, $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$ -, $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ - y $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$ -. Los ejemplos de "haloalquiltio" incluyen CCl_3S -, CF_3S -, $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}$ - y $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}$ -. Los ejemplos de "haloalquilsulfinito" incluyen $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})$ -, $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})$ -, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ - y $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})$ -. Los ejemplos de "haloalquilsulfonilo" incluyen $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2$ -, $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})_2$ -, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ - y $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2$ -. Los ejemplos de "haloalquenilo" incluyen $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2$ - y $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2$ -. Los ejemplos de "halodialquilamino" incluyen $\text{CF}_3(\text{CH}_3)\text{N}$ -, $(\text{CF}_3)_2\text{N}$ - y $\text{CH}_2\text{Cl}(\text{CH}_3)\text{N}$ -. Los ejemplos de "halotrialkilsililo" incluyen $\text{CF}_3(\text{CH}_3)_2\text{Si}$ -, $(\text{CF}_3)_3\text{Si}$ -, y $\text{CH}_2\text{Cl}(\text{CH}_3)_2\text{Si}$ -.
- La abreviación "CN" significa ciano.
- El número total de átomos de carbono en un grupo sustituyente está indicado por el prefijo "C_i-C_j" en el que i y j son números enteros de 1 a 25. Por ejemplo, alquilsulfonilo C₁-C₄ designa metilsulfonilo a butilsulfonilo; alcoxialquilo C₂

designa CH_3OCH_2 -; alcoialquilo C_3 designa, por ejemplo, $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)$ -, $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ - o $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ -; y alcoialquilo C_4 designa los diversos isómeros de un grupo alquilo sustituido con un grupo alcoxi que contiene un total de cuatro átomos de carbono, los ejemplos incluyen $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ - y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ -.

5 Cuando un compuesto está sustituido con un sustituyente que lleva un subíndice que indica el número de dichos sustituyentes puede exceder 1, dichos sustituyentes (cuando exceden 1) son independientemente seleccionados del grupo de los sustituyentes definidos, por ejemplo, $-(\text{CR}^{\text{8a}}\text{R}^{\text{8b}})_p$ -, p es 1, 2, 3, 4 o 5. Además, cuando el subíndice indica un intervalo, por ejemplo (R)_{i-j}, después el número de sustituyentes puede ser seleccionado de los números enteros entre i y j inclusive. Cuando una o más posiciones en un grupo se dice que son "no sustituidas" o "sin sustituir", después los átomos de hidrógeno están unidos para captar cualquier valencia libre.

10 A menos que se indique lo contrario, un "anillo" o "sistema anular" como componente de la Fórmula 1 (por ejemplo, sustituyente J) es carbocíclico o heterocíclico. El término "sistema anular" indica do o más anillos fusionados. Los términos " sistema anular bicíclico " y " sistema anular bicíclico fusionado" indican un sistema anular que consiste en dos anillos fusionados, en los que el anillo puede estar saturado, parcialmente insaturado, o completamente insaturado a menos que se indique lo contrario. El término "miembro anular" se refiere a un átomo (por ejemplo, C, O, N o S) u otro resto (por ejemplo, C(=O), C(=S), S(O) o S(O)₂) que forma la estructura principal de un anillo o sistema anular.

15 Los términos " anillo carbocíclico ", "carbociclo" o " sistema anular carbocíclico " indican un anillo o sistema anular en el que los átomos que forman la estructura principal del anillo se seleccionan solamente de carbono. A menos que se indique lo contrario, un anillo carbocíclico puede ser un anillo saturado, parcialmente insaturado, o completamente insaturado. Cuando un anillo carbocíclico completamente insaturado satisface la regla de Hückel, después dicho anillo también se denomina "anillo aromático". "Carbocíclico saturado" se refiere a un anillo que tiene una estructura principal que consiste en átomos de carbono unido entre sí por enlaces simples; a menos que se especifique lo contrario, las valencias de carbonos restantes están ocupadas por átomos de hidrógeno.

20 Los términos " anillo heterocíclico ", "heterociclo" o " sistema anular heterocíclico " indican un anillo o sistema anular en el que al menos un átomo que forma la estructura principal anular no es carbono, por ejemplo, nitrógeno, oxígeno o azufre. Típicamente un anillo heterocíclico contiene o más de 4 nitrógenos, no más de 2 oxígenos y no más de 2 azufres. A menos que se indique lo contrario, un anillo heterocíclico puede ser un anillo saturado, parcialmente insaturado, o completamente insaturado. Cuando un anillo heterocíclico completamente insaturado satisface la regla de Hückel, después dicho anillo también se denomina un " anillo heteroaromático " o "anillo heterocíclico aromático ".

25 A menos que se indique lo contrario, los anillos y sistema anulares heterocíclicos pueden estar unidos a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible por reemplazo de un hidrógeno en dicho carbono o nitrógeno.

30 "Aromático" indica que cada uno de los átomo anulares está esencialmente en el mismo plano y tiene una p-orbital perpendicular al plano anular, y en el que $(4n + 2)$ n electrones, donde n es un número entero positivo, están asociados al anillo para cumplir con la regla de Hückel. El término "sistema anular aromático" indica un sistema anular carbocíclico o heterocíclico en el que al menos un anillo del sistema anular es aromático. El término "sistema anular carbocíclico aromático" indica un sistema anular carbocíclico en el que al menos un anillo del sistema anular es aromático. El término "sistema anular heterocíclico aromático" indica un sistema anular heterocíclico en el que al menos un anillo del sistema anular es aromático. El término " sistema anular no aromático" indica un sistema anular carbocíclico o heterocíclico que puede estar completamente saturado, así como parcialmente o completamente insaturado, siempre que ninguno de los anillos en el sistema anular sean aromáticos.

35 El término "opcionalmente sustituido" en conexión con R10a, R10b, R10c, J y X se refiere a grupos que no son sustituidos o tienen al menos un sustituyente distinto de hidrógeno que no extingue la actividad biológica poseída por el análogo no sustituido. Tal como se usa en la presente memoria, las siguientes definiciones se aplicarán a menos que se indique lo contrario. El término "opcionalmente sustituido" se usa indistintamente con la frase "sustituido o no sustituido" o con el término "(no) sustituido." A menos que se indique lo contrario, un grupo opcionalmente sustituido puede tener un sustituyente en cada posición sustituible del grupo, y cada sustitución es independientemente de la otra. Comúnmente, el número de sustituyentes opcionales (cuando están presentes) varía de 1 a 3. Cuando un intervalo especificado para el número de sustituyentes (por ejemplo, r siendo un número entero de 0 a 4 en el Objeto Expuesto 1) excede el número de posiciones disponibles para los sustituyentes en un anillo (por ejemplo, posición 1 disponible para (R)^v, en U-29 en el Objeto Expuesto 3), el extremo mayor real del intervalo se reconoce que es el número de posiciones disponibles. El término "opcionalmente sustituido" significa que el número de sustituyentes puede ser cero. Por ejemplo, la frase "opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes independientemente seleccionados de R¹³ⁿ" significa que 0, 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes pueden estar presentes (si el número de puntos de conexión potencial lo permite), y de ese modo el número de sustituyentes de R¹³ puede ser cero.

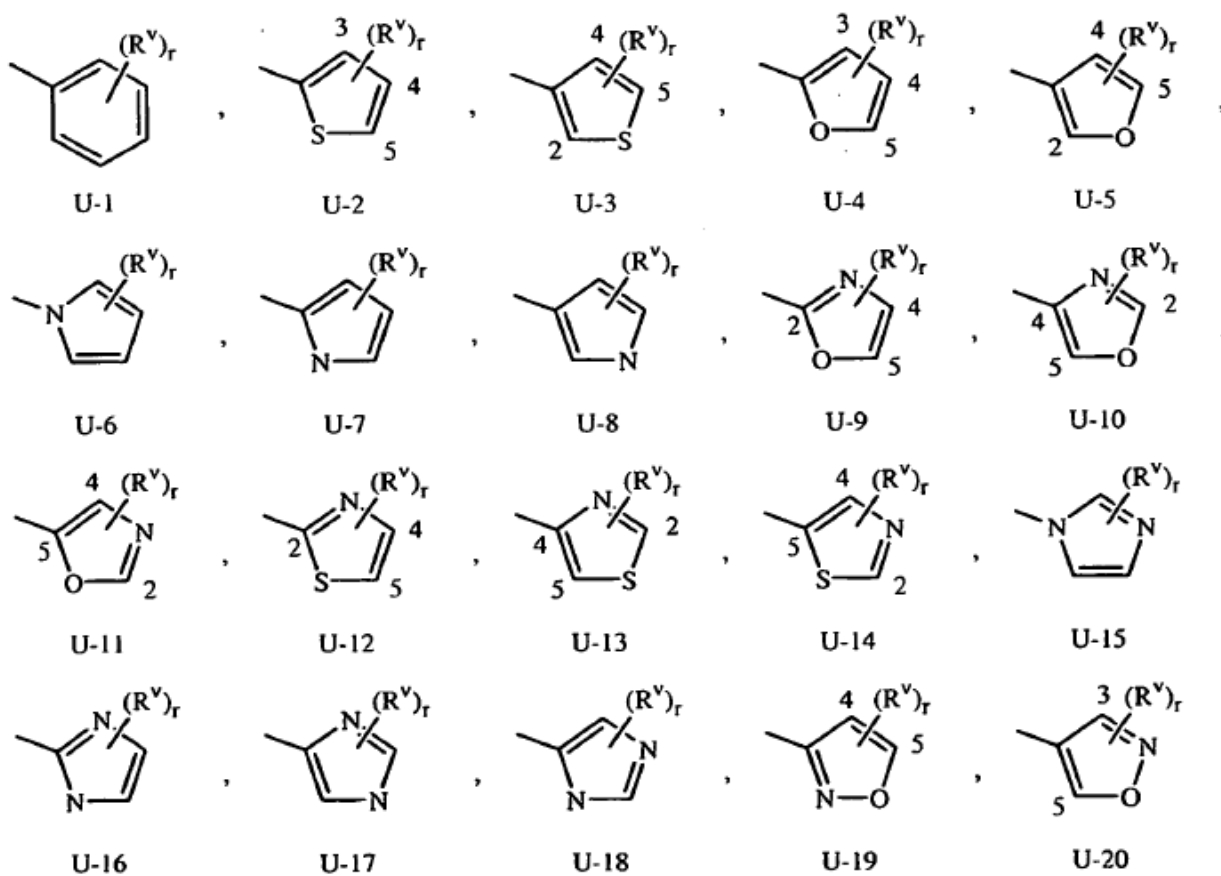
55 Cuando J es un es un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros, el mismo puede estar unido al resto de la Fórmula 1 a través de cualquier átomo del anillo de carbono o nitrógeno disponible, a menos que se describa otra cosa.

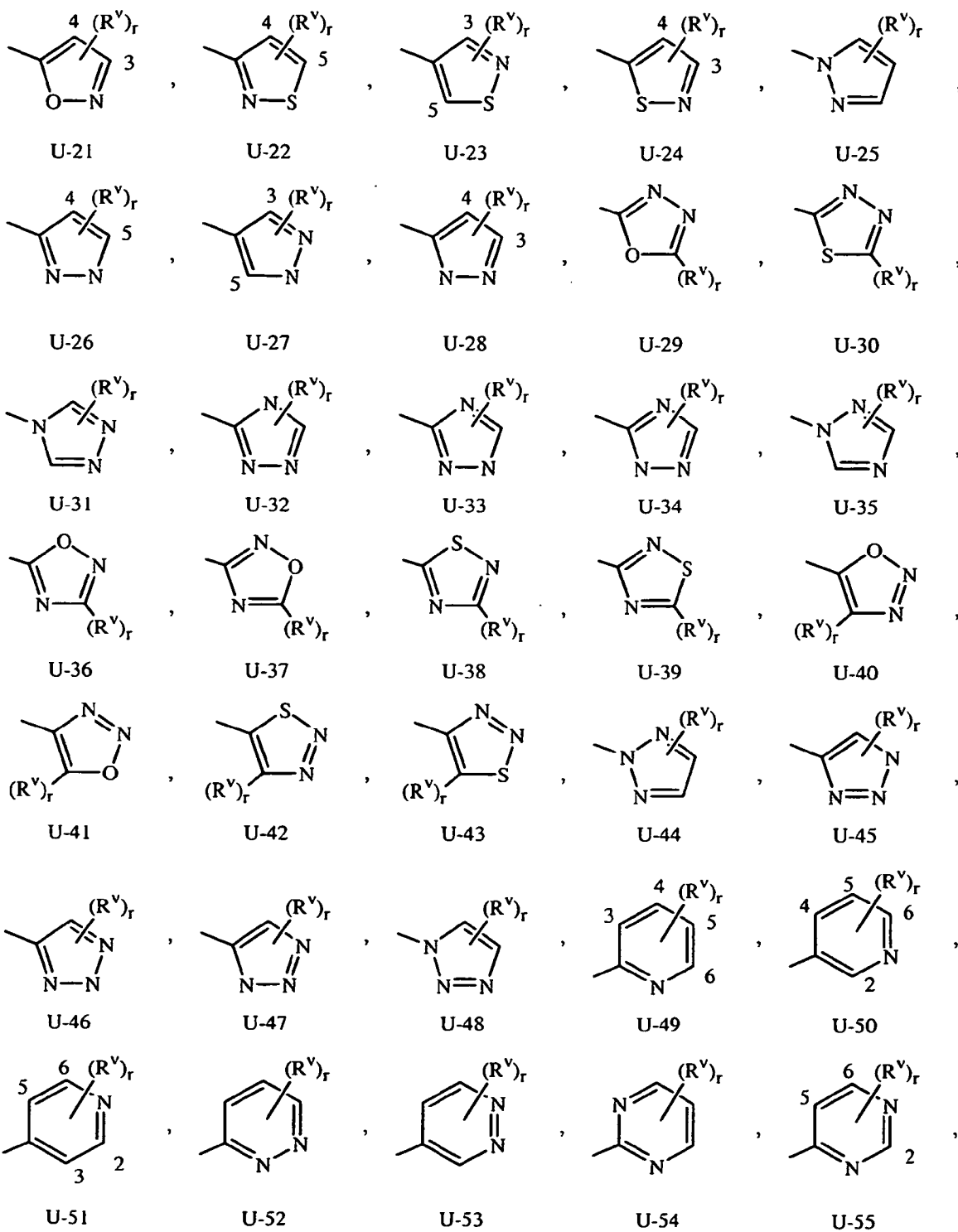
Tal como se indica más arriba, J puede ser (entre otros) un anillo fenilo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes según lo que se define en el Compendio de la Invención (es decir R¹³). Un ejemplo de un anillo fenilo opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes es el anillo ilustrado

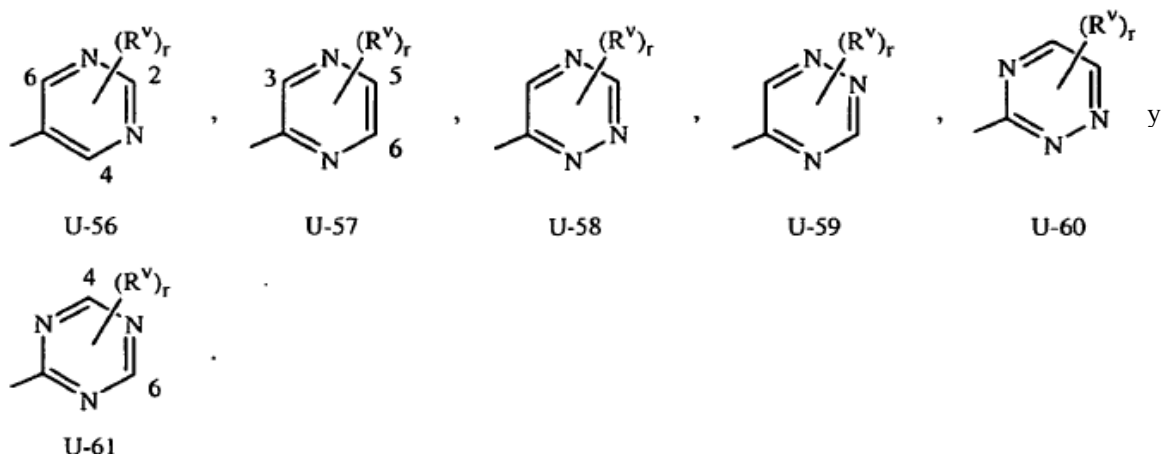
5 como U-1 en el Objeto Expuesto 1, en el que R^v es R^{13} según lo que se define en el Compendio de la Invención para J y r es un número entero de 0 a 5. También, tal como se indica más arriba, J puede ser (entre otros) un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes según lo que se define en el Compendio de la Invención. Los ejemplos de un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con de uno o más sustituyentes incluyen los anillos U-2 a U-61 ilustrados en el Objeto Expuesto 1 en el que R^v es cualquier sustituyente según lo que se define en el Compendio de la Invención para J (es decir R^{13}) y r es un número entero de 0 a 4, limitado por el número de posiciones disponibles en cada grupo U. Como U-29, U-30, U-36, U-37, U-38, U-39, U-40, U-41, U-42 y U-43 tienen solamente una posición disponible, para estos grupos U r se limita a los números enteros 0 o 1, y r siendo 0 significa que un grupo U es no sustituido y un hidrógeno está presente en la posición indicada por $(R^v)_r$.

10

Objeto Expuesto 1



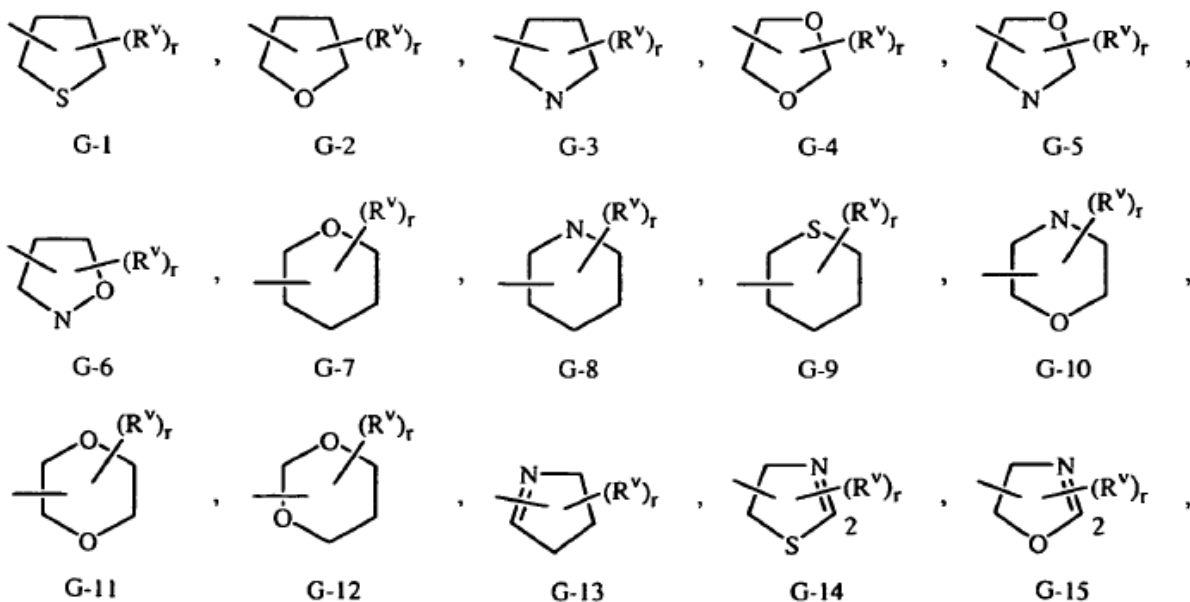


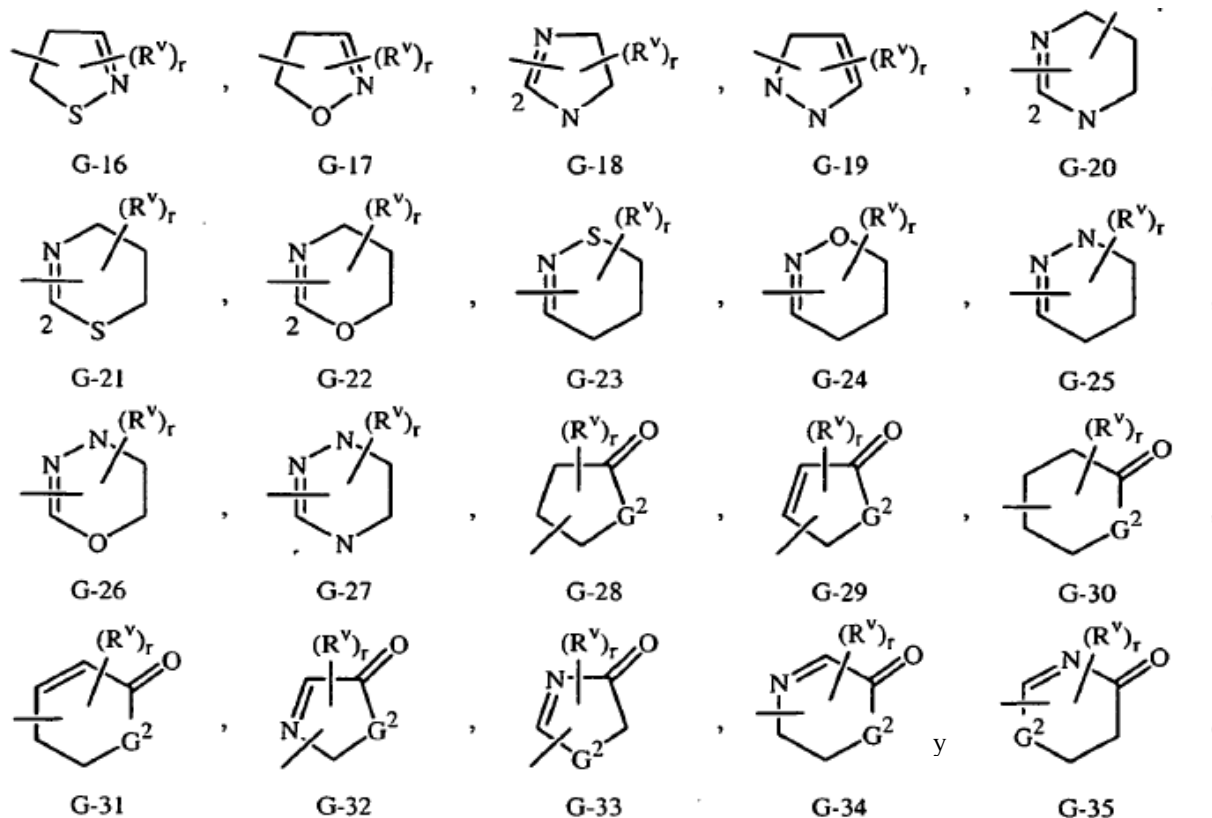


5 Los ejemplos de un anillo heterocíclico insaturado no aromático de 5 o 6 miembros incluyen los anillos G-1 a G-35 según lo ilustrado en el Objeto Expuesto 2, en el que en R^y es R^{13} según lo que se define en el Compendio de la Invención. Los sustituyentes opcionales correspondientes a R^y pueden estar unidos a cualquier carbono o nitrógeno disponible reemplazando un átomo de hidrógeno. Para estos anillos G, r es típicamente un número entero de 0 a 4, limitado por el número de posiciones disponibles en cada grupo G. Obsérvese que cuando el punto de unión en el grupo G se ilustra como flotando, el grupo G puede estar unido al resto de la Fórmula 1 a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible del grupo G por reemplazo de un átomo de hidrógeno.

10 Obsérvese que cuando J comprende un anillo seleccionado de G-28 a G-35, G^2 es seleccionado de O, S y N. Obsérvese que cuando G^2 es N, el átomo de nitrógeno puede completar i valencia por la sustitución con H o los sustituyentes correspondientes a R^y según lo que se define en el Compendio de la Invención para J (es decir R^{13}).

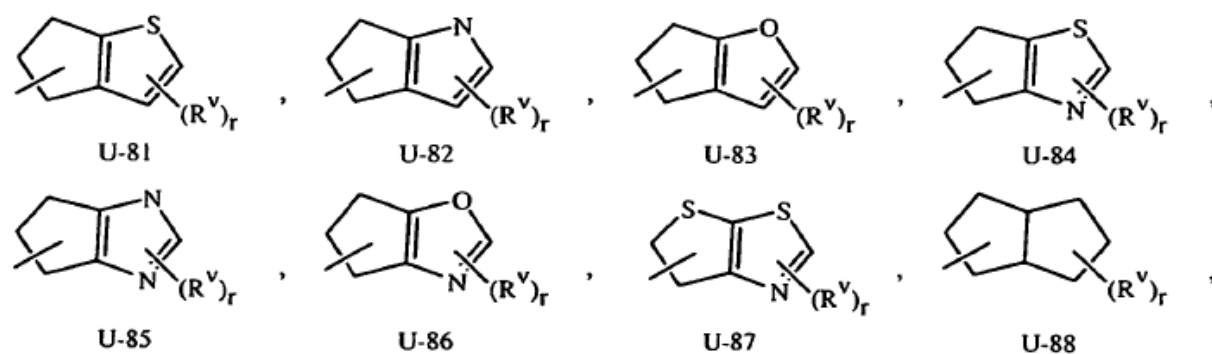
Objeto Expuesto 2

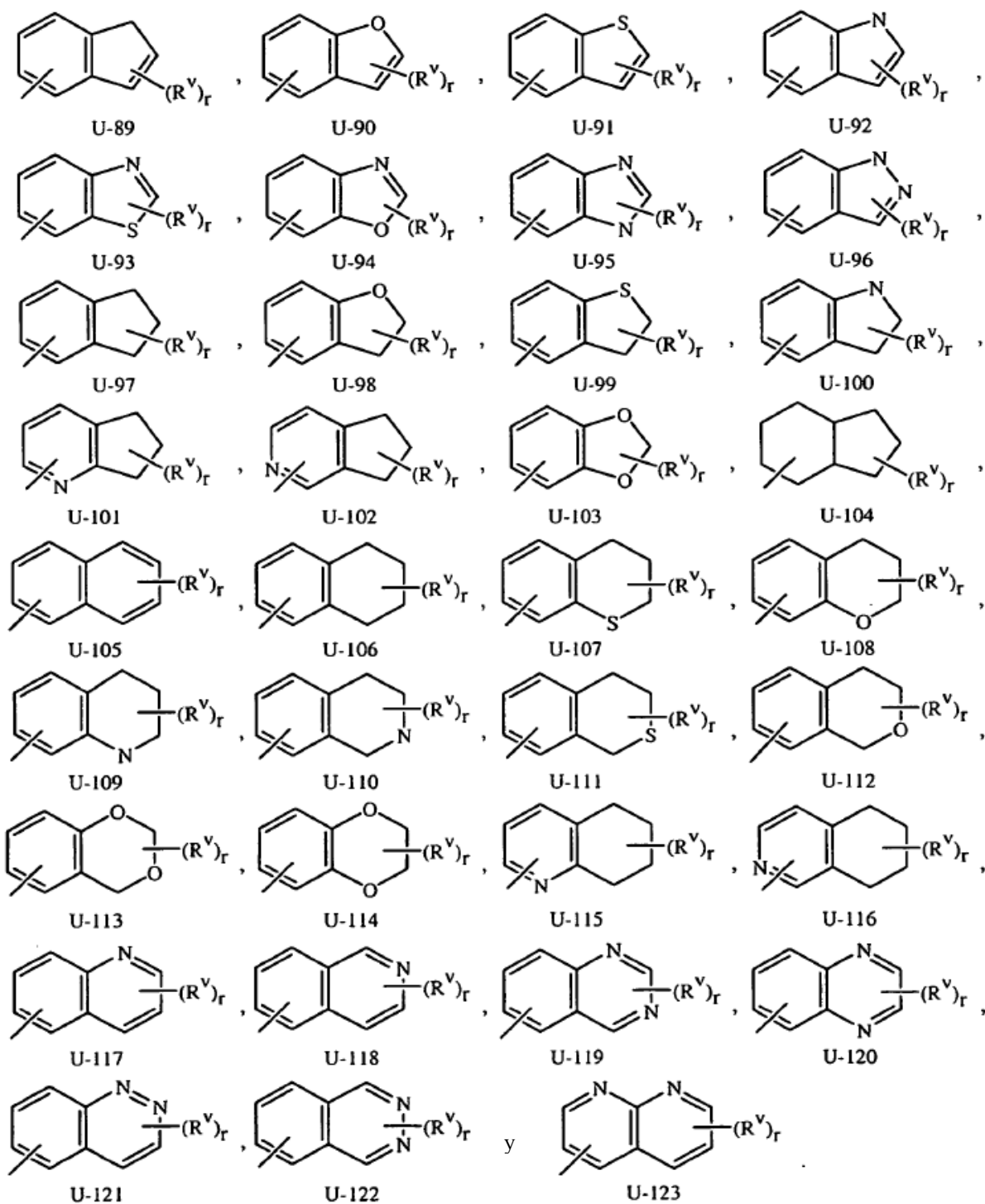




5 Tal como se indica más arriba, J puede ser (entre otros) un sistema anular bicíclico fusionado de 8, 9 o 10 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes según lo que se define en el Compendio de la Invención (es decir R^{13}). Los ejemplos de sistema anular bicíclico fusionado de 8, 9 o 10 miembros opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes incluyen los anillos U-81 a U-123 ilustrados en el Objeto Expuesto 3 en el que R^v es cualquier sustituyente según lo que se define en el Compendio de la Invención para J (es decir R^{13}), y r es típicamente un número entero de 0 a 5.

Objeto Expuesto 3





Aunque los grupos R^V se muestran en las estructuras U-1 a U-123, se observa que no necesitan estar presentes ya que son sustituyentes opcionales. Los átomos de nitrógeno que requieren sustitución para llenar su valencia son sustituidos con H o R^V . Obsérvese que cuando el punto de unión entre $(R^V)_r$ y el grupo U se ilustra como flotando, (R^V)_r puede unirse a cualquier átomo de carbono o átomo de nitrógeno disponible del grupo U. Obsérvese que cuando el punto de unión en el grupo U se ilustra como flotando, el grupo U puede unirse al resto de la Fórmula 1 a través de cualquier carbono o nitrógeno del grupo U por reemplazo de un átomo de hidrógeno. Obsérvese que algunos grupos U solamente pueden ser sustituidos con menos de 4 grupos R^V (por ejemplo, U-2 a U-5, U-7 a U-48, y U-52 a U-61).

10 Una amplia variedad de procedimientos sintéticos son conocidos en la técnica para permitir la preparación de anillos y sistema anulares heterocíclicos aromáticos y no aromáticos; para revisiones extensas véase el set de volumen ocho de Comprehensive Heterocyclic Chemistry, A. R. Katritzky y C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press,

Oxford, 1984 y el et volumen doce de Comprehensive Heterocyclic Chemistry II, A. R. Katritzky, C. W. Rees y E. F. V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996.

Los compuestos de la presente invención pueden existir como uno o más estereoisómeros. Los diversos estereoisómeros incluyen enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros y isómeros geométricos. Aquel con experiencia en la técnica apreciará que un estereoisómero puede ser más activo y/o se pueden exhibir efectos beneficiosos cuando es enriquecido con respecto a otro/s estereoisómero/s o cuando se separa de otro/s estereoisómero/s. Adicionalmente, la persona con experiencia sabe como separar, enriquecer, y/o preparar electivamente dichos estereoisómeros. Los compuestos de la invención pueden estar presentes como una mezcla de estereoisómeros, estereoisómeros individuales o como una forma ópticamente activa.

- 5 Aquel con experiencia en la técnica apreciará que no todos los heterociclos que contienen nitrógeno pueden formar N-óxidos ya que el nitrógeno requiere un par solo disponible para la oxidación en el óxido; aquel con experiencia en la técnica reconocerá aquellos heterociclos que contienen nitrógeno que pueden formar N-óxidos. Aquel con experiencia en la técnica también reconocerá que la amina terciarias pueden formar N-óxidos. Los procedimientos sintéticos para la preparación de N-óxidos de heterociclos y aminas terciarias son muy bien conocidos por aquel con experiencia en la técnica incluyendo la oxidación de heterociclos y amina terciarias con ácidos de peroxi tales como ácido peracético y m-cloroperbenzoico (MCPBA), peróxido de hidrógeno, hidroperóxidos de alquilo tales como hidroperóxido de t-butilo, perborato de sodio, y dioxiranos tales como dimetildioxirano. Estos procedimientos para la preparación de N-óxidos se han descrito y revisado extensamente en la literatura, véase por ejemplo: T. L. Gilchrist in Comprehensive Organic Synthesis, volumen 7, páginas 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler y B. Stanovnik en Comprehensive Heterocyclic Chemistry, volumen 3, páginas 18-20, A. J. Boulton y A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett y B. R. T. Keene en Advances in Heterocyclic Chemistry, volumen 43, páginas 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler y B. Stanovnik en Advances in Heterocyclic Chemistry, volumen 9, páginas 285-291, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, Eds., Academic Press; y G. W. H. Cheeseman y E. S. G. Werstiuk in Advances in Heterocyclic Chemistry, volumen 22, páginas 390-392, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

- 30 Aquel con experiencia en la técnica reconoce que debido a que en el ambiente y en condiciones fisiológicas las sales de los compuestos químicos están en equilibrio con sus formas de no sales correspondientes, las sales comparten la utilidad biológica de las formas de n sales. De ese modo una amplia variedad de los compuestos de Fórmula 1 son útiles para el control de enfermedades de plantas provocadas por patógenos micóticos de plantas (es decir son apropiadas para uso agrícola). La sales de los compuestos de Fórmula 1 incluyen sales de adición ácida con ácidos inorgánicos u orgánicos tales como ácidos hidrobromico, hidroclicoro, nítrico, fosfórico, sulfúrico, acético, butírico, fumárico, láctico, maleico, malónico, oxálico, propiónico, salicílico, tartárico, 4-toluenosulfónico o valérico. Cuando un compuesto de Fórmula 1 contiene un resto ácido tal como un ácido carboxílico o fenol, las sales también incluyen aquellas formadas con bases orgánicas o inorgánicas tales como piridina, trietilamina o amoníaco, o amidas, hidruros, hidróxidos o carbonatos de sodio, potasio, litio, calcio, magnesio o bario. Por consiguiente, la presente invención comprende compuestos seleccionados de Fórmula 1, N-óxidos y sales del mismo apropiados para el uso agrícola.

Las Realizaciones de la presente invención tal como se describe en el Compendio de la Invención incluyen (cuando la Fórmula 1 tal como se utiliza en las siguientes Realizaciones incluye N-óxidos y sales del mismo):

- 40 Realización 1. Un compuesto de Fórmula 1 en la que R^1 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_4 , trialquilsililo C_3-C_6 o halotrialquilsililo C_3-C_6 .

Realización 1a. Un compuesto de la Realización 1 en la que R^1 es Halógeno, CN, alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , haloalquilo C_1-C_2 o haloalcoxi C_1-C_2 .

Realización 1b. Un compuesto de la Realización en la que R^1 es Halógeno, CN, alquilo C_1-C_2 o haloalquilo C_1-C_2 .

- 45 Realización 1c. Un compuesto de la Realización 1b en la que R^1 es F, Cl, Br, CN, metilo o haloalquilo C_1 .

Realización 1d. Un compuesto de la Realización 1c en la que R^1 es Cl o metilo.

Realización 2. Un compuesto de Fórmula 1 en la que R^2 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 o haloalquilo C_1-C_3 .

Realización 2a. Un compuesto de la Realización 2 en la que R^2 es H, halógeno, CN, metilo o trifluorometilo.

- 50 Realización 2b. Un compuesto de la Realización 2a en la que R^2 es H o halógeno.

Realización 2c. Un compuesto de la Realización 2b en la que R^2 es H, F o Cl.

Realización 2d. Un compuesto de la Realización 2c en la que R^2 es H.

Realización 3. Un compuesto de Fórmula 1 en la que R^3 es H, alquilo C_1-C_2 , haloalquilo C_1-C_2 , alquilcarbonilo C_2-C_3 o haloalquilcarbonilo C_2-C_3 .

- Realización 3a. Un compuesto de la Realización 3 en la que R^3 es H, alquilo C1-C2 o haloalquilo C1-C2.
- Realización 3b. Un compuesto de la Realización 3a en la que R^3 es H.
- Realización 4. Un compuesto de Fórmula 1 en la que R^4 es alcoxi C1-C2, haloalcoxi C1-C2, cicloalcoxi C3-C4, alquilamino C1-C2, haloalquilamino C1-C2, dialquilamino C2-C4, halodialquilamino C2-C4 o cicloalquilamino C3-C4.
- 5 Realización 4a. Un compuesto de la Realización 4 en la que R^4 es alcoxi C1-C2, haloalcoxi C1-C2, alquilamino C1-C2 o dialquilamino C2-C4.
- Realización 4b. Un compuesto de la Realización 4a en la que R^4 es alcoxi C1-C2 o haloalcoxi C1-C2.
- Realización 4c. Un compuesto de la Realización 4b en la que R^4 es metoxi.
- Realización 5. Un compuesto de Fórmula 1 en la que W es O.
- 10 Realización 6. Un compuesto de Fórmula 1 en la que W es S.
- Realización 7. Un compuesto de Fórmula 1 en la que Q es $CR^{6a}R^{6b}$, o, NR7 o C=N-O-R⁷.
- Realización 7a. Un compuesto de Fórmula 1 en la que Q es $CR^{6a}R^{6b}$ o NR⁷.
- Realización 7b. Un compuesto de Fórmula 1 en la que Q es O o NR⁷.
- Realización 7c. Un compuesto de Fórmula 1 en la que Q es $CR^{6a}R^{6b}$.
- 15 Realización 7d. Un compuesto de Fórmula 1 en la que Q es NR⁷.
- Realización 7e. Un compuesto de Fórmula 1 en la que Q es C=N-O-R⁷.
- Realización 7f. Un compuesto de Fórmula 1 en la que R^{6a} y R^{6b} son independientemente H, halógeno, CN, alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₁-C₃.
- Realización 7g. Un compuesto de la Realización 7f en la que R^{6a} y R^{6b} son independientemente H, F, CN o metilo.
- 20 Realización 7h. Un compuesto de la Realización 7g en la que R^{6a} y R^{6b} son H.
- Realización 8. Un compuesto de Fórmula 1 en la que R^7 es H, alquilo C1-C2, haloalquilo C1-C2, alquilcarbonilo C2-C3 o haloalquilcarbonilo C2-C3.
- Realización 9. Un compuesto de la Realización 8 en la que R^7 es H, metilo, haloalquilo C₁-C₃, acetilo o haloacetilo.
- Realización 10. Un compuesto de la Realización 9 en la que R^7 es H.
- 25 Realización 11. Un compuesto de Fórmula 1 en la que Y es $-C(R^5)_7N_7O-(CR^{8a}R^{8b})_p X-(CR^{9a}R^{9b})_q SiR^{10a}R^{10b}R^{10c}$.
- Realización 11 a. Un compuesto de Fórmula 1 en la que p es 0.
- Realización 12. Un compuesto de Fórmula 1 en la que R^5 es alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₁-C₃.
- Realización 12a. Un compuesto de la Realización 12 en la que R^5 es alquilo C₁-C₃.
- Realización 12b. Un compuesto de la Realización 12a en la que R^5 es metilo.
- 30 Realización 13. Un compuesto de la Realización 12 en la que R^5 es haloalquilo C₁-C₃.
- Realización 14. Un compuesto de Fórmula 1 en la que p y q son independientemente un número entero de 0 a 3.
- Realización 15. Un compuesto de Fórmula 1 en la que cada R^{8a} y R^{9a} es independientemente H, OH, CN, halógeno, alquilo C₁-C₅, haloalquilo C₁-C₅ o alcoxi C₁-C₅.
- 35 Realización 16. Un compuesto de la Realización 15 en la que cada R^{8a} y R^{9a} es independientemente H, halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃ o alcoxi C₁-C₃.
- Realización 17. Un compuesto de Fórmula 1 en la que cada R^{10a} , R^{10b} y R^{10c} es independientemente alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcocalquilo C₂-C₈, haloalcocalquilo C₂-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alquilcicloalquilalquilo C₅-C₁₀ o J.
- Realización 17a. Un compuesto de Fórmula 1 en la que J es independientemente un anillo fenilo, o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, o un anillo heterocíclico o carbocíclico no aromático de 3 a 6 miembros, incluyendo cada uno opcionalmente miembros anulares seleccionados del grupo que consiste en C(=O), C(=S), C(=NR¹¹), NR11, $SiR^{12a}R^{12b}$ y S(=O)_n(=NR11)Z; cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes
- 40

independientemente seleccionados de R13.

Realización 18. Un compuesto de la Realización 17 en la que cada R^{10a} , R^{10b} y R^{10c} es independientemente alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoialquilo C_2-C_8 , haloalcoialquilo C_2-C_8 , cicloalquilo C_3-C_6 o alquilcicloalquilalquilo C_5-C_{10} .

5 Realización 19. Un compuesto de Fórmula 1 en la que X es un enlace directo, O o $C(=O)$; o un anillo fenilo; o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un anillo heterocíclico o carbocíclico no aromático de 3 a 6 miembros, cada uno incluyendo opcionalmente miembros anulares seleccionados del grupo que consiste en $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^{11})$, NR^{11} , $SiR^{12a}R^{12b}$ o $S(=O)_u(=NR^{11})_z$; cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes independientemente seleccionados de R13.

10 Realización 19a. Un compuesto de Fórmula 1 en la que X es un enlace directo.

Realización 20. Un compuesto de Fórmula 1 en la que cada R^1 es independientemente H, CN, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_{10} , alquilcarbonilo C_2-C_6 o haloalquilcarbonilo C_2-C_6 .

Realización 21. Un compuesto de Fórmula 1 en la que cada R^{12a} y R^{12b} es independientemente alquilo C_1-C_5 o haloalquilo C_1-C_5 .

15 Realización 22. Un compuesto de Fórmula 1 en la que cada R^{13} es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alquilcicloalquilo C_4-C_7 , haloalquilo C_1-C_6 , ciano, alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , alquilcarbonilo C_2-C_6 , alcoxycarbonilo C_2-C_6 , alquilaminocarbonilo C_2-C_6 o dialquilaminocarbonilo C_3-C_6 .

20 Realización 23. Un compuesto de la Realización 22 en la que cada R^{13} es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , ciano, alcoxi C_1-C_6 , o haloalcoxi C_1-C_6 .

Realización 24. Un compuesto de Fórmula 1 en la que V es NR^3 .

Realización 25. Un compuesto de Fórmula 1 en la que V es un enlace directo y Q $C(=N)-OR^7$ o $C(=O)$.

25 Las Realizaciones de la presente invención, que incluyen las Realizaciones 1-25 de más arriba así como cualquier otra Realización descrita en la presente memoria, puede combinarse de cualquier manera, y las descripciones de las variables en las Realizaciones pertenece no sólo a los compuestos de Fórmula 1 sino también a los compuestos de partida y compuestos intermedios útiles para la preparación de los compuestos de Fórmula 1. Además, las Realizaciones de la presente invención, que incluyen las Realizaciones 1-25 de más arriba así como cualquier otra Realización descrita en la presente memoria, y cualquier combinación de las mismas, pertenecen a las composiciones y procedimientos de la presente invención.

30 Las combinaciones de las Realizaciones 1-25 se ilustran mediante:

Realización A. Un compuesto de Fórmula I en la que

R^1 es halógeno, CN, alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , haloalquilo C_1-C_2 , o haloalcoxi C_1-C_2 ;

R^2 es H, halógeno, CN, metilo o trifluorometilo;

V es NR^3 ;

35 R^3 es H, alquilo C_1-C_2 , haloalquilo C_1-C_2 , alquilcarbonilo C_2-C_3 o haloalquilcarbonilo C_2-C_3 ;

R^4 es alcoxi C_1-C_2 , haloalcoxi C_1-C_2 , alquilamino C_1-C_2 o dialquilamino C_2-C_4 ;

W es O;

Q es $CR^{6a}R^{6b}$, $C=N-O-R^7$, O o NR^7 ;

R^5 es alquilo C_1-C_3 o haloalquilo C_1-C_3 ; y

40 Y es $-C(R^5)=N-O-(CR^{8a}R^{8b})_p X-(CR^{9a}R^{9b})_q SiR^{10a}R^{10b}R^{10c}$.

Realización A1. Un compuesto de la Realización A en la que

R^1 es F, Cl, Br, CN, metilo o haloalquilo C_1 ;

R^2 es H, F o Cl;

R^3 es H, alquilo C_1-C_2 o haloalquilo C_1-C_2 ;

45 R^4 es alcoxi C_1-C_2 o haloalcoxi C_1-C_2 ;

Q es CR^{6a}R^{6b} o NR⁷;

R⁵ es alquilo C₁-C₃;

p es 0; y

X es enlace directo.

5 Realización A2. Un compuesto de la Realización A1 en la que

R¹ es Cl o metilo;

R² es H;

R³ es H;

R⁴ es metoxi;

10 Q es CR^{6a}R^{6b}; y

R⁵ es metilo.

Las Realizaciones específicas incluyen los compuestos de Fórmula 1 seleccionados de los grupos que consisten en:

N-[[2-cloro-5-[1-[[2-(trimetilsilil)etoxi]imino]etil]fenil]-metil]carbamato de metilo;

N-[[2-cloro-5-[1-[[2-(trimetilsilil)propoxi]imino]etil]fenil]-metil] carbamato de metilo;

15 N-[[2-cloro-5-[1-[[2-(trimetilsilil)metoxi]imino]etil]fenil]-metil] carbamato de metilo; y

N-[[2-cloro-5-[1-[[2-(etildimetilsilil)metoxi]imino]etil]fenil]-metil] carbamato de metilo.

La presente invención proporciona una composición fungicida que comprende un compuesto de Fórmula 1 (que incluye todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, N-óxidos, y sales del mismo), y al menos otro fungicida. Cabe mencionar que las Realizaciones de dichas composiciones son composiciones que comprenden un compuesto correspondiente a cualquiera de las Realizaciones del compuesto descritas más arriba.

20 La presente invención proporciona una composición fungicida que comprende una cantidad fungicidamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1 (que incluye todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, N-óxidos, y sales del mismo), y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. Cabe mencionar que las Realizaciones de dichas composiciones, son composiciones que comprenden un compuesto correspondiente a cualquiera de las Realizaciones del compuesto descritas más arriba.

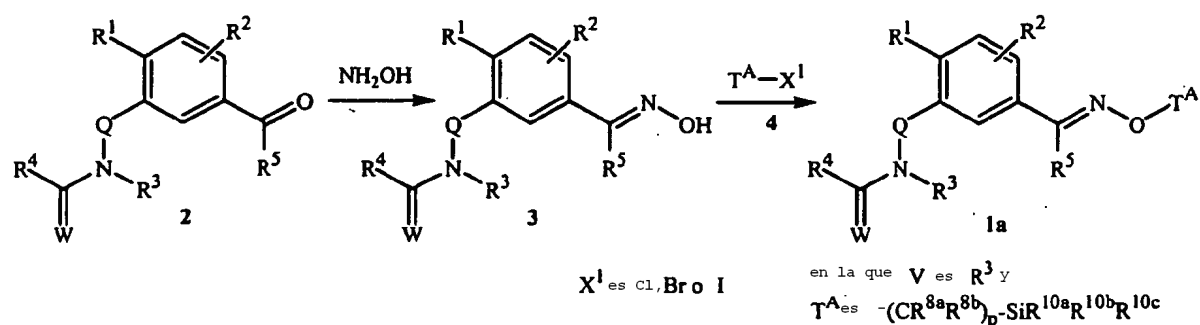
25 La presente invención proporciona un procedimiento para controlar enfermedades de plantas provocadas por patógeno micóticos de plantas que comprende aplicar a la planta o parte de la misma, o a la semilla de la planta, una cantidad fungicidamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1 (que incluyen todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, N-óxidos, y sales del mismo). Cabe mencionar que la realización de dichos procedimientos son procedimientos que comprenden aplicar una cantidad fungicidamente efectiva de un compuesto correspondiente a cualquiera de las Realizaciones del compuesto descritas más arriba. Cabe mencionar particularmente las Realizaciones en las que los compuestos se aplican como composiciones de la presente invención.

30 Uno o más de los siguientes procedimientos y variaciones según lo que se describe en los Esquemas 1-2, 4-8, 10 y 20 pueden utilizarse para preparar los compuestos de Fórmula 1. Las definiciones de R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R^{6a}, R^{6b}, R^{8a}, R^{8b}, R^{9a}, R^{9b}, R^{10a}, R^{10b}, R^{10c}, W, Q, X, Y, p y q en los compuestos de Fórmulas 1, 6, 8-12, 14-16, 19 y 29-30 más abajo son según lo que se define más arriba en el Compendio de la Invención a menos que se indique lo contrario. Los compuestos de Fórmulas 1a, 1d, 1k y 1m son varios subconjuntos de la Fórmula 1, y todos los sustituyentes para las Fórmulas 1a, 1d, 1k y 1m son según lo que se define más arriba para la Fórmula 1 a menos que se indique lo contrario. La Fórmula 2a es un subconjunto de la Fórmula 2, Fórmula 6a es un subconjunto de la Fórmula 6, Fórmula 8a es un subconjunto de la Fórmula 8 y Fórmula 10a es un subconjunto de la Fórmula 10.

35 Tal como se muestra en el Esquema 1 ciertos compuestos de Fórmula 1a, (Fórmula 1 en la que V es NR³ e Y es -C(RS)=N-O-(CR^{8a}R^{8b})_p-X(CR^{9a}R^{9b})_q-SiR^{10a}R^{10b}R^{10c}), pueden prepararse haciendo reaccionar primero un compuesto de Fórmula 2 con hidroxilamina a temperaturas que varían de aproximadamente 50 a aproximadamente 100 °C en un disolvente de alcohol inferior tal como metanol o etanol, que opcionalmente puede contener agua. La oxima resultante de Fórmula 3 después puede alquilarse con un haluro de alquilo terminal de Fórmula 4 en la que T^A es -(CR^{8a}R^{8b})_p-X(CR^{9a}R^{9b})_q-SiR^{10a}R^{10b}R^{10c} y X¹ es un grupo saliente tal como haluro (es decir Cl, Br, I) en un disolvente aprótico polar tal como N,N-dimetilformamida en presencia de una base inorgánica tal como carbonato de potasio o hidruro de sodio a temperaturas que varían de aproximadamente 50 a aproximadamente 120 °C. El procedimiento del Esquema 1 se ilustra en el Ejemplo 2.

50

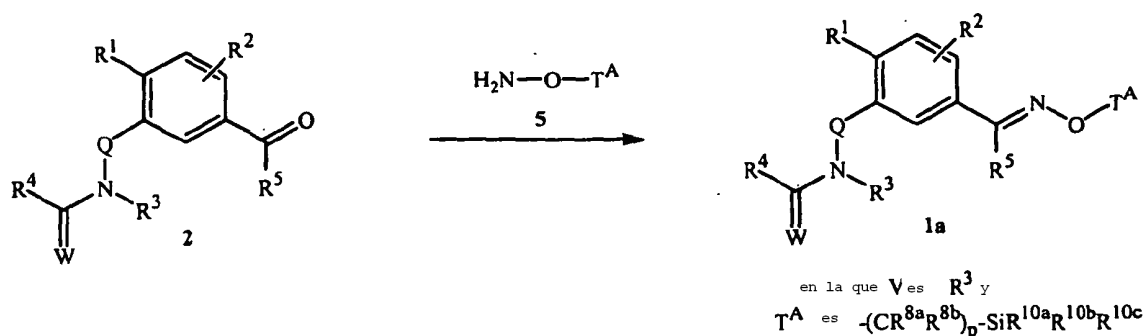
Esquema 1



Alternativamente, los compuestos de Fórmula 1a pueden prepararse haciendo reaccionar un derivado de hidroxilamina de Fórmula 5 o sal del mismo con un compuesto de Fórmula 2 en un disolvente de alcohol inferior a temperaturas que varían de aproximadamente 50 a aproximadamente 100 °C tal como se muestra en el Esquema 2. Como referencia que ilustra este tipo de reacción véase, por ejemplo, de Lijser et al., J. Organic Chem. 2004, 69, 3057-3067. El procedimiento del Esquema 2 también se ilustra en el Ejemplo 1.

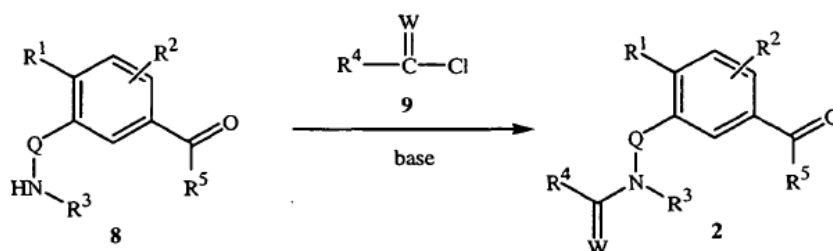
Para referencia general de la síntesis de los compuestos de Fórmula 5 véase Kikugawa et al., Organic Preparations and Procedures International, 1994, 26(1), 111-113.

Esquema 2



Tal como se muestra en el Esquema 4, los compuestos de Fórmula 2 pueden prepararse haciendo reaccionar una amina sustituida de Fórmula 8 en un cloruro de ácido de Fórmula 9 en presencia de una base tal como trietilamina o piridina. La reacción puede llevarse a cabo sin disolvente distinto de los compuestos de Fórmulas 6a, 9 y la base o en un disolvente aprótico tal como diclorometano, cloroformo, dietil éter o tetrahidrofurano a temperaturas que varían de aproximadamente 0 a aproximadamente 50 °C. Para referencia relacionada véase la Publicación de Patente Europea EP 1586552. Para una síntesis general de los compuestos de Fórmula 9, véase Advanced Organic Synthesis, 4ª Edición, Wiley & Sons 1992, 437, y referencias citadas en el mismo. Para la síntesis de un compuesto de Fórmula 2 en la que Q es NR⁷ y R⁷ es H véase la Publicación de Patente Mundial WO 2004/037770, y también véase la Etapa B del Ejemplo 1.

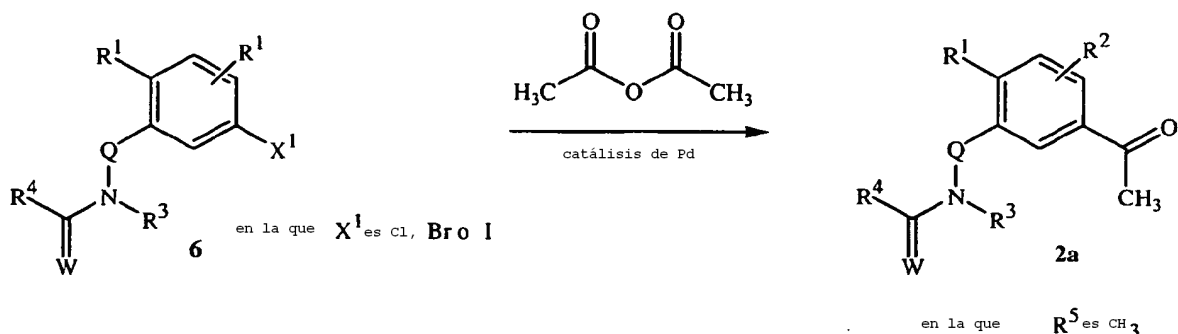
Esquema 4



Adicionalmente, los compuestos de Fórmula 2a (Fórmula 2 en la que R⁵ es CH₃) pueden prepararse a partir de compuestos de Fórmula 6 mediante la reacción con anhídrido acético en presencia de una catálisis de paladio tal como se muestra en el Esquema 5. Para referencia que ilustra el procedimiento del Esquema 5 véase, por ejemplo,

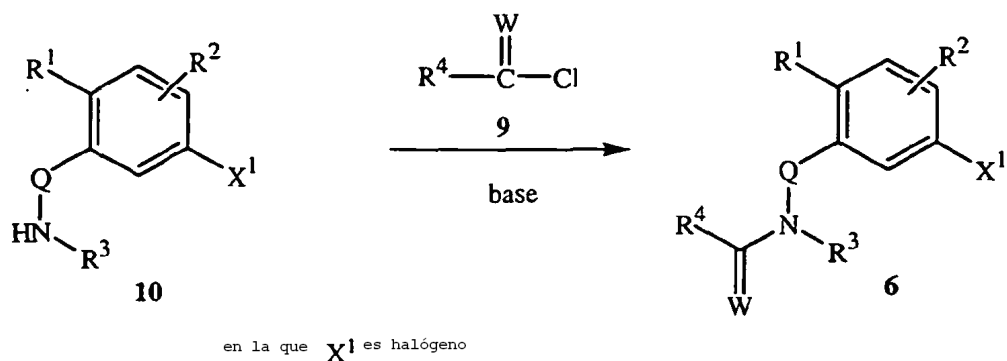
Cacchi et al., Organic Letters 2003, 5(3), 289-291.

Esquema 5



5 Tal como se muestra en el Esquema 6, los compuestos de Fórmula 6 pueden prepararse a partir de aminas de Fórmula 10 mediante un procedimiento análogo al Esquema 4. También, la Patente Estadounidense 6.313.071 describe el procedimiento del Esquema 6 cuando Q es CH_2 . Adicionalmente, la Patente Estadounidense 6.313.071 describe un procedimiento alternativo para preparar ciertos compuestos de Fórmula 6 cuando Q es CH_2 , incluyendo primero la preparación de un isocianato a partir de la amina de Fórmula 10 y después haciendo reaccionar el isocianato con un compuesto de Fórmula R^4H en la que R^4 es alcoxi o alquilamino para proporcionar un compuesto de Fórmula 6. Para la síntesis de un compuesto de Fórmula 6 en la que Q es NR^7 y R^7 es H véase la Etapa C del Ejemplo 1.

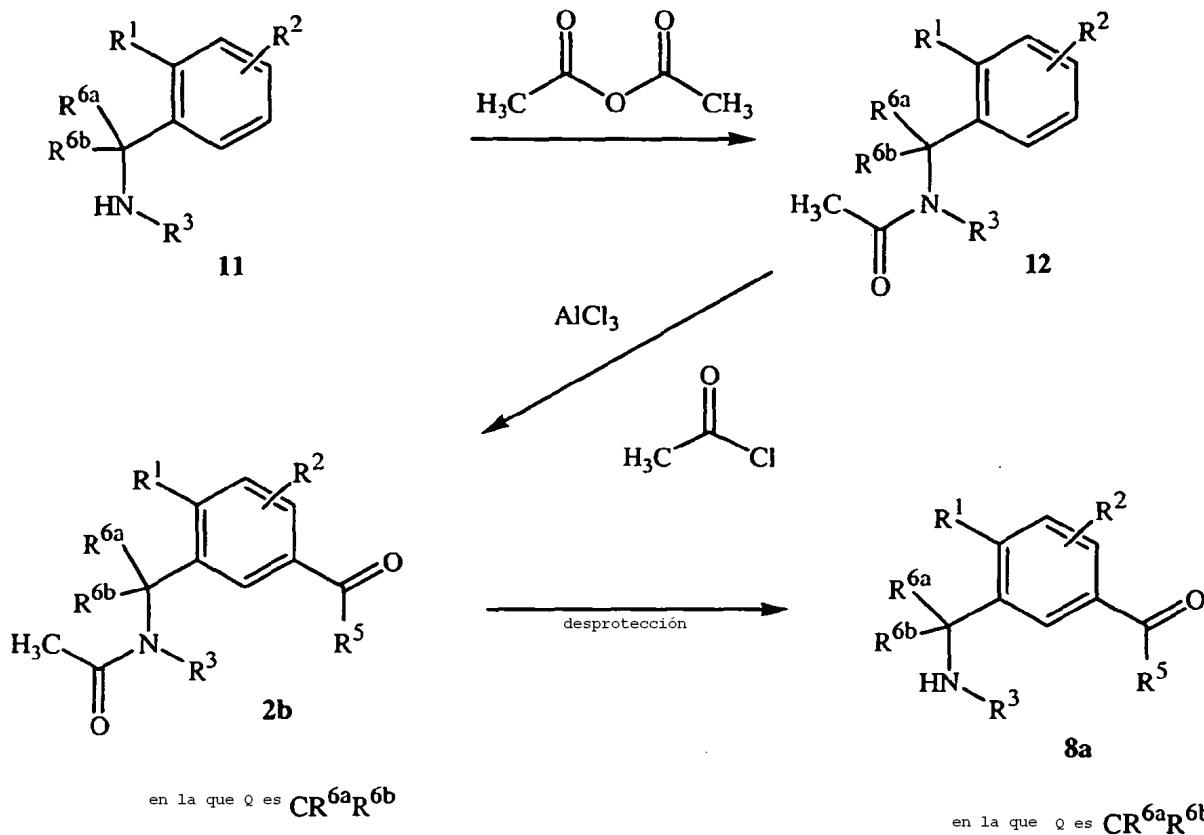
Esquema 6



15 Los Compuestos de Fórmula 8a (Fórmula 8 en la que Q es $CR^{6a}R^{6b}$) pueden prepararse mediante un procedimiento simple de tres etapas a partir de las aminas de Fórmula 11 según lo detallado en el Esquema 7. Las aminas de Fórmula 11 son conocidas o pueden sintetizarse fácilmente mediante los procedimientos conocidos para aquel con experiencia en la técnica. En la primera etapa, una amina de Fórmula 11 se hace reaccionar con anhídrido acético con o sin un disolvente aprótico tal como diclorometano, cloroformo, dietil éter o tetrahidrofurano a temperaturas que varían de aproximadamente 0 a aproximadamente 100 °C, en presencia de una base tal como trietilamina o piridina con o sin un catalizador nucleofílico tal como 4-dimetilaminopiridina para proporcionar un compuesto de Fórmula 12. El compuesto de Fórmula 12 después puede hacerse reaccionar en conformidad con las condiciones de Friedel-Crafts para proporcionar un compuesto de Fórmula 2b (Fórmula 2 en la que Q es $CR^{6a}R^{6b}$) que después puede desprotegerse para producir un compuesto de Fórmula 8a. Para las condiciones de reacción típicas véase la Publicación de Patente Europea EP 1586552.

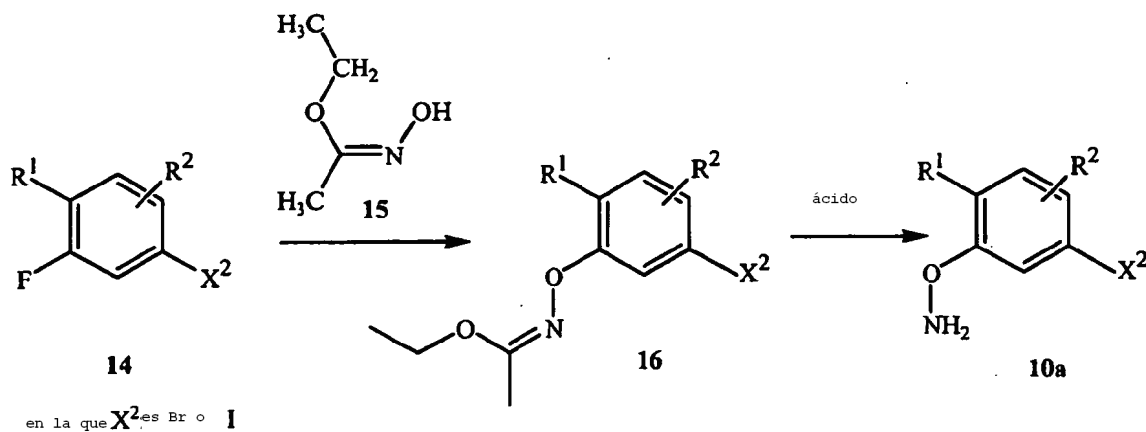
25

Esquema 7



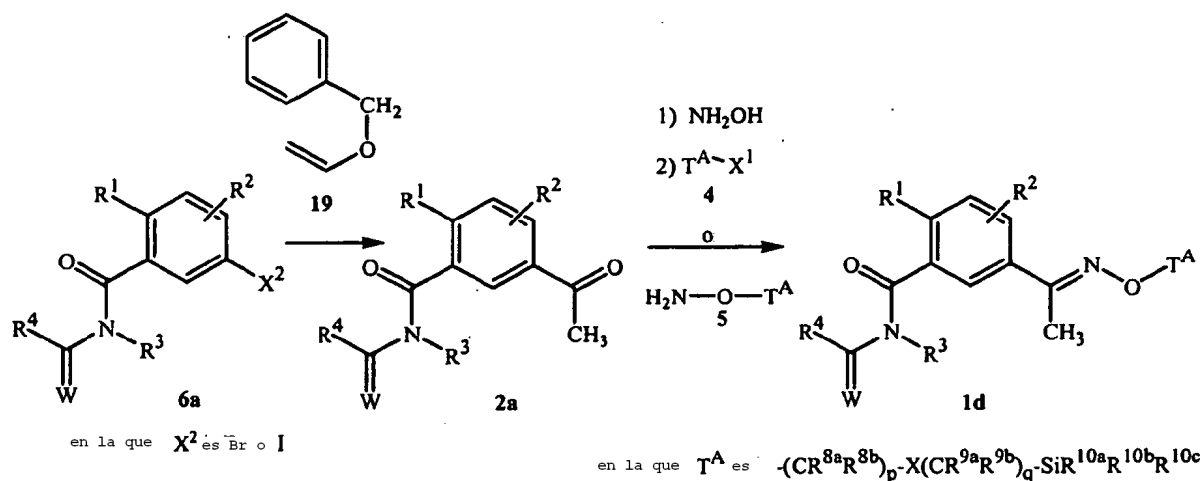
Los Compuestos de Fórmula 10 son conocidos o pueden sintetizarse fácilmente mediante procedimientos generales conocidos para aquel con experiencia en la técnica. Por ejemplo, los compuestos de Fórmula 10a (Fórmula 10 en la que Q es O y R^3 es H) pueden prepararse a partir de derivados de fluorobenceno simples de Fórmula 14 tal como se muestra en el Esquema 8. La reacción de un compuesto de Fórmula 14 con un acetohidroxamato de Fórmula 15 típicamente se lleva a cabo en un disolvente aprótico polar tal como N,N-dimetilformamida en presencia de una base apropiada tal como terc-butóxido de potasio o hidruro de sodio a temperaturas que varían de aproximadamente -10 a 120 °C. El compuesto resultante de Fórmula 16 después desprotegerse utilizando un ácido fuerte tal como ácido perclórico a temperaturas que varían de aproximadamente -10 a aproximadamente 40 °C para dar un compuesto de Fórmula 10a (para una referencia relevante véase, por ejemplo, Kikugawa et al., Organic Preparations and Procedures International 1997, 29(5), 594-600).

Esquema 8



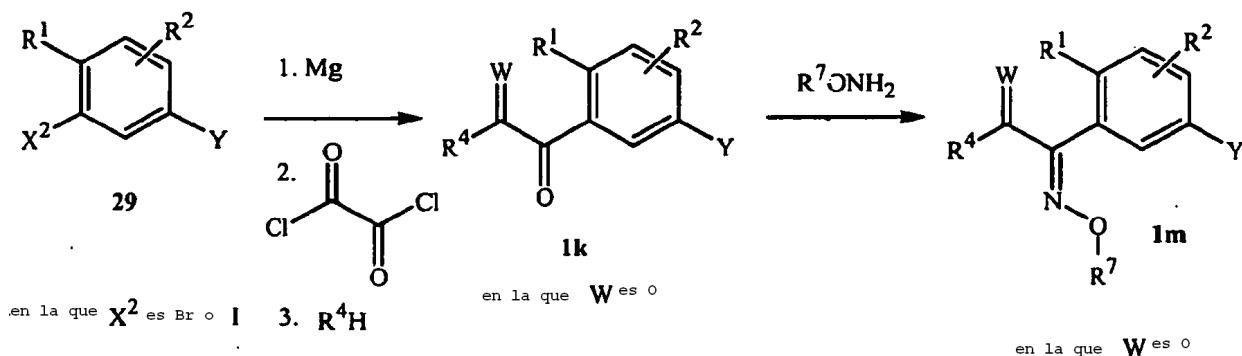
- 5 Los Compuestos de Fórmula 1d (Fórmula 1 en la que Y es $-\text{C}(\text{R}^5)=\text{N}-\text{O}-(\text{CR}^{8a}\text{R}^{8b})_p\text{X}-(\text{CR}^{9a}\text{R}^{9b})_q\text{SiR}^{10a}\text{R}^{10b}\text{R}^{10c}$ y R^5 es CH_3) pueden prepararse tal como se muestra en el Esquema 10. El procedimiento primero incluye hacer reaccionar un compuesto de Fórmula 6a con un éter de vinilo de Fórmula 19 en presencia de una catálisis de paladio en conformidad con los procedimientos generales informados en la literatura (véase, por ejemplo, Xiao et al., J. Organic Chem. 2006, 71, 7467-7470) para dar un compuesto de Fórmula 2a. El compuesto de Fórmula 2a después puede convertirse en un compuesto de Fórmula 1d en conformidad con el procedimiento del Esquema 1 o 2.

Esquema 10

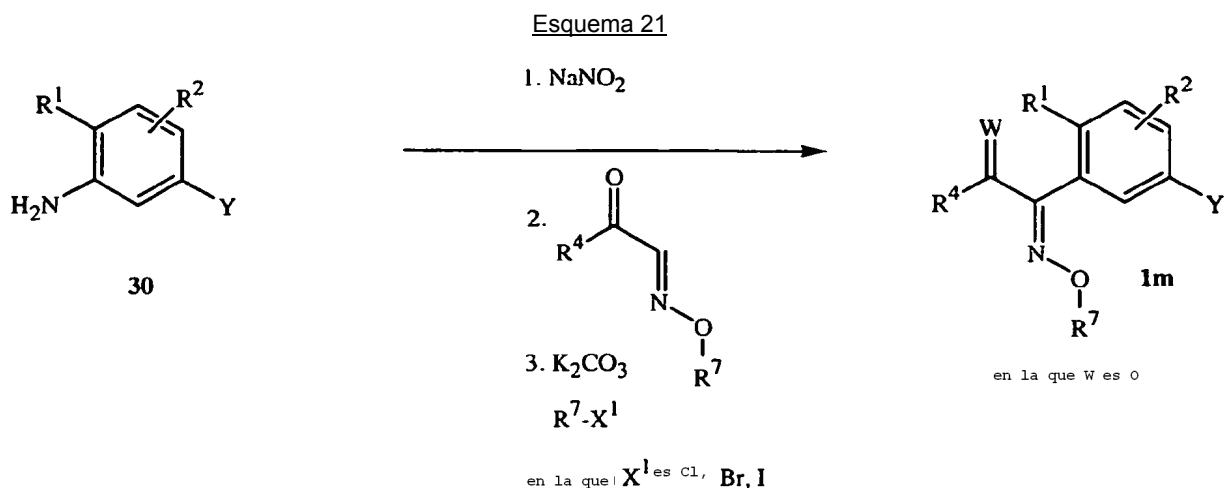


- 10 Tal como se muestra en el Esquema 20, ciertos compuestos de Fórmula 1k (Fórmula 1 en la que Q es $\text{C}(\text{=O})$ y V es un enlace directo) en la que W es O pueden prepararse en conformidad con el procedimiento divulgado en la Publicación de Patente Mundial WO 99/28305 y por Walker, *Chimia* 2003, 57(11), 675-679. Las condiciones de reacción para el procedimiento del Esquema 20 para la preparación de un compuesto de Fórmula 1k también se ilustran en la Etapa D del Ejemplo de referencia 12. Los Compuestos de Fórmula 1k son intermediarios útiles para la preparación de ciertos compuestos de Fórmula 1m (Fórmula 1 en la que Q es $\text{C}(\text{=N})-\text{OR}^7$ y V es un enlace directo) en la que W es O . Para referencias guía relevantes de este tipo de reacción véase, por ejemplo, la Publicación de Patente Mundial WO 99/28305 y por Walker, *Chimia* 2003, 57(11), 675-679. También, el procedimiento del Esquema 20 para la preparación de un compuesto de Fórmula 1m se ilustra en el Ejemplo de Referencia 13.

Esquema 20



- 20 Alternativamente, un compuesto de Fórmula 1m también puede prepararse tal como se muestra en el Esquema 21. El procedimiento del Esquema 21 se describe en la Publicación de Patente Mundial WO 99/28305 y mediante Walker, *Chimia* 2003, 57(11), 675-679.



5 Aquel con experiencia en la técnica reconocerá que ciertos compuestos de Fórmula 1m en la que R^4 es un grupo alcoxi puede convertirse en el correspondiente compuesto de alquilamino mediante el tratamiento de Fórmula 1m con una amina de Fórmula R^4NH_2 . Para este tipo de transformación, uno o más equivalentes de la amina (es decir R^4NH_2) pueden utilizarse con respecto a la Fórmula 1m. Alternativamente pueden utilizarse un equivalente de la amina y un barredor de ácido (por ejemplo, trietilamina). La reacción puede hacerse correr con o sin disolvente, incluyendo la utilización de la amina como disolvente, a temperaturas que varían entre aproximadamente temperatura ambiente y el punto de ebullición normal del disolvente. Aquel con experiencia en la técnica entiende que cuando la amina se utiliza como disolvente la misma estará en gran exceso estequiométrico respecto del compuesto de Fórmula 1m (el Ejemplo 14 ilustra este procedimiento).

15 Adicionalmente, aquel con experiencia en la técnica reconocerá que los compuestos de Fórmula 1m en la que W es O pueden convertirse en las correspondientes tioamidas en las que W es S utilizando una variedad de reactivos de tiación estándar tal como pentasulfuro fosforoso o 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3-ditia-2,4-difosfetano-2,4-disulfuro (reactivo de Lawesson).

20 Se reconoce que algunos reactivos y condiciones de reacción descrita más arriba para la preparación de los compuestos de Fórmula 1 pueden no ser compatibles con ciertas funcionalidades presentes en los intermediarios. En estos casos, la incorporación de secuencias de protección/desprotección o interconversiones de grupos funcionales en la síntesis ayudará en la obtención de los productos deseados. El uso y elección de los grupos protectores será evidente para aquel con experiencia en la síntesis química (véase, por ejemplo, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. Protective Groups in Organic Synthesis, 2^o edición.; Wiley: Nueva York, 1991). Aquel con experiencia en la técnica reconocerá que, en algunos casos, después de la introducción de un reactivo dado tal como se describe en cualquier esquema individual, puede ser necesario realizar etapas sintéticas de rutina adicionales no descritas en detalle para completar la síntesis de los compuestos de Fórmula 1. Aquel con experiencia en la técnica también reconocerá que puede ser necesario realizar una combinación de las etapas ilustradas en los esquemas de más arriba en un orden distinto de aquel implicado por la secuencia particular presentada para preparar los compuestos de Fórmula 1.

30 Aquel con experiencia en la técnica también reconocerá que los compuestos de Fórmula 1 y los intermediarios descritos en la presente memoria pueden someterse a diversas reacciones electrofílicas, nucleofílicas, radicales, organometálicas, oxidación, y reducción para añadir sustituyentes o modificar los sustituyentes existentes.

35 Sin elaboración adicional, se cree que aquel con experiencia en la técnica utilizando la descripción precedente puede utilizar la presente invención en una medida más completa. Los siguientes Ejemplos por ello deben interpretarse como meramente ilustrativos y no restrictivos de la divulgación de ninguna manera. La Etapa en los siguientes Ejemplos ilustran un procedimiento para cada etapa en una transformación sintética general, y el material de partida para cada etapa puede no haber ido necesariamente preparado mediante una corrida preparativa particular cuyo procedimiento se describe en otros Ejemplos o Etapas. Los porcentajes son en peso excepto para la mezcla de disolventes cromatográfica o donde se indique lo contrario. La parte y porcentajes para las mezclas de disolventes cromatográficas son en volumen a menos que se indique lo contrario. Los espectros de 1H RMN se informan en ppm campo abajo de tetrametilsilano; "s" significa singlete, "d" significa doblete, "t" significa triplete, "m" significa multiplete, "dd" significa doblete de dobletes, y "br s" significa singlete ancho.

Ejemplo 1

Preparación de N-[[2-cloro-5-[1-[[2-(trimetilsilil)etoxi]imino]etil]fenil]-metil]carbamato de metilo

Una solución de metil N-[(5-acetil-2-clorofenil)metil]acetamida (0,15 g, 0,62 mmol) (preparada en conformidad con el procedimiento proporcionado en la Publicación de Patente Europea EP 1586552) y hidrocloreuro de 3-

trimetilsililetilhidroxilamina (0,21 g, 1,2 mmol) en etanol (20 ml) se calentó a reflujo durante toda la noche. El etanol después se eliminó bajo presión reducida, y el aceite residual se purificó por cromatografía de líquidos por presión de medio (gradiente de 0 a 100% de acetato de etilo en hexanos como eluyente) para producir el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un aceite transparente (0,20 g).

- 5 ^1H RMN (CDCl_3): δ 7,66 (br s, 1H), 7,51 (m, 1H), 7,34 (d, 1H), 5,21 (br s, 1H), 4,46 (d, 2H), 4,28 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,09 (m, 2H), 0,06 (s, 9H),

Ejemplo 2

Preparación de N-[[2-cloro-5-[1-[[2-(trimetilsilil)propoxi]imino]etil]fenil]-metil]carbamato de metilo

10 A una solución de metilo N-[[5-acetil-2-clorofenil]metil]acetamida (0,5 g, 2,1 mmol) (preparada en conformidad con el procedimiento proporcionado en la Publicación de Patente Europea EP 1586552) en etanol (10 ml) se añadió una solución acuosa de hidroxilamina (50% en peso) (0,82 g, 12,4 mmol). La mezcla de la reacción se calentó a reflujo durante toda la noche, y después se concentró para proporcionar N-[[2-cloro-5-[1-(hidroxiimino)etil]fenil]metil]carbamato de metilo como un sólido blanco, que se utilizó sin purificación. A N,N-dimetilformamida (5,0 ml) se añadió N-[[2-cloro-5-[1-(hidroxiimino)etil]fenil]metil]carbamato de metilo (0,28 g, 1,1

15 mmol), 3-(cloropropil)trimetilsilano (0,33 g, 2,2 mmol) y carbonato de potasio (0,45 g, 3,3 mmol). Esta mezcla de reacción después se calentó a 100 °C durante toda la noche, y después se concentró bajo presión reducida. El aceite resultante se purificó por cromatografía de líquidos por presión de medio (gradiente de 0 a 100% de acetato de etilo en hexanos como eluyente) para producir el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un aceite transparente. (0,22 g).

- 20 ^1H RMN (CDCl_3): δ 7.66 (br s, 1 H), 7,52 (m, 1 H), 7,35 (m, 1 H), 5,18 (m, 1 H), 4,46 (d, H), 4,14 (m, 2 H), 3,69 (s, 3 H), 2,21 (s, 3 H), 1,71 (m, 2 H), 0,54 (m, 2 H), 0,01 (m, 9 H).

Ejemplo de referencia 12

Preparación de 2-metil-a-oxo-5-[1-[3-(trifluorometil)fenil]-1H-pirazol-3-il]bencenoacetato de metilo

Etapa A: Preparación de 1-(3-bromo-4-metil)-3-(dimetilamino)-2-propen-1-ona

25 Una solución de 3'-bromo-4'-metilacetofenona (15 g, 70,4 mmol) en N,N-dimetilformamida dimetil acetal (130 ml, 985 mmol) se calentó a reflujo durante toda la noche. La mezcla de la reacción se enfrió hasta temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. El aceite resultante (20,2 g) se cristalizó a partir de hexanos para obtener el compuesto del título como un sólido amarillo (15,97 g).

^1H RMN (CDCl_3): δ 8,0 (s, 1H), 7,8 (d, 1H), 7,7 (d, 1H), 7,2 (d, 1H), 5,6 (d, 1H), 3,1 (br s, 3H), 2,9 (br s, 3H).

30 Etapa B Preparación de 3-(3-bromo-4-metilfenil)-1H-pirazol

A una solución de 1-(3-bromo-4-metil)-3-(dimetilamino)-2-propen-1-ona (es decir el producto de la Etapa A) (15,97 g, 59,57 mmol) en etanol (150 ml) se añadió hidrazina monohidratada (14,4 ml, 299 mmol). La mezcla de la reacción se calentó a reflujo durante 2 horas, se enfrió hasta temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida. El sólido resultante se diluyó con hexanos y se filtró para proporcionar el compuesto del título como un sólido blanco (13,95 g).

^1H RMN (CDCl_3): δ 7,9 (s, 1H), 7,62 (d, 1H), 7,6 (d, 1H), 7,2 (d, 1H), 6,5 (d, 1H), 2,41 (s, 3H).

Etapa C Preparación de 3-(3-bromo-4-metilfenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1H-pirazol

40 A una solución agitada de 3-(3-bromo-4-metilfenil)-1H-pirazol (es decir el producto de la Etapa B) (5,0 g, 21,09 mmol) en p-dioxano (19 ml) bajo una atmósfera de nitrógeno se añadió 3-yodobenzotrifluoruro (5,75 g, 21,11 mmol), yoduro de cobre(I) (0,05 g, 0,262 mmol), trans-1,2-diaminociclohexano (253,5 μl ., 2,10 mmol) y carbonato de potasio (6,1 g, 44,14 mmol). La mezcla de reacción se calentó a 100 °C durante toda la noche, se enfrió hasta temperatura ambiente y se diluyó con agua y acetato de etilo. La mezcla resultante se separó, y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo (3x). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con ácido clorhídrico (1N), cloruro de sodio acuoso saturado, se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron bajo presión reducida para proporcionar un sólido (9 g). Se añadieron hexanos al sólido, y la mezcla se filtró para obtener el compuesto del título como un sólido (6.4 g).

45 ^1H RMN (CDCl_3): δ 8,08 (s, 1H), 8,0 (s, 2H), 7,99 (s, 1H), 7,7 (d, 1H), 7,6-7,5 (m, 2H), 7,3 (d, 1H), 6,7 (d, 1H), 2,4 (s, 3H).

Etapa D Preparación de 2-metil-a-oxo-5-[1-[3-(trifluorometil)fenil]-1H-pirazol-3-il]bencenoacetato de metilo

50 A una mezcla de virutas de magnesio (0,17 g, 6,98 mmol) y 1,2-dibromoetano (2 gotas) en tetrahidrofurano (0,5 ml) bajo una atmósfera de nitrógeno se añadió en gotas una solución de 3-(3-bromo-4-metilfenil)-1-[3-

(trifluorometil)fenil]-1H-pirazol (es decir el producto de la Etapa C) (2,0 g, 5,25 mmol) en tetrahidrofurano (3,5 ml). Después de que se había añadido aproximadamente el 2% del volumen total de la solución de 3-(3-bromo-4-metilfenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1H-pirazol, la adición se interrumpió y se añadió yodo (cantidad catalítica) a la mezcla de la reacción. La solución de 3-(3-bromo-4-metilfenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1H-pirazol restante después se añadió a la mezcla de la reacción durante 1 hora mientras se calentaba a reflujo. El calentamiento se continuó durante 45 minutos adicionales, y después la mezcla de la reacción se enfrió hasta temperatura ambiente. La mezcla de la reacción se añadió a través de un embudo de adición a una solución de cloruro de oxalilo (0,508 ml, 5,82 mmol) en tetrahidrofurano (6 ml) a -65 °C. Se continuó la agitación durante 2 horas a -65 °C, y después se añadió metanol (1,17 ml) a la mezcla de la reacción, y se permitió que la mezcla se caliente hasta temperatura ambiente y se agitó durante 2 horas. La mezcla de la reacción se diluyó con cloruro de amonio acuoso saturado (4 ml) y agua (8 ml) y después se extrajo con acetato de etilo (2X). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con cloruro de sodio acuoso saturado, se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron bajo presión reducida para dar un aceite. El aceite se purificó por cromatografía de líquidos por presión de medio (gradiente de 0 a 20% de acetato de etilo en hexanos como eluyente) para proporcionar un aceite (0,31 g). El aceite se cristalizó a partir de hexanos-dietil éter para proporcionar el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido (200 mg).

¹H RMN (CDCl₃): δ 8,2 (s, 1H), 8,1-8,0 (m, 3H), 7,9 (d, 1H), 7,6-7,5 (m, 2H), 7,4 (d, 1H), 6,8 (d, 1H), 4,0 (s, 3H), 2,6 (s, 3H).

Ejemplo de referencia 13

20 Preparación de metil α-(metoxiimino)-2-metil-5-[1-[3-(trifluorometil)fenil]-1H-pirazol-3-il]bencenoacetamida

Una mezcla de 2-metil-a-oxo-5-[1-[3-(trifluorometil)fenil]-1H-pirazol-3-il]bencenoacetato de metilo (es decir el producto de la Etapa D, Ejemplo 12) (0,184 g, 0,475 mmol) y hidrocioruro de O-metilhidroxilamina (0,048 g, 0,57 mmol) en metanol (2 ml) bajo una atmósfera de nitrógeno se calentó hasta reflujo durante toda la noche. La mezcla de la reacción se enfrió hasta temperatura ambiente, se diluyó con agua y diclorometano, las capas se separaron, y la capa acuosa se extrajo con diclorometano. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con cloruro de sodio acuoso saturado, se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron bajo presión reducida para dar un sólido (0,21 g). El sólido se purificó por cromatografía en columna flash utilizando un tubo Bond Elute® (fabricado por Varian) preequipado con 5 g de gel de sílice (50 de diámetro de partícula, 70 Å de tamaño de poro) y gradiente de 0 a 20% de acetato de etilo en hexanos como eluyente para proporcionar un sólido (180 mg). Los hexanos y dietil éter se añadieron al sólido, y la mezcla se filtró para proporcionar el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanco (120 mg).

¹H RMN (CDCl₃): δ 8,0 (s, 1H), 7,99 (d, 1H), 7,8 (d, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,6-7,5 (m, 2H), 7,3 (d, 1H), 6,7 (d, 1H), 4,07 (s, 3H), 3,89 (s, 3H), 2,23 (s, 3H).

Mediante los procedimientos descritos en la presente memoria junto con los procedimientos conocidos en la técnica, pueden prepararse los siguientes compuestos de las Tablas 1 a 10. Las siguientes abreviaciones se utilizan en las Tablas que siguen: i significa iso, c significa ciclo, n significa normal, s significa secundario, t significa terciario, Ac significa acetilo, Me significa metilo, Et significa etilo, Pr significa propilo, OMe significa metoxi, CN significa ciano, y Ph significa fenilo. los sustituyentes en el bencilo se unen al anillo fenilo del bencilo, y número locant para los sustituyentes son con respecto a la posición fenilo unida al componente metileno del bencilo. En las Tablas 1-3 el extremo izquierdo de los restos para V¹ están unido a O y el extremo derecho está unido a Si en la estructuras molecular detalladas. En las Tablas 1-3, V^a a Vⁿ tienen los siguientes significados según lo que se define más abajo en el Objeto Expuesto 4.

Objeto Expuesto 4

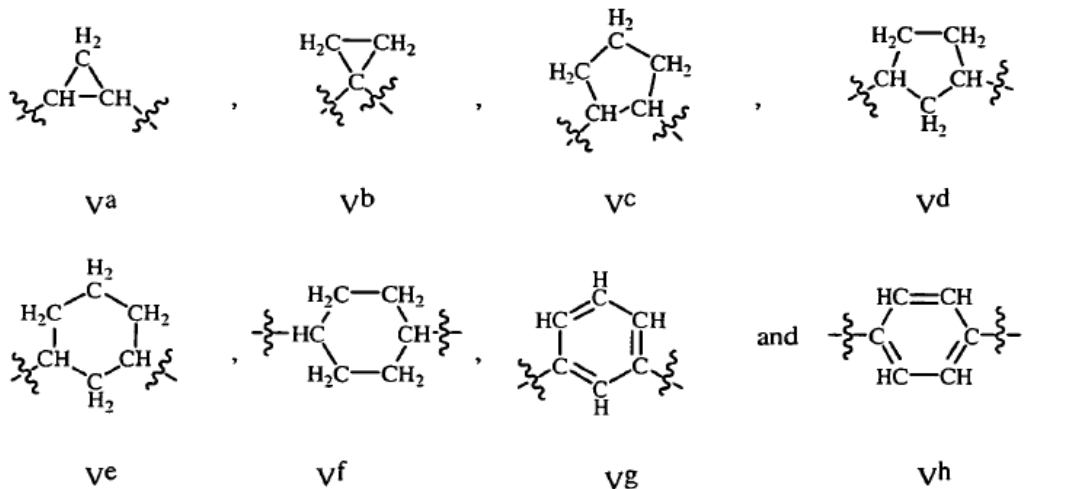
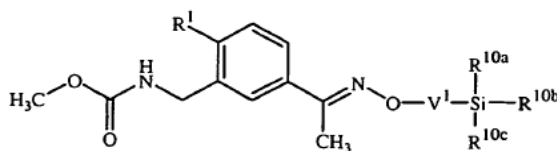


Tabla 1



R ¹	V ¹	R ^{10a}	R ^{10b}	R ^{10c}	R ¹	V ¹	R ^{10a}	R ^{10b}	R ^{10c}
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	Me	F	-CH(Me)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	Me	F	-CH(OMe)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	Me	F	-CH(Et)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Me	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Me	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Me
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	Me	F	-CH(CN)-	Me	Me	Me
Cl	V ^a	Me	Me	Me	F	V ^a	Me	Me	Me
Cl	V ^b	Me	Me	Me	F	V ^b	Me	Me	Me
Cl	V ^c	Me	Me	Me	F	V ^c	Me	Me	Me
Cl	V ^d	Me	Me	Me	F	V ^d	Me	Me	Me
Cl	V ^e	Me	Me	Me	F	V ^e	Me	Me	Me
Cl	V ^f	Me	Me	Me	F	V ^f	Me	Me	Me
Cl	V ^g	Me	Me	Me	F	V ^g	Me	Me	Me
Cl	V ^h	Me	Me	Me	F	V ^h	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	Et	F	-CH(Me)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	Et	F	-CH(OMe)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	Et	F	-CH(Et)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Et	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Et	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Et

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Et
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	Et	F	-CH(CN)-	Me	Me	Et
Cl	V ^a	Me	Me	Et	F	V ^a	Me	Me	Et
Cl	V ^b	Me	Me	Et	F	V ^b	Me	Me	Et
Cl	V ^c	Me	Me	Et	F	V ^c	Me	Me	Et
Cl	V ^d	Me	Me	Et	F	V ^d	Me	Me	Et
Cl	V ^e	Me	Me	Et	F	V ^e	Me	Me	Et
Cl	V ^f	Me	Me	Et	F	V ^f	Me	Me	Et
Cl	V ^g	Me	Me	Et	F	V ^g	Me	Me	Et
Cl	V ^h	Me	Me	Et	F	V ^h	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH(Me)-	Me	Et	Et	F	-CH(Me)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(OMe)-	Me	Et	Et	F	-CH(OMe)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Et)-	Me	Et	Et	F	-CH(Et)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	Et	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Et	Et	F	-CH(CF ₃)-	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	Et

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CHF-	Me	Et	Et
Cl	-CH(CN)-	Me	Et	Et	F	-CH(CN)-	Me	Et	Et
Cl	V ^a	Me	Et	Et	F	V ^a	Me	Et	Et
Cl	V ^b	Me	Et	Et	F	V ^b	Me	Et	Et
Cl	V ^c	Me	Et	Et	F	V ^e	Me	Et	Et
Cl	V ^d	Me	Et	Et	F	V ^d	Me	Et	Et
Cl	V ^e	Me	Et	Et	F	V ^e	Me	Et	Et
Cl	V ^f	Me	Et	Et	F	V ^f	Me	Et	Et
Cl	V ^g	Me	Et	Et	F	V ^g	Me	Et	Et
Cl	V ^h	Me	Et	Et	F	V ^h	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH(Me)-	Et	Et	Et	F	-CH(Me)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(OMe)-	Et	Et	Et	F	-CH(OMe)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Et)-	Et	Et	Et	F	-CH(Et)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(OCF ₃)-	Et	Et	Et	F	-CH(OCF ₃)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(CF ₃)-	Et	Et	Et	F	-CH(CF ₃)-	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CHF-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CHF-	Et	Et	Et
Cl	-CH(CN)-	Et	Et	Et	F	-CH(CN)-	Et	Et	Et
Cl	V ^a	Et	Et	Et	F	V ^a	Et	Et	Et

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	V ^b	Et	Et	Et	F	V ^b	Et	Et	Et
Cl	V ^c	Et	Et	Et	F	V ^c	Et	Et	Et
Cl	V ^d	Et	Et	Et	F	V ^d	Et	Et	Et
Cl	V ^e	Et	Et	Et	F	V ^e	Et	Et	Et
Cl	V ^f	Et	Et	Et	F	V ^f	Et	Et	Et
Cl	V ^g	Et	Et	Et	F	V ^g	Et	Et	Et
Cl	V ^h	Et	Et	Et	F	V ^h	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)-	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH(Me)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH(OMe)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH(Et)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH(CN)-	Me	Me	i-Pr
Cl	V ^a	Me	Me	i-Pr	F	V ^a	Me	Me	i-Pr
Cl	v ^h	Me	Me	i-Pr	F	v ^h	Me	Me	i-Pr
Cl	V ^c	Me	Me	i-Pr..	F	V ^c	Me	Me	i-Pr
Cl	V ^d	Me	Me	i-Pr	F	V ^d	Me	Me	i-Pr

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	V ^e	Me	Me	i-Pr	F	V ^e	Me	Me	i-Pr
Cl	V ^f	Me	Me	i-Pr	F	V ^f	Me	Me	i-Pr
Cl	V ^g	Me	Me	i-Pr	F	V ^g	Me	Me	i-Pr
Cl	V ^h	Me	Me	i-Pr	F	V ^h	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(Me)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH(Me)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(OMe)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH(OMe)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(Et)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH(Et)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH(CF ₃)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CHF-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(CN)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH(CN)-	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^a	Me	Et	i-Pr	F	V ^a	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^b	Me	Et	i-Pr	F	V ^b	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^c	Me	Et	i-Pr	F	V ^c	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^d	Me	Et	i-Pr	F	V ^d	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^e	Me	Et	i-Pr	F	V ^e	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^f	Me	Et	i-Pr	F	V ^f	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^g	Me	Et	i-Pr	F	V ^g	Me	Et	i-Pr

ES 2 398 854 T3

R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Cl	V^h	Me	Et	i-Pr	F	V^h	Me	Et	i-Pr
Cl	$-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	i-Pr	F	$-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	i-Pr
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	i-Pr	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	i-Pr
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$	Me	Et	i-Pr	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$	Me	Et	i-Pr
Cl	$-\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}(\text{OCF}_3)-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}(\text{OCF}_3)-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}(\text{CF}_3)-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}(\text{CF}_3)-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{CHFCH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{CHFCH}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{CF}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{CF}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{CHF}-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{CHF}-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}(\text{CN})-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}(\text{CN})-$	Me	Me	Ph
Cl	V^a	Me	Me	Ph	F	V^a	Me	Me	Ph
Cl	V^b	Me	Me	Ph	F	V^b	Me	Me	Ph
Cl	V^c	Me	Me	Ph	F	V^c	Me	Me	Ph
Cl	V^d	Me	Me	Ph	F	V^d	Me	Me	Ph
Cl	V^e	Me	Me	Ph	F	V^e	Me	Me	Ph
Cl	V^f	Me	Me	Ph	F	V^f	Me	Me	Ph
Cl	V^g	Me	Me	Ph	F	V^g	Me	Me	Ph
Cl	V^h	Me	Me	Ph	F	V^h	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^a	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^a	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^b	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^h	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^c	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^c	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^d	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^d	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^e	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^e	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^f	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^f	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^g	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^g	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^h	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^h	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^a	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^a	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^b	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^b	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^c	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^c	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^d	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^d	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^e	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^e	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^f	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^f	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^g	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^g	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^h	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^h	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^a	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^a	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^b	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^b	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^c	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^c	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^d	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^d	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^e	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^e	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^f	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^f	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^g	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^g	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^h	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^h	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph'
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^a	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^a	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^b	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^b	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^c	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^c	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^d	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^d	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^e	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^e	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^f	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^f	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^g	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^g	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^h	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^h	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Me)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(CN)-	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^a	Me	Me	c-Pr	F	V ^a	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^b	Me	Me	c-Pr	F	V ^b	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^c	Me	Me	c-Pr	F	V ^c	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^d	Me	Me	c-Pr	F	V ^d	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^e	Me	Me	c-Pr	F	V ^e	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^f	Me	Me	c-Pr	F	V ^f	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^g	Me	Me	c-Pr	F	V ^g	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^h	Me	Me	c-Pr	F	V ^h	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH(Me)-	Me	Me	Me	Me	-CH(Me)-	Me	Me	Et
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	Me	Me	-CH(OMe)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Et)-	Me	Me	Me	Me	-CH(Et)-	Me	Me	Et

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Me	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Et
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Me	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Et
Me	-CH(CN)-	Me	Me	Me	Me	-CH(CN)-	Me	Me	Et
Me	V ^a	Me	Me	Me	Me	V ^a	Me	Me	Et
Me	V ^b	Me	Me	Me	Me	V ^b	Me	Me	Et
Me	V ^c	Me	Me	Me	Me	V ^c	Me	Me	Et
Me	V ^d	Me	Me	Me	Me	V ^d	Me	Me	Et
Me	V ^e	Me	Me	Me	Me	V ^e	Me	Me	Et
Me	V ^f	Me	Me	Me	Me	V ^f	Me	Me	Et
Me	V ^g	Me	Me	Me	Me	V ^g	Me	Me	Et
Me	V ^h	Me	Me	Me	Me	V ^h	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH(Me)-	Me	Et	Et	Me	-CH(Me)-	Et	Et	Et
Me	-CH(OMe)-	Me	Et	Et	Me	-CH(OMe)-	Et	Et	Et
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Et	Et	Et
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et
Me	-CH(Et)-	Me	Et	Et	Me	-CH(Et)-	Et	Et	Et
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	Et	Me	-CH(OCF ₃)-	Et	Et	Et
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Et	Et	Me	-CH(CF ₃)-	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CHF-	Et	Et	Et
Me	-CH(CN)-	Me	Et	Et	Me	-CH(CN)-	Et	Et	Et
Me	V ^h	Me	Me	Me	Me	V ^h	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	V ^a	Me	Et	Et	Me	V ^a	Et	Et	Et
Me	V ^b	Me	Et	Et	Me	V ^b	Et	Et	Et
Me	V ^c	Me	Et	Et	Me	V ^c	Et	Et	Et
Me	V ^d	Me	Et	Et	Me	V ^d	Et	Et	Et
Me	V ^e	Me	Et	Et	Me	V ^e	Et	Et	Et
Me	V ^f	Me	Et	Et	Me	V ^f	Et	Et	Et
Me	V ^g	Me	Et	Et	Me	V ^g	Et	Et	Et
Me	V ^h	Me	Et	Et	Me	V ^h	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=O)-	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(Me)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(Me)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(OMe)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(Et)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(Et)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(CN)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(CN)-	Me	Et	i-Pr
Me	V ^a	Me	Me	i-Pr	Me	V ^a	Me	Et	i-Pr
Me	V ^b	Me	Me	i-Pr	Me	V ^b	Me	Et	i-Pr
Me	V ^c	Me	Me	i-Pr	Me	V ^c	Me	Et	i-Pr
Me	V ^d	Me	Me	i-Pr	Me	V ^d	Me	Et	i-Pr
Me	V ^e	Me	Me	i-Pr	Me	V ^e	Me	Et	i-Pr
Me	V ^f	Me	Me	i-Pr	Me	V ^f	Me	Et	i-Pr
Me	V ^g	Me	Me	i-Pr	Me	V ^g	Me	Et	i-Pr
Me	V ^h	Me	Me	i-Pr	Me	V ^h	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(Me)-	Me	Me	Ph	Me	-CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	Ph	Me	-CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(Et)-	Me	Me	Ph	Me	-CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph

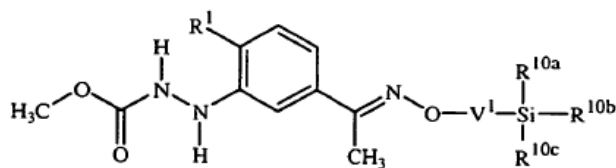
ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Ph	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Ph	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(CN)-	Me	Me	Ph	Me	-CH(CN)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^a	Me	Me	Ph	Me	V ^a	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^b	Me	Me	Ph	Me	V ^b	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^c	Me	Me	Ph	Me	V ^c	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^d	Me	Me	Ph	Me	V ^d	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^e	Me	Me	Ph	Me	V ^e	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^f	Me	Me	Ph •	Me	V ^f	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^g	Me	Me	Ph	Me	V ^g	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^h	Me	Me	Ph	Me	V ^h	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(CN)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(CN)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^a	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^a	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^b	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^b	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^c	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^c	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^d	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^d	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^e	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^e	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^f	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^f	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^g	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^g	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^h	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^h	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH(CN)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	V ^a	Me	Me	c-Pr
Me	-CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	Me	V ^b	Me	Me	c-Pr
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr	Me	V ^c	Me	Me	c-Pr
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	V ^d	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	Me	V ^e	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr	Me	V ^f	Me	Me	c-Pr
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	V ^g	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	V ^h	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH(Et)-	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	c-Pr

Tabla 2



R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	Me	F	-CH(Me)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	Me	F	-CH(OMe)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	Me	F	-CH(Et)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Me	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Me	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Me
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	Me	F	-CH(CN)-	Me	Me	Me
Cl	V ^a	Me	Me	Me	F	V ^a	Me	Me	Me

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	v ^h	Me	Me	Me	F	v ^h	Me	Me	Me
Cl	V ^c	Me	Me	Me	F	V ^c	Me	Me	Me
Cl	V ^d	Me	Me	Me	F	V ^d	Me	Me	Me
Cl	V ^e	Me	Me	Me	F	V ^e	Me	Me	Me
Cl	V ^f	Me	Me	Me	F	V ^f	Me	Me	Me
Cl	V ^g	Me	Me	Me	F	V ^g	Me	Me	Me
Cl	v ^h	Me	Me	Me	F	v ^h	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	Et	F	-CH(Me)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	Et	F	-CH(OMe)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	Et	F	-CH(Et)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Et	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Et	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me'	Et
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Et

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Et
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	Et	F	-CH(CN)-	Me	Me	Et
Cl	V ^a	Me	Me	Et	F	V ^a	Me	Me	Et
Cl	V ^b	Me	Me	Et	F	V ^b	Me	Me	Et
Cl	V ^c	Me	Me	Et	F	V ^c	Me	Me	Et
Cl	V ^d	Me	Me	Et	F	V ^d	Me	Me	Et
Cl	V ^e	Me	Me	Et	F	V ^e	Me	Me	Et
Cl	V ^f	Me	Me	Et	F	V ^f	Me	Me	Et
Cl	V ^g	Me	Me	Et	F	V ^g	Me	Me	Et
Cl	V ^h	Me	Me	Et	F	V ^h	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH(Me)-	Me	Et	Et	F	-CH(Me)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(OMe)-	Me	Et	Et	F	-CH(OMe)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Et)-	Me	Et	Et	F	-CH(Et)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	Et	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Et	Et	F	-CH(CF ₃)-	Me	Et	Et

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CHF-	Me	Et	Et
Cl	-CH(CN)-	Me	Et	Et	F	-CH(CN)-	Me	Et	Et
Cl	V ^a	Me	Et	Et	F	V ^a	Me	Et	Et
Cl	V ^b	Me	Et	Et	F	V ^b	Me	Et	Et
Cl	V ^c	Me	Et	Et	F	V ^c	Me	Et	Et
Cl	V ^d	Me	Et	Et	F	V ^d	Me	Et	Et
Cl	V ^e	Me	Et	Et	F	V ^e	Me	Et	Et
Cl	V ^f	Me	Et	Et	F	V ^f	Me	Et	Et
Cl	V ^g	Me	Et	Et	F	V ^g	Me	Et	Et
Cl	V ^h	Me	Et	Et	F	V ^h	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH(Me)-	Et	Et	Et	F	-CH(Me)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(OMe)-	Et	Et	Et	F	-CH(OMe)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Et)-	Et	Et	Et	F	-CH(Et)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(OCF ₃)-	Et	Et	Et	F	-CH(OCF ₃)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(CF ₃)-	Et	Et	Et	F	-CH(CF ₃)-	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CHF-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CHF-	Et	Et	Et
Cl	-CH(CN)-	Et	Et	Et	F	-CH(CN)-	Et	Et	Et
Cl	V ^a	Et	Et	Et	F	V ^a	Et	Et	Et
Cl	V ^b	Et	Et	Et	F	V ^b	Et	Et	Et
Cl	V ^c	Et	Et	Et	F	V ^c	Et	Et	Et
Cl	V ^d	Et	Et	Et	F	V ^d	Et	Et	Et
Cl	V ^e	Et	Et	Et	F	V ^e	Et	Et	Et
Cl	V ^f	Et	Et	Et	F	V ^f	Et	Et	Et
Cl	V ^g	Et	Et	Et	F	V ^g	Et	Et	Et
Cl	V ^h	Et	Et	Et	F	V ^h	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)-	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH(Me)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH(OMe)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH(Et)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH(CN)-	Me	Me	i-Pr
Cl	V ^a	Me	Me	i-Pr	F	V ^a	Me	Me	i-Pr
Cl	v ^h	Me	Me	i-Pr	F	v ^h	Me	Me	i-Pr
Cl	V ^c	Me	Me	i-Pr	F	V ^c	Me	Me	i-Pr
Cl	V ^d	Me	Me	i-Pr	F	V ^d	Me	Me	i-Pr
Cl	V ^e	Me	Me	i-Pr	F	V ^e	Me	Me	i-Pr
Cl	V ^f	Me	Me	i-Pr	F	V ^f	Me	Me	i-Pr
Cl	V ^g	Me	Me	i-Pr	F	V ^g	Me	Me	i-Pr
Cl	v ^h	Me	Me	i-Pr	F	v ^h	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(Me)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH(Me)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(OMe)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH(OMe)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(Et)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH(Et)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH(CF ₃)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CHF-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(CN)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH(CN)-	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^a	Me	Et	i-Pr	F	V ^a	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^b	Me	Et	i-Pr	F	V ^b	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^c	Me	Et	i-Pr	F	V ^c	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^d	Me	Et	i-Pr	F	V ^d	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^e	Me	Et	i-Pr	F	V ^e	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^f	Me	Et	i-Pr	F	V ^f	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^g	Me	Et	i-Pr	F	V ^g	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^h	Me	Et	i-Pr	F	V ^h	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph -	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	Ph
Cl	V ^a	Me	Me	Ph	F	V ^a	Me	Me	Ph
Cl	V ^h	Me	Me	Ph	F	V ^b	Me	Me	Ph
Cl	V ^c	Me	Me	Ph	F	V ^c	Me	Me	Ph
Cl	V ^d	Me	Me	Ph	F	V ^d	Me	Me	Ph
Cl	V ^e	Me	Me	Ph	F	V ^e	Me	Me	Ph
Cl	V ^f	Me	Me	Ph	F	V ^f	Me	Me	Ph
Cl	V ^g	Me	Me	Ph	F	V ^g	Me	Me	Ph
Cl	V ^h	Me	Me	Ph	F	V ^h	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^a	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^a	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^b	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^b	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^c	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^c	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^d	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^d	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^e	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^e	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^f	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^f	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^g	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^g	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^h	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^h	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^a	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^a	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^b	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^b	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^c	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^c	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^d	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^d	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^e	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^e	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^f	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^f	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^g	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^g	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^h	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^h	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^a	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^a	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^b	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^b	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^c	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^c	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^d	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^d	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^e	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^e	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^f	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^f	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^g	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^g	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^h	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^h	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Me)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(CN)-	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^a	Me	Me	c-Pr	F	V ^a	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^h	Me	Me	c-Pr	F	V ^h	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^c	Me	Me	c-Pr	F	V ^c	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^d	Me	Me	c-Pr	F	V ^d	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^e	Me	Me	c-Pr	F	V ^e	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^f	Me	Me	c-Pr	F	V ^f	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^g	Me	Me	c-Pr	F	V ^g	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^h	Me	Me	c-Pr	F	V ^h	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ -	Me	Me	Et

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH(Me)-	Me	Me	Me	Me	-CH(Me)-	Me	Me	Et
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	Me	Me	-CH(OMe)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Et)-	Me	Me	Me	Me	-CH(Et)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Me	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Et
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Me	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Et
Me	-CH(CN)-	Me	Me	Me	Me	-CH(CN)-	Me	Me	Et
Me	V ^a	Me	Me	Me	Me	V ^a	Me	Me	Et
Me	V ^b	Me	Me	Me	Me	V ^b	Me	Me	Et
Me	V ^c	Me	Me	Me	Me	V ^c	Me	Me	Et
Me	V ^d	Me	Me	Me	Me	V ^d	Me	Me	Et
Me	V ^e	Me	Me	Me	Me	V ^e	Me	Me	Et
Me	V ^f	Me	Me	Me	Me	V ^f	Me	Me	Et
Me	V ^g	Me	Me	Me	Me	V ^g	Me	Me	Et
Me	V ^h	Me	Me	Me	Me	V ^h	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH(Me)-	Me	Et	Et	Me	-CH(Me)-	Et	Et	Et
Me	-CH(OMe)-	Me	Et	Et	Me	-CH(OMe)-	Et	Et	Et
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Et	Et	Et
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et
Me	-CH(Et)-	Me	Et	Et	Me	-CH(Et)-	Et	Et	Et
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	Et	Me	-CH(OCF ₃)-	Et	Et	Et
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Et	Et	Me	-CH(CF ₃)-	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CHF-	Et	Et	Et
Me	-CH(CN)-	Me	Et	Et	Me	-CH(CN)-	Et	Et	Et
Me	V ^a	Me	Et	Et	Me	V ^a	Et	Et	Et
Me	V ^b	Me	Et	Et	Me	V ^b	Et	Et	Et
Me	V ^c	Me	Et	Et	Me	V ^c	Et	Et	Et
Me	V ^d	Me	Et	Et	Me	V ^d	Et	Et	Et
Me	V ^e	Me	Et	Et	Me	V ^e	Et	Et	Et
Me	V ^f	Me	Et	Et	Me	V ^f	Et	Et	Et

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	V ^g	Me	Et	Et	Me	V ^g	Et	Et	Et
Me	V ^h	Me	Et	Et	Me	V ^h	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=O)-	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(Me)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(Me)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(OMe)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(Et)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(Et)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(CN)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(CN)-	Me	Et	i-Pr
Me	V ^a	Me	Me	i-Pr	Me	V ^a	Me	Et	i-Pr
Me	V ^h	Me	Me	i-Pr	Me	V ^h	Me	Et	i-Pr
Me	V ^c	Me	Me	i-Pr	Me	V ^c	Me	Et	i-Pr

R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Me	V^d	Me	Me	i-Pr	Me	V^d	Me	Et	i-Pr
Me	V^e	Me	Me	i-Pr	Me	V^e	Me	Et	i-Pr
Me	V^f	Me	Me	i-Pr	Me	V^f	Me	Et	i-Pr
Me	V^g	Me	Me	i-Pr	Me	V^g	Me	Et	i-Pr
Me	V^h	Me	Me	i-Pr	Me	V^h	Me	Et	i-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	i-Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	i-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	i-Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	i-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$	Me	Me	i-Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$	Me	Et	i-Pr
Me	$-\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}(\text{OCF}_3)-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}(\text{OCF}_3)-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}(\text{CF}_3)-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}(\text{CF}_3)-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CHFCH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CHFCH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CF}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CF}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CHF}-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CHF}-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}(\text{CN})-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}(\text{CN})-$	Me	Me	4-Cl-Ph

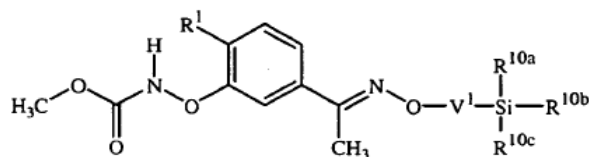
ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	V ^a	Me	Me	Ph	Me	V ^a	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^b	Me	Me	Ph	Me	V ^b	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^c	Me	Me	Ph	Me	V ^c	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^d	Me	Me	Ph	Me	V ^d	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^e	Me	Me	Ph	Me	V ^e	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^f	Me	Me	Ph	Me	V ^f	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^g	Me	Me	Ph-	Me	V ^g	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^h	Me	Me	Ph .	Me	V ^h	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Ph.	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(CN)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(CN)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^a	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^a	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^b	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^b	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^c	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^c	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^d	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^d	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^e	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^e	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^f	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^f	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^g	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^g	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^h	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^h	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH(CN)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	V ^a	Me	Me	c-Pr
Me	-CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	Me	V ^b	Me	Me	c-Pr
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr	Me	V ^c	Me	Me	c-Pr
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	V ^d	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	Me	V ^e	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr	Me	V ^f	Me	Me	c-Pr
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	V ^g	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	V ^h	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH(Et)-	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	c-Pr

Tabla 3



R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
- Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CHIC(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	Me	F	-CH(Me)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	Me	F	-CH(OMe)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	Me	F	-CH(Et)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Me	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Me	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Me
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	Me	F	-CH(CN)-	Me	Me	Me
Cl	V ^a	Me	Me	Me	F	V ^a	Me	Me	Me
Cl	V ^b	Me	Me	Me	F	V ^b	Me	Me	Me
Cl	V ^c	Me	Me	Me	F	V ^c	Me	Me	Me
Cl	V ^d	Me	Me	Me	F	V ^d	Me	Me	Me
Cl	V ^e	Me	Me	Me	F	V ^e	Me	Me	Me
Cl	V ^f	Me	Me	Me	F	V ^f	Me	Me	Me
Cl	V ^g	Me	Me	Me	F	V ^g	Me	Me	Me

ES 2 398 854 T3

R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Cl	V^h	Me	Me	Me	F	V^h	Me	Me	Me
Cl	$-CH_2OC(=O)CH_2-$	Me	Me	Me	F	$-CH_2OC(=O)CH_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-CH_2C(=O)CH_2-$	Me	Me	Me	F	$-CH_2C(=O)CH_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-CH_2C(=O)-$	Me	Me	Me	F	$-CH_2C(=O)-$	Me	Me	Me
Cl	$-CH_2-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2CH_2-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2CH_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2CH_2CH_2-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2CH_2CH_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2CH_2CH_2CH_2-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2CH_2CH_2CH_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2OCH_2CH_2-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2OCH_2CH_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2CH_2OCH_2-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2CH_2OCH_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2CH_2C(=S)CH_2-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2CH_2C(=S)CH_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2C(=O)CH_2-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2C(=O)CH_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2C(=S)CH_2-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2C(=S)CH_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH(Me)-$	Me	Me	Et	F	$-CH(Me)-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH(OMe)-$	Me	Me	Et	F	$-CH(OMe)-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH(Me)CH_2-$	Me	Me	Et	F	$-CH(Me)CH_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2CH(Me)-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2CH(Me)-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2CH(OMe)-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2CH(OMe)-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH(Me)CH_2CH_2-$	Me	Me	Et	F	$-CH(Me)CH_2CH_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2CH(Me)CH_2-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2CH(Me)CH_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2CH_2CH(Me)-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2CH_2CH(Me)-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH(Et)-$	Me	Me	Et	F	$-CH(Et)-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH(Et)CH_2-$	Me	Me	Et	F	$-CH(Et)CH_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2CH(Et)-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2CH(Et)-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH(Et)CH_2CH_2-$	Me	Me	Et	F	$-CH(Et)CH_2CH_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2CH(Et)CH_2-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2CH(Et)CH_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2CH_2CH(Et)-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2CH_2CH(Et)-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH(OCF_3)-$	Me	Me	Et	F	$-CH(OCF_3)-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH(CF_3)-$	Me	Me	Et	F	$-CH(CF_3)-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2CF_2CH_2-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2CF_2CH_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2CHFCH_2-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2CHFCH_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2CF_2-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2CF_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2CHF-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2CHF-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH(CN)-$	Me	Me	Et	F	$-CH(CN)-$	Me	Me	Et
Cl	V^a	Me	Me	Et	F	V^a	Me	Me	Et
Cl	V^b	Me	Me	Et	F	V^b	Me	Me	Et
Cl	V^c	Me	Me	Et	F	V^c	Me	Me	Et
Cl	V^d	Me	Me	Et	F	V^d	Me	Me	Et
Cl	V^e	Me	Me	Et	F	V^e	Me	Me	Et
Cl	V^f	Me	Me	Et	F	V^f	Me	Me	Et
Cl	V^g	Me	Me	Et	F	V^g	Me	Me	Et
Cl	V^h	Me	Me	Et	F	V^h	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2OC(=O)CH_2-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2OC(=O)CH_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2C(=O)CH_2-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2C(=O)CH_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2C(=O)-$	Me	Me	Et	F	$-CH_2C(=O)-$	Me	Me	Et
Cl	$-CH_2-$	Me	Et	Et	F	$-CH_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-CH_2CH_2-$	Me	Et	Et	F	$-CH_2CH_2-$	Me	Et	Et

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH(Me)-	Me	Et	Et	F	-CH(Me)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(OMe)-	Me	Et	Et	F	-CH(OMe)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Et)-	Me	Et	Et	F	-CH(Et)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	Et	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Et	Et	F	-CH(CF ₃)-	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CHF-	Me	Et	Et
Cl	-CH(CN)-	Me	Et	Et	F	-CH(CN)-	Me	Et	Et
Cl	V ^a	Me	Et	Et	F	V ^a	Me	Et	Et
Cl	V ^b	Me	Et	Et	F	V ^b	Me	Et	Et
Cl	V ^c	Me	Et	Et	F	V ^c	Me	Et	Et
Cl	V ^d	Me	Et	Et	F	V ^d	Me	Et	Et
Cl	V ^e	Me	Et	Et	F	V ^e	Me	Et	Et
Cl	V ^f	Me	Et	Et	F	V ^f	Me	Et	Et
Cl	V ^g	Me	Et	Et	F	V ^g	Me	Et	Et
Cl	V ^h	Me	Et	Et	F	V ^h	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH(Me)-	Et	Et	Et	F	-CH(Me)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(OMe)-	Et	Et	Et	F	-CH(OMe)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Et)-	Et	Et	Et	F	-CH(Et)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(OCF ₃)-	Et	Et	Et	F	-CH(OCF ₃)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(CF ₃)-	Et	Et	Et	F	-CH(CF ₃)-	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CHF-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CHF-	Et	Et	Et
Cl	-CH(CN)-	Et	Et	Et	F	-CH(CN)-	Et	Et	Et
Cl	V ^a	Et	Et	Et	F	V ^a	Et	Et	Et
Cl	V ^b	Et	Et	Et	F	V ^b	Et	Et	Et
Cl	V ^c	Et	Et	Et	F	V ^c	Et	Et	Et
Cl	V ^d	Et	Et	Et	F	V ^d	Et	Et	Et
Cl	V ^e	Et	Et	Et	F	V ^e	Et	Et	Et
Cl	V ^f	Et	Et	Et	F	V ^f	Et	Et	Et
Cl	V ^g	Et	Et	Et	F	V ^g	Et	Et	Et
Cl	V ^h	Et	Et	Et	F	V ^h	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)-	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH(Me)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH(OMe)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH(Et)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH(CN)-	Me	Me	i-Pr
Cl	V ^a	Me	Me	i-Pr	F	V ^a	Me	Me	i-Pr
Cl	V ^b	Me	Me	i-Pr	F	V ^b	Me	Me	i-Pr
Cl	V ^c	Me	Me	i-Pr	F	V ^c	Me	Me	i-Pr
Cl	V ^d	Me	Me	i-Pr	F	V ^d	Me	Me	i-Pr
Cl	V ^e	Me	Me	i-Pr	F	V ^e	Me	Me	i-Pr
Cl	V ^f	Me	Me	i-Pr	F	V ^f	Me	Me	i-Pr
Cl	V ^g	Me	Me	i-Pr	F	V ^g	Me	Me	i-Pr
Cl	V ^h	Me	Me	i-Pr	F	V ^h	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	i-Pr
Cl	-CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(Me)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH(Me)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(OMe)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH(OMe)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et'	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(Et)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH(Et)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH(CF ₃)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ CHF-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH(CN)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH(CN)-	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^a	Me	Et	i-Pr	F	V ^a	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^b	Me	Et	i-Pr	F	V ^b	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^c	Me	Et	i-Pr	F	V ^c	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^d	Me	Et	i-Pr	F	V ^d	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^e	Me	Et	i-Pr	F	V ^e	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^f	Me	Et	i-Pr	F	V ^f	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^g	Me	Et	i-Pr	F	V ^g	Me	Et	i-Pr
Cl	V ^h	Me	Et	i-Pr	F	V ^h	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	i-Pr	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	i-Pr
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	Ph

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	Ph
Cl	V ^a	Me	Me	Ph	F	V ^a	Me	Me	Ph
Cl	V ^b	Me	Me	Ph	F	V ^b	Me	Me	Ph
Cl	V ^c	Me	Me	Ph	F	V ^c	Me	Me	Ph
Cl	V ^d	Me	Me	Ph	F	V ^d	Me	Me	Ph
Cl	V ^e	Me	Me	Ph	F	V ^e	Me	Me	Ph
Cl	V ^f	Me	Me	Ph	F	V ^f	Me	Me	Ph
Cl	V ^g	Me	Me	Ph	F	V ^g	Me	Me	Ph
Cl	V ^h	Me	Me	Ph	F	V ^h	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^a	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^a	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^b	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^b	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^c	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^c	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^d	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^d	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^e	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^e	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ⁱ	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^f	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^g	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^g	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	V ^h	Me	Me	4-Cl-Ph	F	V ^h	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^a	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^a	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^b	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^b	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^c	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^c	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^d	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^d	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^e	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^e	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^f	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^f	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^g	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^g	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^h	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^h	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^a	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^a	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^b	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^b	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^c	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^c	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^d	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^d	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^e	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^e	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^f	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^f	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^g	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^g	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	V ^h	Me	Me	2-Cl-Ph	F	V ^h	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Me)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(CN)-	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^a	Me	Me	c-Pr	F	V ^a	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^b	Me	Me	c-Pr	F	V ^b	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^c	Me	Me	c-Pr	F	V ^c	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^d	Me	Me	c-Pr	F	V ^d	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^e	Me	Me	c-Pr	F	V ^e	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^f	Me	Me	c-Pr	F	V ^f	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^g	Me	Me	c-Pr	F	V ^g	Me	Me	c-Pr
Cl	V ^h	Me	Me	c-Pr	F	V ^h	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ --	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH(Me)-	Me	Me	Me	Me	-CH(Me)-	Me	Me	Et
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	Me	Me	-CH(OMe)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Et)-	Me	Me	Me	Me	-CH(Et)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Me	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Et
Me	-CH(CF ₃)-	Me	*Me	Me	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Me •	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Me.	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Et
Me	-CH(CN)-	Me	Me	Me	Me	-CH(CN)-	Me	Me	Et
Me	V ^a	Me	Me	Me	Me	V ^a	Me	Me	Et
Me	V ^b	Me	Me	Me	Me	V ^b	Me	Me	Et
Me	V ^c	Me	Me	Me	Me	V ^c	Me	Me	Et
Me	V ^d	Me	Me	Me	Me	V ^d	Me	Me	Et
Me	V ^e	Me	Me	Me	Me	V ^e	Me	Me	Et
Me	V ^f	Me	Me	Me	Me	V ^f	Me	Me	Et
Me	V ^g	Me	Me	Me	Me	V ^g	Me	Me	Et
Me	V ^h	Me	Me	Me	Me	V ^h	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me -	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH(Me)-	Me	Et	Et	Me	-CH(Me)-	Et	Et	Et
Me	-CH(OMe)-	Me	Et	Et	Me	-CH(OMe)-	Et	Et	Et
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Et	Et	Et
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et
Me	-CH(Et)-	Me	Et	Et	Me	-CH(Et)-	Et	Et	Et
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	Et	Me	-CH(OCF ₃)-	Et	Et	Et
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Et	Et	Me	-CH(CF ₃)-	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CHF-	Et	Et	Et

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH(CN)-	Me	Et	Et	Me	-CH(CN)-	Et	Et	Et
Me	V ^a	Me	Et	Et	Me	V ^a	Et	Et	Et
Me	V ^b	Me	Et	Et	Me	V ^b	Et	Et	Et
Me	V ^c	Me	Et	Et	Me	V ^c	Et	Et	Et
Me	V ^d	Me	Et	Et	Me	V ^d	Et	Et	Et
Me	V ^e	Me	Et	Et	Me	V ^e	Et	Et	Et
Me	V ^f	Me	Et	Et	Me	V ^f	Et	Et	Et
Me	V ^g	Me	Et	Et	Me	V ^g	Et	Et	Et
Me	V ^h	Me	Et	Et	Me	V ^h	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=O)-	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(Me)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(Me)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(OMe)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(Et)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(Et)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	i-Pr
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Et	i-Pr
Me	-CH(CN)-	Me	Me	i-Pr	Me	-CH(CN)-	Me	Et	i-Pr
Me	V ^a	Me	Me	i-Pr	Me	V ^a	Me	Et	i-Pr
Me	V ^b	Me	Me	i-Pr	Me	V ^b	Me	Et	i-Pr

R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Me	V^c	Me	Me	i-Pr	Me	V^c	Me	Et	i-Pr
Me	V^d	Me	Me	i-Pr	Me	V^d	Me	Et	i-Pr
Me	V^e	Me	Me	i-Pr	Me	V^e	Me	Et	i-Pr
Me	V^f	Me	Me	i-Pr	Me	V^f	Me	Et	i-Pr
Me	V^g	Me	Me	i-Pr	Me	V^g	Me	Et	i-Pr
Me	V^h	Me	Me	i-Pr	Me	V^h	Me	Et	i-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	i-Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	i-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	i-Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	i-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$	Me	Me	i-Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$	Me	Et	i-Pr
Me	$-\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}(\text{OCF}_3)-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}(\text{OCF}_3)-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}(\text{CF}_3)-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}(\text{CF}_3)-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CHFCH}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CHFCH}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CF}_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CF}_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}_2\text{CHF}-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}_2\text{CHF}-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-\text{CH}(\text{CN})-$	Me	Me	Ph	Me	$-\text{CH}(\text{CN})-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V^a	Me	Me	Ph	Me	V^a	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V^h	Me	Me	Ph	Me	V^h	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V^c	Me	Me	Ph	Me	V^c	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V^d	Me	Me	Ph	Me	V^d	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V^e	Me	Me	Ph	Me	V^e	Me	Me	4-Cl-Ph

ES 2 398 854 T3

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	V ^f	Me	Me	Ph	Me	v	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^g	Me	Me	Ph	Me	V ^f	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^h	Me	Me	Ph	Me	V ^h	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(CN)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(CN)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^a	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^a	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^b	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^b	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^c	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^c	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^d	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^d	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^e	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^e	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^f	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^f	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^g	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^g	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^h	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^h	Me	Me	2-Cl-Ph

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH(CN)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	V ^a	Me	Me	c-Pr
Me	-CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	Me	V ^b	Me	Me	c-Pr
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr	Me	V ^c	Me	Me	c-Pr
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	V ^d	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	Me	V ^e	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr	Me	V ^f	Me	Me	c-Pr
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	V ^g	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	V ^h	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH(Et)-	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	c-Pr

Formulación/Utilidad

5 Un compuesto de la presente invención en general se utilizará como ingrediente activo fungicida en una composición, es decir formulación, con al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, que sirve como vehículo. Los ingredientes de la formulación o composición son seleccionados para que sean consistentes con las propiedades físicas del ingrediente activo, modo de aplicación y factores ambientales tales como tipo de tierra, humedad y temperatura.

10 Formulaciones útiles incluyen composiciones tanto líquidas como sólidas. Las composiciones líquidas incluyen disoluciones (incluyendo concentrados emulsionables), suspensiones, emulsiones (incluyendo microemulsiones y/o suspoemulsiones) y similares, que opcionalmente pueden espesarse hasta geles. Los tipos generales de composiciones líquidas acuosas son concentrado soluble, concentrado para suspensiones, suspensión para cápsulas, emulsión concentrada, microemulsión y suspoemulsión. Los tipos generales de composiciones líquidas no acuosas son concentrado emulsionable, concentrado microemulsionable, concentrado dispersable y dispersión en aceite

15 Los tipos generales de composiciones sólidas son polvos de espolvoreo, polvos, gránulos, aglomerados, globulillos, pastillas, comprimidos, películas cargadas (incluyendo revestimientos de semillas) y similares, que pueden ser dispersables en agua ("humectables") o solubles en agua. Las películas y los revestimientos formados a partir de disoluciones pelculígenas o suspensiones fluidas son particularmente útiles para el tratamiento de semillas. El ingrediente activo puede estar (micro)encapsulado y formando además en una suspensión o formulación sólida; como alternativa, la formulación entera del ingrediente activo puede estar encapsulada (o "recubierta"). La encapsulación puede controlar o retrasar la liberación del ingrediente activo. Un gránulo emulsificable combina las ventajas tanto de una formulación de concentrado emulsificable como de una formulación granular seca. Las composiciones de alta resistencia se usan principalmente como intermedios para la formulación adicional.

25 Las formulaciones pulverizables se extienden típicamente en un medio adecuado antes de la pulverización. Tales formulaciones líquidas y sólidas se formulan para diluirse fácilmente en el medio de pulverización, normalmente agua. Los volúmenes de pulverización pueden oscilar de aproximadamente uno a varios miles de litros por hectárea, pero más típicamente están en el intervalo de aproximadamente diez a varios cientos de litros por hectárea. Las

5 formulaciones pulverizables pueden mezclarse en depósito con agua u otro medio adecuado para el tratamiento foliar mediante aplicación aérea o terrestre, o para aplicación al medio de crecimiento de la planta. Las formulaciones líquidas y secas pueden dosificarse directamente en sistemas de irrigación por goteo o dosificarse en el surco durante el plantado. Las formulaciones líquidas y sólidas pueden aplicarse sobre semillas de cultivos y otra vegetación deseable como tratamientos para semillas antes del plantado para proteger las raíces en desarrollo y otras partes subterráneas de la planta y/o el follaje a través de captación sistémica.

Las formulaciones contendrán típicamente cantidades eficaces de ingrediente activo, diluyente y tensioactivo, dentro de los siguientes intervalos aproximados que constituyen hasta 100 por cien en peso.

	Porcentaje en Peso		
	<u>Ingrediente Activo</u>	<u>Diluyente</u>	<u>Tensioactivo</u>
Gránulos, Comprimidos y Polvos Dispersables en Agua y Solubles en Agua	0,001-90	0-99,999	0-15
Dispersiones en aceite, Suspensiones, Emulsiones, Disoluciones (incluyendo Concentrados Emulsionables)	1-50	40-99	0-50
Polvos de Espolvoreo	1-25	70-99	0-5
Gránulos y Pélets	0,001-99	5-99,999	0-15
Composiciones a Alta Resistencia	90-99	0-10	0-2

10 Los diluyentes sólidos incluyen, por ejemplo, arcillas tales como bentonita, montmorilonita, atapulgita y caolín, yeso, celulosa, dióxido de titanio, óxido de zinc, almidón, dextrina, azúcares (por ejemplo, lactosa, sacarosa), sílice, talco, mica, tierra diatomácea, urea, carbonato de calcio, carbonato de sodio y bicarbonato, y sulfato de sodio. Los diluyentes sólidos típicos se describen en Watkins et al., Handbook of Insecticide Dust Diluents y Carriers, 2ª edición, Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

15 Los diluyentes líquidos incluyen, por ejemplo, agua, N,N-dimetilalcanamidas (por ejemplo, N,N-dimetilformamida), limonena, sulfóxido de dimetilo, N-alkilpirrolidonas (por ejemplo, N-metilpirrolidinona), etilenglicol, trietilenglicol, propilenglicol, dipropilenglicol, polipropilenglicol, carbonato de propileno, carbonato de butileno, parafinas (por ejemplo, aceites minerales blancos, parafinas normales, isoparafinas), alquilbencenos, alquilnaftalenos, glicerina, triacetato de glicerol, sorbitol, triacetina, hidrocarburos aromáticos, compuestos alifáticos desaromatizados, alquilbencenos, alquilnaftalenos, cetonas tales como ciclohexanona, 2-heptanona, isoforona y 4-hidroxi-4-metil-2-pentanona, acetatos tales como acetato de isoamilo, acetato de hexilo, acetato de heptilo, acetato de octilo, acetato de nonilo, acetato de tridecilo y acetato de isobornilo, otros ésteres tales como ésteres de lactato alquilados, ésteres dibásicos y γ -butirolactona, y alcoholes, que pueden ser lineales, ramificados, saturados o insaturados, tales como metanol, etanol, *n*-propanol, alcohol isopropílico, *n*-butanol, alcohol isobutílico, *n*-hexanol, 2-etilhexanol, *n*-octanol, decanol, alcohol isodecílico, isooctadecanol, alcohol cetílico, alcohol laurílico, alcohol tridecílico, alcohol oleílico, ciclohexanol, alcohol tetrahidrofurfurílico, diacetona alcohol y alcohol bencílico. Los diluyentes líquidos también incluyen ésteres de glicerol de ácidos grasos saturados e insaturados (típicamente C6-C22), tales como aceites de semillas y frutos de plantas (por ejemplo, aceites de oliva, ricino, linaza, sésamo, maíz, cacahuete, girasol, semillas de uva, cártamo, algodón, soja, colza, coco y almendra de palma), grasas de fuentes animales (por ejemplo, sebo de ternero, sebo de cerdo, manteca de cerdo, aceite de hígado de bacalao, aceite de pescado) y mezclas de los mismos. Los diluyentes líquidos también incluyen ácidos grasos alquilados (por ejemplo, metilados, etilados, butilados) en donde los ácidos grasos pueden obtenerse mediante hidrólisis de ésteres de glicerol procedentes de fuentes vegetales y animales, y pueden purificarse mediante destilación. Los diluyentes líquidos típicos se describen en Marsden, *Solvents Guide*, 2ª Ed., Interscience, Nueva York, 1950

35 Las composiciones sólidas y líquidas de la presente invención a menudo incluyen uno o más tensioactivos. Cuando se añaden a un líquido, los tensioactivos (también conocidos como "agentes surfactantes") generalmente modifican, lo más a menudo reducen, la tensión superficial del líquido. Dependiendo de la naturaleza de los grupos hidrófilos y lipófilos en una molécula tensioactiva, los tensioactivos pueden ser útiles como agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes o agentes antiespumantes.

40 Los tensioactivos pueden clasificarse como no iónicos, aniónicos o catiónicos. Los tensioactivos no iónicos útiles para las presentes composiciones incluyen, pero no se limitan a: alcoxilatos de alcohol tales como alcoxilatos de alcohol basados en alcoholes naturales y sintéticos (que pueden ser ramificados o lineales) y preparados a partir de los alcoholes y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos; etoxilatos de amina, alcanolamidas y alcanolamidas etoxiladas; triglicéridos alcoxilados tales como aceites de soja, ricino y colza etoxilados; alcoxilatos de alquilfenol tales como etoxilatos de octilfenol, etoxilatos de nonilfenol, etoxilatos de dinonilfenol y etoxilatos de dodecilfenol (preparados a partir de los fenoles y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); polímeros de bloques preparados a partir de óxido de etileno u óxido de

propileno y polímeros de bloques inversos donde los bloques terminales se preparan a partir de óxido de propileno; ácidos grasos etoxilados; ésteres y aceites grasos etoxilados; ésteres metílicos etoxilados; triestirilfenol etoxilado (incluyendo los preparados a partir de óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); ésteres de ácido graso, ésteres de glicerol, derivados basados en lanolina, ésteres de polietoxilato tales como ésteres de ácidos grasos de sorbitán polietoxilados, ésteres de ácidos grasos de sorbitol polietoxilados y ésteres de ácidos grasos de glicerol polietoxilados; otros derivados de sorbitán tales como ésteres de sorbitán; tensioactivos poliméricos tales como copolímeros aleatorios, copolímeros de bloques, resinas alquídicas de peg (polietilenglicol), polímeros de injerto o tipo peine y polímeros de estrella; polietilenglicoles (pegs); ésteres de ácidos grasos de polietilenglicol; tensioactivos basados en silicona; y derivados de azúcar tales como ésteres de sacarosa, alquilpoliglicósidos y alquilpolisacáridos.

Los tensioactivos aniónicos útiles incluyen, aunque no se limitan a: ácidos alquilarilsulfónicos y sus sales; etoxilatos de alcohol o alquilfenol carboxilados; derivados de sulfonato de difenilo; lignina y derivados de lignina tales como lignosulfonatos; ácidos maleico o succínico o sus anhídridos; sulfonatos de olefina; ésteres de fosfato tales como ésteres de fosfato de alcoxilatos de alcohol, ésteres de fosfato de alcoxilatos de alquilfenol y ésteres de fosfato de etoxilatos de estirilfenol; tensioactivos basados en proteínas; derivados de sarcosina; sulfato de estirilfenoléter; sulfatos y sulfonatos de aceites y ácidos grasos; sulfatos y sulfonatos de alquilfenoles etoxilados; sulfatos de alcoholes; sulfatos de alcoholes etoxilados; sulfonatos de aminas y amidas tales como *N,N*-alquiltauratos; sulfonatos de benceno, cumeno, tolueno, xileno y dodecil- y tridecil-bencenos; sulfonatos de naftalenos condensados; sulfonatos de naftaleno y alquilnaftaleno; sulfonatos de petróleo fraccionado; sulfosuccinamatos; y sulfosuccinatos y sus derivados tales como sales de dialquilsulfosuccinato.

Los tensioactivos catiónicos útiles incluyen, aunque no se limitan a: amidas y amidas etoxiladas; aminas tales como *N*-alquilpropanodiaminas, tripropilentriaminas y dipropilentetraminas, y aminas etoxiladas, diaminas etoxiladas y aminas propoxiladas (preparadas a partir de las aminas y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); sales de amina tales como acetatos de amina y sales de diamina; sales de amonio cuaternario tales como sales cuaternarias, sales cuaternarias etoxiladas y sales dicuaternarias; y óxidos de amina tales como óxidos de alquildimetilamina y óxidos de bis-(2-hidroxiethyl)-alquilamina.

También son útiles para las presentes composiciones mezclas de tensioactivos no iónicos y aniónicos o mezclas de tensioactivos no iónicos y catiónicos. Los tensioactivos no iónicos, aniónicos y catiónicos y sus usos recomendados se describen en una variedad de referencias publicadas incluyendo McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, Ediciones Americana e Internacional anuales publicadas por McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely y Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., Nueva York, 1964; y A. S. Davidson y B. Milwidsky, Synthetic Detergents, Séptima Edición, John Wiley and Sons, Nueva York, 1987.

Las composiciones de la presente invención también pueden contener adyuvantes de formulación y aditivos, conocidos por los expertos en la técnica como asistentes de formulación (algunos de los cuales puede considerarse que también funcionan como diluyentes sólidos, diluyentes líquidos o tensioactivos). Tales adyuvantes de formulación y aditivos pueden controlar: el pH (tampones), la espumación durante el procesamiento (antiespumantes tales como poliorganosiloxanos), la sedimentación de los ingredientes activos (agentes de suspensión), la viscosidad (espesantes tixotrópicos), el crecimiento microbiano dentro del recipiente (antimicrobianos), la congelación del producto (anticongelantes), el color (colorantes/dispersiones de pigmento), la eliminación por lavado (formadores de película o adherentes), la evaporación (retardantes de la evaporación) y otros atributos de la formulación. Los formadores de película incluyen, por ejemplo, poli(acetatos de vinilo), copolímeros de poli(acetato de vinilo), copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo, poli(alcoholes vinílicos), copolímeros de poli(alcohol vinílico) y ceras. Los ejemplos de adyuvantes de formulación y aditivos incluyen los enumerados en el Volumen 2 de McCutcheon's: Functional Materials, ediciones Norteamericana e Internacional anuales publicadas por McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; y la Publicación PCT WO 03/024222.

El compuesto de Fórmula 1 y cualquier otro ingrediente activo se incorporan típicamente en las presentes composiciones disolviendo el ingrediente activo en un disolvente o triturando en un diluyente líquido o seco. Las disoluciones, que incluyen concentrados emulsificables, se pueden preparar por simple mezcla de los ingredientes. Si el disolvente de una composición líquida destinada al uso como un concentrado emulsificable es inmisible en agua, se añade típicamente un emulsionante para emulsionar el disolvente que contiene el agente activo en la dilución con agua. Las suspensiones de ingrediente activo, con diámetros de partícula de hasta 2.000 μm , pueden molerse en húmedo usando molinos de medios para obtener partículas con diámetros promedio por debajo de 3 μm . Las suspensiones acuosas pueden convertirse en concentrados de suspensión acabada (véase, por ejemplo, el documento U.S. 3.060.084) o procesarse adicionalmente mediante secado por pulverización para formar gránulos dispersables en agua. Las formulaciones secas requieren habitualmente procedimientos de molienda en seco, que producen diámetros de partícula promedio en el intervalo de 2 a 10 μm . Los polvos de espolvoreo y los polvos pueden prepararse mediante mezcla y habitualmente molienda (tal como con un molino de martillos o un molino de energía de fluidos). Los gránulos y pélets se pueden preparar pulverizando el material activo sobre vehículos granulares preformados o por técnicas de aglomeración. Véase Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, 4 de diciembre de 1967, páginas 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4^a Ed., McGraw-Hill, Nueva York, 1963, páginas 8-57 y siguientes, y el documento WO 91/13546. Los pélets pueden prepararse como se describe en

el documento U.S. 4.172.714. Los gránulos dispersables en agua y solubles en agua pueden prepararse como se enseña en los documentos U.S. 4.144.050, U.S. 3.920.442 y DE 3.246.493. Los comprimidos pueden prepararse como se enseña en los documentos U.S. 5.180.587, U.S. 5.232.701 y U.S. 5.208.030. Las películas pueden prepararse como se enseña en los documentos GB 2.095.558 y U.S. 3.299.566.

- 5 Para información adicional respecto a la técnica de la formulación, véanse T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" en Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks y T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, páginas 120-133. Véase también el documento U.S. 3.235.361, Columna 6, línea 16 a Columna 7, línea 19 y los Ejemplos 10-41; el documento U.S. 3.309.192, Columna 5, línea 43 a Columna 7, línea 62 y los Ejemplos 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 y 169-182; el documento U.S. 2.891.855, Columna 3, línea 66 a Columna 5, línea 17 y los Ejemplos 1-4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley y Sons, Inc., Nueva York, 1961, páginas 81-96; Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; y Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.
- 10
- 15 En los siguientes Ejemplos, todos los porcentajes están en peso y todas las formulaciones se preparan por las rutas convencionales. Los números de compuesto se refieren a compuestos en las Tablas Índice A-B. Sin elaboración adicional, se cree que un experto en la técnica, usando la descripción anterior, puede utilizar la presente invención en su extensión más amplia. Los Ejemplos siguientes se interpretan, por tanto, como meramente ilustrativos, y no limitantes de la descripción bajo ninguna forma en absoluto. Los porcentajes están en peso excepto cuando se
- 20 indique otra cosa.

Ejemplo A

Concentrado de Alta Potencia

Compuesto 1	98,5%
aerogel de sílice	0,5%
sílice fino amorfo sintético	1,0%

Ejemplo B

Polvo Humectable

Compuesto 2	65,0%
Dodecilfenol-polietilenglicol-éter	2,0%
Ligninsulfonato de sodio	4,0%
Silicoaluminato de sodio	6,0%
Montmorillonita (calcinada)	23,0%

Ejemplo C

Gránulo

Compuesto 3	10,0%
Gránulos de atapulgita (bajo contenido en materia volátil, 0,71/0,30 mm; Tamices U.S.S. N° 25-50)	90,0%

Ejemplo D

Pélet extruido

Compuesto 4	25,0%
Sulfato de sodio anhidro	10,0%
Ligninsulfonato de calcio en bruto	5,0%
Alquilnaftalensulfonato de sodio	1,0%
Bentonita de calcio/magnesio	59,0%

Ejemplo E

Concentrado Emulsificable

Compuesto de Referencia 8	10,0%
hexoleato de polioxietilensorbitol	20,0%
éster metílico de ácidos grasos C6-C10	70,0%

Ejemplo F

Microemulsión

Compuesto de Referencia 10	5,0%
Copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo	30,0%
Alquilpoliglicósido	30,0%
Monooleato de glicerilo	15,0%
agua	20,0%

Ejemplo G

Tratamiento de semilla

Compuesto de Referencia 14	20,00%
Copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo	5,00%
Cera ácida montana	5,00%
Ligninsulfonato de calcio	1,00%
Copolímeros de bloques de polioxietileno/polioxipropileno	1,00%
Alcohol estearílico (POE 20)	2,00%
Poliorganosilano	0,20%
Tinte de colorante rojo	0,05%
agua.	65,75%

Los compuestos de la presente invención son útiles como agente de control de enfermedad de plantas. La presente invención por ello además comprende un procedimiento para controlar las enfermedades de plantas provocada por patógenos micótico de plantas que comprende aplicar a la planta o parte de la misma que debe ser protegida, o a la emilla de la planta que debe ser protegida, una cantidad efectiva de un compuesto de la invención o una composición fungicida que contiene dicho compuesto. Los compuestos y/o composiciones de la presente invención proporcionan el control de enfermedades provocada por un amplio espectro de patógenos micótico de plantas en las clases Basidiomycete, Acomycete, Oomycete y Deuteromycete. Las mismas son efectivas en el control de un amplio espectro de enfermedades de plantas, particularmente patógenos foliares de cultivos ornamentales, vegetales, de campo, cereales, y frutas. Estos patógeno incluyen Oomycete, incluyendo enfermedades de Phytophthora tales como Phytophthora infestans, Phytophthora megasperma, Phytophthora parasitica, Phytophthora cinnamomi y Phytophthora capsici, enfermedades de Pythium tales como Pythium aphanidermatum, y enfermedad de la familia Peronosporaceae tal como Plasmopara viticola, especie Peronospora (incluyendo peronospora tabacina y Peronospora parasitica), especie Pseudoperonospora (incluyendo Pseudoperonospora cubensis) y Bremia Lactucae; Acomycetes, incluyendo enfermedades de Alternaria tales como Alternaria solani y Alternaria Brassicae, enfermedades de Guignardia tales como Guignardia bidwell, enfermedades de Venturia tales como Venturia inaequalis, enfermedades de Septoria tales como Septoria nodorum y Septoria tritici, enfermedades de moho polvoriento tales como especie Erysiphe (incluyendo Erysiphe graminis y Erysiphe polygoni) Uncinula necatur, Sphaerotheca fuligna y Podophaera leucotricha, Pseudocercoporella herpotrichoides, enfermedades de Botrytis tales como Botrytis cinerea, Monilinia fructicola, enfermedades de Sclerotinia tales como Sclerotinia CLEROTIORUM, Magnaporthe grisea, Phomopsis viticola, enfermedades de Helminthosporium tales como Helminthosporium tritici repentis, Pyrenophora teres, enfermedad de anthracnose tales como especies Glomerella o Colletotrichum (tal como Colletotrichum graminicola y Colletotrichum orbiculare), y Gaeumannomyces graminis; Basidiomycetes, incluyendo enfermedades de roya provocadas por especie Puccinia (tales como Puccinia recondita, Puccinia striiformis, Puccinia hordei, Puccinia graminis y Puccinia arachidis), Hemileia vaticatrix y Phakopsora pachyrhizi; otros patógenos que incluyen especie Rhizoctonia (tal como Rhizoctonia solani); enfermedades de Fusarium tales como Fusarium roseum, Fusarium graminearum y Fusarium oxysporum; Verticillium dahliae; Sclerotium rolfsii;

Rhynchosporium secalis; Cercosporidium personatum, Cercospora arachidicola y Cercospora beticola; y otros género y especies estrechamente relacionadas con estos patógenos. Además de su actividad fungicida, las composiciones o combinaciones también tienen actividad contra bacterias tales como Erwinia amylovora, Xanthomonas campestris, Pseudomonas syanilloae, y otras especies relacionadas.

- 5 El control de las enfermedades de plantas comúnmente se logra mediante la aplicación de una cantidad efectiva de un compuesto de la presente invención previo o posterior a la infección, a la parte de la planta que debe ser protegida tal como las raíces, tallos, follaje, fruta, semillas, tubérculos o bulbos, o al medio (tierra o arena) en el que están creciendo las plantas que deben ser protegidas. Los compuestos también pueden aplicarse a semillas para proteger las semillas y plántulas que se desarrollan de las semillas. Los compuestos también pueden aplicarse a través del riego de agua para tratar las plantas.

10 Los porcentajes de aplicación para estos compuestos pueden ser afectados por muchos factores del ambiente y deben determinarse en condiciones de uso real. El follaje comúnmente puede protegerse cuando es tratado en un porcentaje de menos que aproximadamente 1 g/ha a aproximadamente 5,000 g/ha del ingrediente activo. La semilla y plántulas comúnmente puede protegerse cuando la semilla es tratada en un porcentaje de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 10 g por kilogramo de semilla.

15 Los compuestos de la presente invención también pueden mezclarse con uno o más otros insecticidas, fungicidas, nematocidas, bactericidas, acaricidas, reguladores del crecimiento, quimioesterilizantes, productos semioquímicos, repelentes, atrayentes, feromonas, estimulantes del apetito, otros compuestos biológicamente activos para formar un pesticida de múltiples componentes que proporciona un espectro incluso más amplio de protección agrícola. Los ejemplos de dichos protectores agrícolas con los que los compuestos de la presente invención pueden formularse son: insecticidas tales como abamectina, acefato, acetamidipirid, acetoprol, amidoflumet (S-1955), avermectina, azadiractina, azinfos-metilo, bifentrina, bifenazato, bistriflurona, buprofezina, carbofurano, cartap, clorfenapir, clorfluazurona, clorantraniliprol (DPX-E2Y45), clorfenapir, clorfluazuron, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cromafenozida, clotianidina, ciflumetofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiuona, diazinona, dieldrina, diflubenzurona, dimeflutrina, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, enestroburina (SYP-Z071), esfenvalerato, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenvalerato, fipronilo, flonicamid, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenerim (UR-50701), flufenoxurona, fonofos, halofenozida, hexaflumurona, hidrametilnona, imidacloprid, indoxacarb, isofenfos, lufenurona, malation, metaflumizurona, metaldehído, metamidofos, metidation, metomilo, metopreno, metoxiclor, metoflutrina, monocrotofos, metoxifenozida, nitenpiram, nitiazina, novalurona, noviflumurona (XDE-007), oxamilo, paration, paration-metilo, permetrina, forato, fosalona, fosmet, fosfamidona, pirimicarb, profenofos, proflutrina, pimetozina, pirafloprol, piretrina, piridialilo, pirifluquinazona, piriprolo, piriproxifeno, rotenona, rinaxipir, rianodina, espinetoram, espinosad, espirodiclofeno, espiromesifeno (BSN 2060), espirotetramato, sulprofos, tebufenozida, teflubenzurona, teflutrina, terbufos, tetraclorvinfos, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tralometrina, triazamato, triclorfona y triflumurona; fungicidas tales como acibenzolar-S-metilo, aldimorfo, amisulbrom, anilazina, azaconazol, azoxistrobina, benalaxilo, benalaxilo-M, benodanilo, benomilo, bentiavalicarb, bentiavalicarb-isopropilo, betoxazin, binapacril, bifenil, bitertanol, bixafeno, blastidina-S, mezcla de Bordeaux (sulfato de cobre tribásico), boscalid, bromuconazol, bupirimate, butiobato, captafol, captano, carbendazim, carboxina, carpropamid, cloroneb, clorothalonil, clozolinato, clotrimazol, oxiclóruo de cobre, sales de cobre tales como sulfato de cobre y hidróxido de cobre, ciazofamid, ciflufenamid, cimoxani1, ciproconazol, ciprodinil, diclofluanid, diclocimet, diclomezina, dicloran, diethofencarb, difenoconazol, diflumerim, dimetirimol, dimetomorf, dimoxistrobina, diniconazol, diniconazol-M, dinocap, ditianon, dodemorf, dodina, edifenfos, enestroburina, epoxiconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamid, fenoxanil, fenciclonil, fenpropidina, fenpropimorf, acetato de fentina, cloruro de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferimzón, fluazinam, fludioxonil, flumorf, fluopicolida, fluopiram, fluoroimida, fluoxastrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutolanil, flutriafol, folpet, fosetil-aluminio, fuberidazol, furalaxilo, furametpir, guazatina, hexaconazol, himexazol, imazalil, imibenconazol, albesilato de iminocadina, triacetato de iminocadina, iodocarb, ipconazol, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb, isoprotilano, isotianil, kasugamicina, kresoxim-metilo, mancozeb, mandipropamid, maneb, mepanipirim, mepronil, meptildinocap, metalaxilo, metalaxil-M, metconazol, metasulfocarb, metiram, metominostrobina, metrafenona, miclobutanil, naftifina, neo-asozin (metanoarsonato férrico), nuarimol, octilnona, ofurace, orisastrobina, oxadixilo, ácido oxolinico, oxpoconazol, oxicarboxina, oxtetraciclina, pefurazoato, penconazol, pencicuron, pentiopirad, ácido fosforico y sales, ftalida, picobenzamid, picoxistrobina, piperalina, polioxina, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propamocarb-hidrocloreuro, propiconazol, propineb, proquinazid, protiocarb, protioconazol, priazofos, piraclostrobin, piribencarb, piributicarb, pirifenox, pirimethanil, pirrolnitrin, piroquilon, quinometionato, quinoxifen, quintozeno, siltiofam, simeconazol, spiroxamina, estreptomycin, azufre, tebuconazol, teclotalam, tecnazeno, terbinafina, tetraconazol, tiabendazol, tifulzamid, tiofanato, tiofanato-metilo, tiram, tiadinil, tolclfosmetilo, tolifluanid, triadimefon, triadimenol, triazóxido, triciclazol, tridemorf, trifloxistrobina, triflumizol, triforina, triticonazol, uniconazol, validamicina, valifenal, vinclozolin, zineb, ziram, zoxamida, N-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-[2-(1S,2R)-[1,1'-bicyclopropil]-2-ilfenil]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, α -[metoxiimino]-N-metil-2-[[[1-[3-(trifluorometil)-fenil]-etoxi]imino]metil]bencenoacetamida, 2-[[[3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-2-propen-1-ilideno]amino]oxi]metil]-a-(metoxiimino)-N-metil bencenoacetamida, N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]butanamida, N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(etilsulfonil)amino]butanamida, 2-[[2-fluoro-5-(trifluorometil)fenil]tio]-2-[3-

(2-metoxifenil)-2-thiazolidinilidene]acetonitrilo, 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4H-1-benzopiran-4-ona, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-3-isoxazolidinil]piridina, 4-fluorofenil-N-[1-[[[1-(4-cianofenil)etil]sulfonil]-metil]propil]carbamato, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, N-(4-cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metilbencenosulfonamida, N-[[[ciclopropilmetoxi]amino]-[6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metileno]bencenoacetamida, N'-[4-[4-cloro-3-(trifluorometil)fenoxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilmetanimidamida, y 1-[(2-propenil)carbonil]-2-(1-metiletil)-4-(2-metilfenil)-5-amino-1H-piazol-3-ona: nematocidas tales como aldicarb, imiciafos, oxamilo y fenamifos; bactericidas tales como estreptomycin; acaricidas tales como amitraz, chinometionat, clorobenzilato, cihexatin, dicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenpropatrina, fenpiroximato, hexitiazox, propargita, piridaben y tebufenpirad; y agente biológicos que incluyen bacterias entomopatógenicas, tales como *Bacillus thuanilloiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuanilloiensis* subsp. *kurstaki*, y la endotoxinas delta encapsuladas de *Bacillus thuanilloiensis* Cellcap, MPV, MPVII); hongos entomopatógenos tales como hongo mucardina verde; y virus entomopatógenos que incluyen baculovirus, virus nucleopolihedro (NPV) tal como HzNPV, AfNPV; y virus granulosis (GV) tal como CpGV.

Los compuestos de la presente invención y composiciones de los mismos pueden aplicarse a plantas genéticamente transformadas para expresar la proteínas tóxicas para plagas de invertebrados (tal como delta-endotoxinas *thuanilloiensis* *Bacillus*). El efecto de los compuestos fungicidas aplicados en forma exógena puede ser sinérgico con la proteína de toxinas expresadas.

La referencia generales para protectores agrícolas (es decir, insecticidas, fungicidas, nematocidas, acaricidas, herbicidas y agente biológico) incluyen *The Pesticide Manual*, 13^o Edición, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 y *The BioPesticide Manual*, 2^o Edición, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, Reino Unido, 2001.

Para las Realizaciones en las que se utiliza uno o más de estos diversos auxiliares de mezclado, la relación en peso de estos diversos auxiliares de mezclado (en total) respecto del compuesto de Fórmula 1 típicamente está entre aproximadamente 1:100 y aproximadamente 3000:1. Cabe mencionarse las relaciones en peso entre aproximadamente 1:30 y aproximadamente 300:1 (por ejemplo relaciones entre aproximadamente 1:1 y aproximadamente 30:1). Será evidente que incluir 4 estos componentes adicionales puede expandir el espectro de la enfermedad controlada más allá del espectro controlado por el compuesto de Fórmula 1 solo.

En una realización de la mezcla, los gránulos de una composición sólida que comprende un compuesto de Fórmula 1 se mezcla con los gránulos de una composición sólida que comprende otro protector agrícola. Esta mezcla de gránulos puede ser en conformidad con la divulgación de mezcla de gránulo general de la Publicación de Patente WO 94/24861 o más preferiblemente la enseñanza de mezcla de gránulos homogénea de la Patente Estadounidense 6.022.552.

Cabe mencionarse las combinaciones (por ejemplo, en forma de composiciones) de (a) un compuesto de Fórmula 1 con (b) al menos otro fungicida. Cabe mencionare particularmente dichas combinaciones en las que otro fungicida tiene diferente sitio de acción del compuesto de Fórmula 1. En ciertos casos, las combinaciones con otros fungicidas que tienen un espectro de control similar pero un sitio de acción diferente serán particularmente ventajosas para el control de la resistencia,

Caben mencionarse las composiciones que además de un compuesto de Fórmula 1 incluyen al menos un compuesto seleccionado del grupo que consiste en

(b1) fungicidas de carbamato de metil benzimidazol (MBC);

(b2) fungicidas de dicarboximida;

(b3) fungicidas inhibidores de la desmetilación (DMI);

(b4) fungicidas de fenilamida;

(b5) fungicidas de amina/morfolina;

(b6) fungicidas inhibidores de la biosíntesis de fosfolípidos;

(b7) fungicidas de carboxamida;

(b8) fungicidas de hidroxil(2-amino-)pirimidina;

(b9) fungicidas de anilino pirimidina;

(b10) fungicidas de carbamato de N-fenilo;

(b11) fungicidas inhibidores de la parte externa de la quinona (Qol);

(b12) fungicidas de fenilpirrol;

ES 2 398 854 T3

- (b13) fungicidas de quinolina;
- (b14) fungicidas inhibidores de la peroxidación de lípidos;
- (b15) fungicidas inhibidores de la biosíntesis de melanina reductasa (MBI-R);
- (b16) fungicidas inhibidores de la biosíntesis de melanina deshidratasa (MBI-D);
- 5 (b17) fungicidas de hidroxianilida;
- (b18) fungicidas inhibidores de escualeno-epoxidasa;
- (b19) fungicidas de polioxina;
- (b20) fungicidas de fenilurea;
- (b21) fungicidas inhibidores de la parte interna de la quinona (Qil);
- 10 (b22) fungicidas de benzamida;
- (b23) fungicidas de antibióticos de ácido enopiranurónico;
- (b24) fungicidas de antibióticos de hexopiranosilo;
- (b25) fungicidas de síntesis de proteína: antibiótico de glucopiranosilo;
- (b26) fungicidas de biosíntesis trehalasa y inositol: antibiótico de glucopiranosilo;
- 15 (b27) fungicidas de cianoacetamidaoxima;
- (b28) fungicidas de carbamato;
- (b29) fungicidas de acoplamiento de fosforilación oxidativa;
- (b30) fungicidas de órgano estaño;
- (b31) fungicidas de ácido carboxílico;
- 20 (b32) fungicidas heteroaromáticos;
- (b33) fungicidas de fosfonato;
- (b34) fungicidas de ácido ftálico;
- (b35) fungicidas de benzotriazina;
- (b36) fungicidas de benceno-sulfonamida;
- 25 (b37) fungicidas de piridazinona;
- (b38) fungicidas de tiofeno-carboxamida;
- (b39) fungicidas de pirimidinamida;
- (MO) fungicidas de amida de ácido carboxílico (CAA);
- (b41) fungicidas de antibióticos de tetraciclina;
- 30 (b42) fungicidas de tiocarbamato;
- (b43) fungicidas de benzamida;
- (b44) fungicidas de inducción de defensa de planta huésped;
- (b45) fungicidas de actividad de contacto en múltiples sitios;
- (b46) fungicidas distintos de los fungicidas del componente (a) y componentes (b1) a (b45); y
- 35 sales de compuestos de (b1) a (b46).

Los "fungicidas de carbamato de metil benzimidazol (MBC) (b1)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 1) inhiben mitosis mediante la unión a D-tubulina durante el ensamblaje de microtúbulos. La

inhibición del ensamblaje de microtúbulos puede interrumpir la división celular, transporte dentro de la célula y estructura celular. Los fungicidas de carbamato de metil benzimidazol incluyen fungicidas de benzimidazol y tiofanato. Los benzimidazoles incluyen benomilo, carbendazim, fuberidazol y tiabendazol. Los tiofanatos incluyen tiofanato y tiofanato-metilo.

- 5 Los "fungicidas de dicarboximida (b2)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 2) se proponen para inhibir una peroxidación de lípidos en hongo a través de la interferencia con NADH citocromo c reductasa. Los ejemplos incluyen clozolinato, iprodiona, procimidona y vinclozolin.

- 10 Los "fungicidas inhibidores de la desmetilación (DMI) (b3)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 3) inhiben C14-demetilasa que juega un papel en la producción de esterol. Los esteroides, tales como ergosterol, son necesarios para la estructura y función de membrana, haciéndolo esenciales para el desarrollo de la paredes celulares funcionales. Por ello la exposición a estos fungicidas da como resultado el crecimiento anormal y eventualmente la muerte de hongos sensibles. Los fungicidas DMI se dividen entre varias clases químicas: azoles (que incluyen triazoles y imidazoles), pirimidinas, piperazinas y piridinas. Los triazoles incluyen azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol (que incluyen diniconazol-M), epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, myclobutanil, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticoconazol y uniconazol. Los imidazoles incluyen clotrimazol, imazalilo, oxpoconazol, procloraz, pefurazoato y triflumizol. Las pirimidinas incluyen fenarimol y nuarimol. Las piperazinas incluyen triforina. Las piridinas incluyen pirifenox. Las investigaciones bioquímicas han demostrado que todos los fungicidas mencionados más arriba son fungicidas DMI según lo descrito por K. H. Kuck et al. en *Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action*, H. Lyr (Ed.), Gustav Fischer Verlag: Nueva York, 1995, 205-258.
- 15
- 20

- 25 Los "fungicidas de fenilamida (b4)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 4) son inhibidores específicos del ARN polimerasa en los hongos Oomycete. Los hongos sensibles expuestos a estos fungicidas muestran una reducción en la capacidad de incorporar uridina al ARNr. El crecimiento y desarrollo en los hongos sensibles se evita mediante la exposición a esta clase de fungicida. Los fungicidas de fenilamida incluyen fungicidas de acilalanina, oxazolidinona y butirolactona. Las acilalaninas incluyen benalaxilo, benalaxil-M, furalaxilo, metalaxilo y metalaxil-M/mefenoxam. Las oxazolidinonas incluyen oxadixilo. Las butirolactonas incluyen ofurace.

- 30 Los "fungicidas de amina/morfolina (b5)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 5) inhiben dos sitios blanco dentro de la vía biosintética de esterol, A⁸ -> A⁷ isomerasa y A¹⁴ reductasa. Los esteroides, tales como ergosterol, son necesarios para la estructura y función de la membrana, haciéndolos esenciales para el desarrollo de la paredes celulares funcionales. Por ello, la exposición a estos fungicidas da como resultado el crecimiento anormal y eventualmente la muerte de hongos sensibles. Los fungicidas de amina/morfolina (también conocidos como inhibidores de la biosíntesis de esteroides no DMI) incluyen fungicidas de morfolina, piperidina y espiroquetal-amina. Las morfolinas incluyen aldimorf, dodemorf, fenpropimorf, tridemorf y trimorfamida. Las piperidinas incluyen fenpropidina y piperalina. Las espiroquetal-aminas incluyen espiroxamina.
- 35

Los "fungicidas inhibidores de la biosíntesis de fosfolípidos (b6)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 6) inhiben el crecimiento de hongos afectando la biosíntesis de los fosfolípidos. Los fungicidas de biosíntesis de los fosfolípidos incluyen fungicidas de fosfortiolato y ditiolano. Los fosfortiolatos incluyen edifenfos, iprobenfos y pirazofos. Los ditiolanos incluyen isoprotiolano.

- 40 Los "fungicidas de carboxamida (b7)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 7) inhiben la respiración micótica del Complejo II (succinato dehidrogenasa) interrumpiendo una enzima clave en el ciclo Krebs (ciclo TCA) denominado succinato dehidrogenasa. La inhibición de la respiración evita que los hongos realicen ATP, y de ese modo inhibe el crecimiento y reproducción. Los fungicidas de carboxamida incluyen benzamida, furan carboxamida, oxathiin carboxamida, tiazol carboxamida, pirazol carboxamida y piridina carboxamida. Las benzamidas incluyen benodanil, flutolanil y mepronil. Las furan carboxamidas incluyen fenfuram. Las oxathiin carboxamidas incluyen carboxina y oxicarboxina. Las tiazol carboxamidas incluyen tifluzamida. Las pirazol carboxamidas incluyen furametpir, pentiopirad, bixafen, N-[2-(1S,2R)-[1,1'-bicyclopropil]-2-ilfenil]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida y N-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida. Las piridinas carboxamidas incluyen boscalid.
- 45

- 50 Los "fungicidas de hidroxí(2-amino-)pirimidina (b8)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 8) inhiben la síntesis de ácido nucleico mediante la interferencia con la adenosina deaminasa. Los ejemplos incluyen bupirimato, dimetirimol y etirimol.

- 55 Los "fungicidas de anilopirimidina (b9)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 9) se proponen inhibir la biosíntesis de la metionina de aminoácidos y para interrumpir la secreción de las enzimas hidrolíticas que lisan las células vegetales durante la infección. Los ejemplos incluyen ciprodinilo, mepanipirim y pirimethanilo.

Los "fungicidas de carbamato de N-fenilo (b10)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 10) inhiben la mitosis mediante la unión a O-tubulina y la interrupción del ensamblaje de microtúbulos. La inhibición del

ensamblaje de microtúbulos puede interrumpir la división celular, transporte dentro de la célula y estructura celular. Los ejemplos incluyen dietofencarb.

5 Los "fungicidas inhibidores de la parte externa de la quinona (Qol) (b11)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 11) inhiben la respiración mitocondrial del Complejo III en hongos afectando la ubiquinol oxidasa. La oxidación del ubiquinol es bloqueado en el sitio externo de la quinona (Q_o) del complejo de citocromo bc₁, que está ubicado en la membrana mitocondrial interna de los hongos. La inhibición de la respiración mitocondrial previene el crecimiento y desarrollo micótico normal. Los fungicidas inhibidores de la parte externa de la quinona (también conocidos como fungicidas de estrobilurina) incluyen fungicidas de metoxiacrilato, metoxicarbamato, oximinoacetato, oxirminoacetamida, oxazolinediona, dihidrodioxazina, imidazolinona y bencilcarbamato. Los metoxiacrilatos incluyen azoxistrobina, enestroburina (SYP-Z071) y picoxistrobina. Los metoxicarbamatos incluyen piraclastrobina. Los oximinoacetatos incluyen kresoxim-metilo y trifloxistrobina. Las oximinoacetamidas incluyen dimoxistrobina, metominostrobrina, oryastrobina, α-[metoxiimino]-N-metil-2-[[[1-[3-(trifluorometil)fenil]-etoxi]imino]metil]bencenoacetamida y 2-[[[3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-2-propen-1-ilideno]amino]oxi]metil]-a-(metoxiimino)-N-metilbencenoacetamida. Las oxazolinedionas incluyen famoxadona. Las dihidrodioxazinas incluyen fluoxastrobina. Las imidazolinonas incluyen fenamidona. Los bencilcarbamatos incluyen piribencarb.

Los "fungicidas de fenilpirrol (b12)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 12) inhiben una proteína quinasa MAP asociada a la transducción de la señal osmótica en hongos. Fenpiclonilo y fludioxonilo son ejemplos de esta clase de fungicida.

20 Los "fungicidas de quinolina (b13)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 13) se proponen para inhibir la transducción de señal afectando las proteínas G en la señalización celular temprana. Los mismos han demostrado que interfieren con la germinación y/o formación de apresorios en hongos que provocan enfermedades de moho polvoriento. El quinoxifeno es un ejemplo de esta clase de fungicida.

25 Los "fungicidas inhibidores de la peroxidación de lípidos (b14)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 14) se proponen para inhibir la peroxidación de lípidos que afecta la síntesis de membrana en hongos. Los miembros de esta clase, tal como etridiazol, también pueden afectar otros procesos biológicos tales como respiración y biosíntesis de melanina. Los fungicidas de peroxidación de lípidos incluyen fungicidas de carbono aromático y 1,2,4-tiadiazol. Los carbonos aromáticos incluyen bifenilo, cloroneb, dicloran, quintozeno, tecnazeno y tolclofos-metilo. Los 1,2,4-tiadiazoles incluyen etridiazol.

30 Los "fungicidas inhibidores de la biosíntesis de melanina reductasa (MBI-R) (b15)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 16.1) inhiben la etapa de reducción de naftal en la biosíntesis de melanina. La melanina es requerida para la infección de plantas huésped por algunos hongos. Los fungicidas inhibidores de la biosíntesis de melanina reductasa incluyen fungicidas de isobenzofuranona, pirroloquinolinona y triazolobenzotiazol. Las isobenzofuranonas incluyen ftalida. Las pirroloquinolinonas incluyen piroquilona. Los triazolobenzotiazoles incluyen triciclazol.

35 Los "fungicidas inhibidores de la biosíntesis de melanina deshidratasa (MBI-D) (b16)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 16.2) inhiben la escitalona deshidratasa en la biosíntesis de melanina. La melanina es requerida para la infección de plantas huésped por algunos hongos. Los fungicidas inhibidores de la biosíntesis de melanina deshidratasa incluyen fungicidas de ciclopropanecarboxamida, carboxamida y propionamida. Las ciclopropanecarboxamidas incluyen carpropamid. Las carboxamidas incluyen diclocimet. Las propionamidas incluyen fenoxanilo.

Los "fungicidas de hidroxianilida (b17)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 17) inhiben la C4-demetilasa que juega un papel en la producción de esterol. Los ejemplos incluyen fenhexamid.

45 Los "fungicidas inhibidores de escualeno-epoxidasa (b18)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 18) inhiben el escualeno-epoxidasa en la vía de biosíntesis de ergosterol. Los esterol tales como ergosterol son necesarios para la estructura y función de la membrana haciéndolos esenciales para el desarrollo de la paredes celulares funcionales. Por ello la exposición a estos fungicidas da como resultado el crecimiento anormal y eventualmente la muerte de los hongos sensibles. Los fungicidas inhibidores de escualeno-epoxidasa incluyen fungicidas de tiocarbamato y alilamina. Los tiocarbamatos incluyen piributicarb. Las alilaminas incluyen naftifina y terbinafina.

Los "fungicidas de polioxina (b19)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 19) inhiben la quitina sintasa. Los ejemplos incluyen polioxina.

Los "fungicidas de fenilurea (b20)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 20) se proponen para afectar la división celular. Los ejemplos incluyen pencicuron.

55 Los "fungicidas inhibidores de la parte interna de la quinona (Qil) (b21)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 21) inhiben la respiración mitocondrial del Complejo III en hongos afectando la ubiquinol reductasa. La reducción de ubiquinol es bloqueada en la "parte interna de la quinona" (Q_i) sitio del complejo

citocromo bc₁, que está ubicado en la membrana mitocondrial interna de los hongos. La inhibición de la respiración mitocondrial previene el crecimiento y desarrollo micótico normal. Los fungicidas inhibidores de la parte interna de la quinona incluyen fungicidas de cianoimidazol y sulfamoiltriazol. Los cianoimidazoles incluyen ciazofamid. Los sulfamoiltriazoles incluyen amisulbrom.

5 Los "fungicidas de benzamida (b22)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 22) inhiben la mitosis mediante la unión un ensamblaje de disrupción y la P-tubulina. La inhibición del ensamblaje de microtúbulos puede interrumpir la división celular, transporte dentro de la célula y estructura celular. Los ejemplos incluyen zoxamida.

10 Los "fungicidas de antibióticos de ácido enopiranurónico (b23)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 23) inhiben el crecimiento de hongos afectando la biosíntesis de proteínas. Los ejemplos incluyen blastidicidín-S.

Los "fungicidas de antibióticos de hexopiranosilo (b24)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 24) inhiben el crecimiento de hongos afectando la biosíntesis de proteínas. Los ejemplos incluyen kasugamicina.

15 Los "fungicidas de síntesis de proteínas: antibióticos de glucopiranosilo: (b25)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 25) inhiben el crecimiento de hongos afectando la biosíntesis de proteínas. Los ejemplos incluyen estreptomycinina.

20 Los "fungicidas de biosíntesis de trehalasa y inositol de antibióticos de lucopiranosilo (b26)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 26) inhiben la trehalasa en la vía de biosíntesis de inositol. Los ejemplos incluyen validamicina.

Los "fungicidas de cianoacetamidaoxima (b27)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 27) incluyen cimoxanilo.

25 Los "fungicidas de carbamato (b28)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 28) son considerados inhibidores de múltiples sitios del crecimiento micótico. Los mismos se proponen para interferir con la síntesis de ácidos grasos en las membranas celulares, lo que después interrumpe la permeabilidad de la membrana. Propamacarb, propamacarb-hidrocloruro, iodocarb, y protiocarb son ejemplos de esta clase de fungicida.

Los "fungicidas de desacoplamiento de fosforilación oxidativa (b29)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 29) inhiben la respiración micótica mediante el desacoplamiento de la fosforilación oxidativa. La inhibición de la respiración previene el crecimiento y desarrollo micótico normal.

30 Esta clase incluye 2,6-dinitroanilinas tales como fluazinam, pirimidonehidrazonas tales como ferimzona y dinitrofenil crotonatas tales como dinocap, meptildinocap y binapacril.

Los "fungicidas de órgano estaño (b30)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 30) inhiben la adenosina trifosfato (ATP) sintasa en la vía de fosforilación oxidativa. Los ejemplos incluyen acetato de fentina, cloruro de fentina e hidróxido de fentina.

35 Los "fungicidas de ácido carboxílico (b31)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 31) inhiben el crecimiento de hongos afectando la topoisomerasa tipo II (girasa) del ácido deoxiribonucleico (ADN). Los ejemplos incluyen ácido oxolinico.

40 Los "fungicidas heteroaromáticos (b32)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 32) se proponen para afectar la síntesis del ADN/ácido ribonucleico (ARN). Los fungicidas heteroaromáticos incluyen fungicidas de isoxazol e isotiazolona. Los isoxazoles incluyen himexazol y las isotiazolonas incluyen octilina.

Los "fungicidas de fosfonato (b33)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 33) incluyen ácido fosforoso y sus diversas sales, que incluyen fosetil-aluminio.

Los "fungicidas de ácido ftálmico (b34)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 34) incluyen tecloftalam.

45 Los "fungicidas de benzotriazina (b35)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 35) incluyen triazóxido.

Los "fungicidas de benceno-sulfonamida (b36)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 36) incluyen flusulfamida.

50 Los "fungicidas de piridazinona (b37)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 37) incluyen diclomezina.

Los "fungicidas de tiofeno-carboxamida (b38)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 38)

se proponen para afectar la producción de ATP. Los ejemplos incluyen siltiofam.

Los "fungicidas de pirimidinamida (b39)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 39) inhiben el crecimiento de hongos afectando la biosíntesis de fosfolípidos e incluyen diflumetorim.

5 Los "fungicidas de amida de ácido carboxílico (CAA) (b40)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 40) se proponen para inhibir la biosíntesis de fosfolípidos y la deposición de pared celular. La inhibición de estos procesos previene el crecimiento y lleva a la muerte de los hongos blanco. Los fungicidas de amida de ácido carboxílico incluyen fungicidas de amida de ácido cinnámico, carbamato de valinamida y amida de ácido mandélico. Las amidas de ácido cinnámico incluyen dimetomorf y flumorf. Los carbamatos de valinamida incluyen bentiavalicarb, bentiavalicarb-isopropilo, iprovalicarb y valifenal. La amidas de ácido mandélico incluyen
 10 mandipropamid, N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]-etil]-3-metil-2-
 [(metilsulfonil)amino]butanamida y N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-
 [(etilsulfonil)amino]butanamida.

15 Los "fungicidas de antibióticos de tetraciclina (M1)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 41) inhiben el crecimiento de hongos afectando el la oxidoreductasa de nicotinamida adenina dinucleótido (NADH) del complejo 1. Los ejemplos incluyen oxitetraciclina.

Los "fungicidas de tiocarbamata (b42)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 42) incluyen methasulfocarb.

20 Los "fungicidas de benzamida (b43)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código 43) inhiben el crecimiento de hongos mediante la deslocalización de las proteínas similares a la espectrina. Los ejemplos incluyen fungicidas de acilpolicida tales como fluopicolida y fluopiram.

25 Los "fungicidas de inducción de defensa de plantas huésped (b44)" (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código P) inducen los mecanismos de defensa de las plantas huésped. Los fungicidas de inducción de defensa de plantas huésped incluyen fungicidas de benzo-tiadiazol, benzisotiazol y tiadiazol-carboxamida. Los benzo-tiadiazoles incluyen acibenzolar-S-metilo. Los benzisotiazoles incluyen probenazol. Las tiadiazol-carboxamidas incluyen tiadinilo e isotianilo.

30 Los fungicidas de contacto de múltiples sitios (b45)" inhiben el crecimiento micótico a través de múltiple sitios de acción y tienen actividad preventiva/de contacto. Esta clase de fungicidas incluye: "fungicidas de cobre (b45.1) (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código M1)", "fungicidas de azufre (b45.2) (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código M2)", "fungicidas de ditiocarbamato (b45.3) (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código M3)", " fungicidas de ftalimida (b45.4) (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código M4)", "fungicidas de cloronitrilo (b45.5) (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código M5)", "fungicidas de sulfamida (b45.6) (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código M6)", "fungicidas de guanidina (b45.7) (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código M7)" "fungicidas de triazinas (b45.8) (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código M8)" y "fungicidas de quinona (b45.9) (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código M9)". Los
 35 "fungicidas de cobre" son compuestos inorgánicos que contienen cobre, típicamente en el estado de oxidación de cobre(II); los ejemplos incluyen oxiclورو de cobre, sulfato de cobre e hidróxido de cobre, que incluyen composiciones tales como mezcla de Bordeaux (sulfato de cobre tribásico). Los "fungicidas de azufre" son producto químicos inorgánicos que contienen anillos o cadenas de átomos de azufre; los ejemplos incluyen azufre elemental.
 40 Los " fungicidas de ditiocarbamato" contienen un resto molecular de ditiocarbamato; los ejemplos incluyen mancozeb, metiram, propineb, ferbam, maneb, thiram, zineb y ziram. Los "fungicidas de ftalimida" contienen un resto molecular de ftalimida; los ejemplos incluyen folpet, captan y captafol. Los "fungicidas de cloronitrilo" contienen un anillo aromático sustituido con cloro y ciano; los ejemplos incluyen clorotalonilo. Los "fungicidas de sulfamida" incluyen diclofluanid y tolifluanid. Los "fungicidas de guanidina" incluyen dodina, guazatina, iminoctadina albesilato y
 45 triacetato de iminoctadina. Los "fungicidas de triazinas" incluyen anilazina. Los "fungicidas de quinona" incluyen ditanona.

"Fungicidas distintos de los fungicidas de componente (a) y componentes (b1) a (b45); (b46)" incluyen ciertos fungicidas que se considera que tienen un modo de acción desconocido.

50 Los mismos incluyen: "fungicidas de tiazol carboxamida (b46.1) (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código U5)", "fungicidas de fenil-acetamida (b46.2) (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código U6)", "fungicidas de quinazolinona (b46.3) (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código U7)" y "fungicidas de benzofenona (b46.4) (Comité de Acción de Resistencia de Fungicidas (FRAC) código U8)". Las tiazol carboxamidas incluyen etaboxam. Las fenil-acetamidas incluyen ciflufenamid y N-[[(ciclopropilmetoxi)amino] [6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]-metileno]bencenoacetamida. Las quinazolinonas incluyen proquinazid, 6-bromo-
 55 3-propil-2-propiloxi-4(3H)-quinazolinona, 6,8-diiodo-3-propil-2-propiloxi-4-(31)-quinazolinona, 6-cloro-2-propoxi-3-propiltieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, 2,3-dibutil-6-clorotieno[2,3-d]pirimidin-4(31i)-ona, 6-bromo-2-propoxi-3-propiltieno[2,3-d]pirimidin-4(31)-ona, 7-bromo-2-propoxi-3-propiltieno[3,2-d]pirimidin-4(3H)-ona, 6-bromo-2-propoxi-3-propilpirido[2,3-d]pirimidin-4(311)-ona, 6,7-dibromo-2-propoxi-3-propiltieno[3,2-d]pirimidin-4(3H)-ona, 3-

(ciclopropilmetil)-6-yodo-2-(propiltio)pirido[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4H-1-benzopiran-4-ona, 2-etoxi-6-yodo-3-propil-4H-1-benzopiran-4-ona, 6-yodo-2-propoxi-3-propil-4H-1-benzopiran-4-ona, 2-(2-buteniloxi)-6-iodo-3-propil-4H-1-benzopiran-4-ona, 6-yodo-2-(1-metilbutoxi)-3-propil-4H-1-benzopiran-4-ona, 2-(3-buteniloxi)-6-yodo-3-propil-4H-1-benzopiran-4-ona, 3-butil-6-yodo-2-(1-metiletoxi)-4H-1-benzopiran-4-ona, y 6-yodo-3-propil-2H-1,3-benzoxazina-2,4(3H)-diona 2-(O-metiloxima). Las benzofenonas incluyen metrafenona. El grupo (b46) también incluye betoxazina, neo-asozina (metanoarsonato férrico), pirrolnitrina, quinometionato 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (BAS600), 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilo-3-isoxazolidinil]piridina (SYP-Z048), 4-fluorofenil-N-[1-[[[1-(4-cianofenil)etil]sulfonil]metil]propil]carbamato (XR-539), N-[4-[4-cloro-3-(trifluorometil)fenoxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilmethanimidamida, 2-[[2-fluoro-5-(trifluorometil)fenil]tio]-2-[3-(2-metoxifenil)-2-tiazolidinilideno]acetónitrilo (OK-5203) y N-(4-cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metilbencenosulfonamida (TF-991).

Las Realizaciones de la presente invención incluyen:

Realización D1. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a C5) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b1) fungicidas de bencimidazol carbamato de metilo tales como benomilo, carbendazim y tiofanato-metilo.

Realización D2. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a C5) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b2) fungicidas de dicarboximida tales como procimidona, iprodiona y vinclozolina.

Realización D3. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b3) fungicidas inhibidores de desmetilación tales como epoxiconazol, fluquinconazol, triadimenol, simeconazol, ipconazol, triforina, ciproconazol, difenconazol, flusilazol, flutriafol, metconazol, miclobutanil, prochloraz, propiconazol, protioconazol, tebuconazol y tetraconazol.

Realización D4. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b4) fungicidas de fenilamida tales como metalaxil, metalaxil-M, benalaxil, benalaxil-M, furalaxil, ofurace y oxadixil.

Realización D5. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b5) fungicidas de amina/morfolina tales como aldimorf, dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, trimorfamida, fenpropidina, piperalina y espiroxamina.

Realización D6. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b6) fungicidas inhibidores de la biosíntesis de fosfolípidos tales como edifenfos y isoprotilano.

Realización D7. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b7) fungicidas de carboxamida tales como boscalid, pentiopirad, bixafen, carboxina y oxicarboxina.

Realización D8. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b8) fungicidas de hidroxil(2-amino)-pirimidina tales como etirimol.

Realización D9. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b9) fungicidas de anilino-pirimidina tales como ciprodinil.

Realización D10. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 24 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b10) fungicidas de carbamato de N-fenilo tales como diethofencarb.

Realización D11. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b11) fungicidas inhibidores de la parte externa de la quinona tales como azoxistrobina, piraclostrobin, kresoxim-metilo, trifloxistrobina, picoxistrobina, piribencarb, famoxadona, fenarnidona, enestrobina, dimoxistrobina, metominostrobin, orisastrobina y fluoxastrobina.

Realización D12. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b12) compuesto fungicida de fenilpirrol tal como fenciponil y fludioxonil.

- Realización D13. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b13) fungicidas de quinolina tales como quinoxifeno.
- 5 Realización D14. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b14) fungicidas inhibidores de la peroxidación de lípidos tales como cloroneb.
- 10 Realización D15. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b15) fungicidas inhibidores de la biosíntesis de melanina reductasa tales como piroquilon y triclazol.
- Realización D16. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b16) fungicidas inhibidores de la biosíntesis de melanina deshidratasa tales como carpropamid.
- 15 Realización D17. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b17) fungicidas de hidroxianilida tales como fenhexamid.
- Realización D18. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b18) fungicidas inhibidores de escualeno-epoxidasa tales como piributicarb.
- 20 Realización D19. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b19) fungicidas de polioxina tales como polioxina.
- Realización D20. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b20) fungicidas de fenilurea tales como pencicuron.
- 25 Realización D21. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b21) fungicidas inhibidores de la parte interna de la quinona tales como ciazofamid y amisulbrom.
- Realización D22. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b22) fungicidas de benzamida tales como zoxamida.
- 30 Realización D23. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b23) fungicidas de antibióticos de ácido enopiranurónico tales como blasticidin-S.
- 35 Realización D24. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b24) fungicidas de antibióticos de hexopiranosil tales como kasugamicina.
- Realización D25. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b25) fungicidas de síntesis proteica de antibiótico glucopiranosil tales como streptomina.
- 40 Realización D26. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b26) fungicidas de biosíntesis de trehalasa y inositol antibiótico glucopiranosil tales como validamicina.
- 45 Realización D27. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b27) fungicidas de cianoacetilamidaoxima tales como cimoxanil.
- Realización D28. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b28) fungicidas de carbamato tales como propamacarb, propamacarbhidrocloruro, protiocarb y yodocarb.
- 50 Realización D29. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto

seleccionado de (b29) fungicidas de fosforilación oxidativa sin acoplamiento tales como fluazinam, binapacril, ferimzona, meptildinocap y dinocap.

5 Realización D30. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b30) fungicidas de órgano estaño tales acetato de fentina.

Realización D31. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b31) fungicidas de ácido carboxílico tales como ácido oxolinico.

10 Realización D32. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b32) fungicidas heteroaromáticos tales como himexazol.

15 Realización D33. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b33) fungicidas de fosfonato tales como ácido fosforoso y sus diversas sales, que incluyen fosetil-aluminio.

Realización D34. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (que incluyen pero no se limitan a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b34) fungicidas de ácido ftálmico tales como teclotfalam.

20 Realización D35. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b35) fungicidas de benzotriazina tales como triazóxido.

Realización D36. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b36) fungicidas de benceno-sulfonamida tales como flusulfamida.

25 Realización D37. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b37) fungicidas de piridazinona tales como diclomezina.

30 Realización D38. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b38) fungicidas de tiofeno-carboxamida tales como siltiofam.

Realización D39. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b39) fungicidas de pirimidinamida tales como diflumetorim.

35 Realización D40. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b40) fungicidas de ácido carboxílico amida tales como dimetomorf, bentiavalicarb, bentiavalicarb-isopropil, iprovalicarb, valifenal, mandipropamid y flumorf.

40 Realización D41. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b41) fungicidas de antibióticos de tetraciclina tales como oxitetraciclina.

Realización D42. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b42) fungicidas de tiocarbamato tales como metasulfocarb.

45 Realización D43. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b43) fungicidas de benzamida tales como fluopicolida y fluopiram.

Realización D44. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b44) fungicidas de inducción de defensa de plantas huésped tales como acibenzolar-S-metilo.

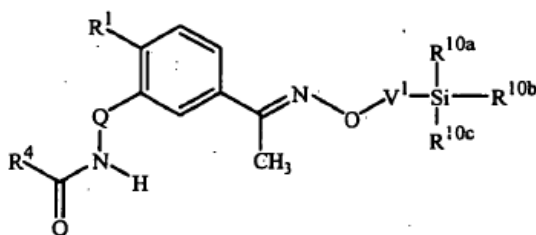
50 Realización D45. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b45) fungicidas de contacto en múltiples sitios tales como oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, hidróxido de cobre, composición de Bordeaux (sulfuro de cobre tribásico), azufre elemental, mancozeb, metiram,

propineb, ferbam, maneb, tiram, zineb, ziram, folpet, captan, captafol y clorotalonil.

Realización D46. La composición que se describe en el Compendio de la Invención (incluyendo pero sin limitarse a la composición de las Realizaciones 1 a 25 y A a A2) en la que el componente (b) incluye al menos un compuesto seleccionado de (b46) fungicidas distintos de fungicidas del componente (a) y componentes (b1) a (b45) tal como etaboxam, ciflufenamid, proquinazid, metrafenona, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, 2-butoxi-6-iodo-3-propil-4H-1-benzopiran-4-ona, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-3-isoxazolidinil]piridina, 4-fluorofenil-N-[1-[[[1-(4-cianofenil)etil]sulfonil]metil]propil]carbamato, N-[[[ciclopropilmetoxi]amino] [6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metileno]bencenoacetamida, N'-[4-[4-cloro-3-(trifluorometil)fenoxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilmetanimidamida, 2-[[2-fluoro-5-(trifluorometil)fenil]tio]-2-[3-(2-metoxifenil)-2-tiazolidinilideno]acetonitrilo y N-(4-cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metilbencenosulfonamida.

Las siguientes PRUEBAS demuestran la eficacia de control de los compuestos de la presente invención sobre patógenos específicos. La protección de control de patógenos lograda por los compuestos no se limita, sin embargo, a estas especies. Véase el índice de Tablas A-J para las descripciones de compuesto. Véase el Tabla Índice K para los datos de ¹H RMN. Se utilizan las siguientes abreviaciones en el Tabla Índices que siguen: i significa iso, c significa ciclo, n significa normal, t significa terciario, Ac es acetilo, Me es metilo, Et es etilo, Ph es fenilo, Bn es bencilo, OMe es metoxi, OEt es etoxi, SMe es metiltio y CN es ciano. Los sustituyentes en el bencilo se unen al anillo fenilo del bencilo, y los números locant para los sustituyentes son con respecto a la posición fenilo unida al componente de metileno del bencilo. La abreviación "Ej." quiere decir "Ejemplo" y está seguida por el número que indica en que ejemplo se prepara el compuesto. La abreviación MP quiere decir "punto de fusión".

TABLA ÍNDICE A

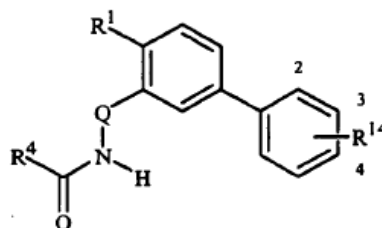


Compuesto	R ¹	R ⁴	Q	V ¹	R ^{10a}	R ^{10b}	R ^{10c}	MP
1 (Ej.1)	Cl	OMe	CH ₂	CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	**
2 (Ej.2)	Cl	OMe	CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	**
3	Cl	OMe	CH ₂	CH ₂ C(=CH ₂)CH ₂	Me	Me	Me	
4	Cl	OMe	CH ₂	CH ₂	Me	Me	CH ⁻ CH ₂	
5	Cl	OMe	CH ₂	CH ₂	Me	Me	4-Cl-Ph	*
6	Cl	OMe	CH ₂	CH ₂	Me	Me	Me	*
7	Cl	OMe	CH ₂	CH ₂	Me	Me	Et	
15	Cl	OMe	CH ₂	CH ₂	Me	Me	Ph	*
16	Cl	OMe	CH ₂	CH ₂	Me	Me	4-F-Ph	*
17	Cl	OMe	CH ₂	CH ₂	Me	Me	Bn	*

* Véase la Tabla Índice K para datos de 1H RMN.

** Véase el ejemplo de síntesis para datos de 1H RMN.

TABLA ÍNDICE DE REFERENCIA B



Compuesto	R ¹	R ⁴	Q	R14	M P
(Referencia) 8	Cl	OMe	NH	3-OCF ₃	**
(Referencia) 10	Cl	OEt	NH	4-OCF ₃	*
(Referencia) 14	Cl	OMe	CH ₂	4-SiMe ₃	*

* Véase la Tabla Índice K para datos de 1H RMN.

** Véase el ejemplo de síntesis para datos de 1H RMN.

TABLA ÍNDICE K

Compuesto No.	datos de 1H RMN (solución de CDCl ₃ a menos que se indique lo contrario) ^a
1	δ 7,66 (br s, 1H), 7,51 (m, 1H), 7,34 (d, 1H), 5,21 (br s, 1H), 4,46 (d, 2H), 4,28 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,09 (m, 2H), 0,06 (s, 9H),
2	δ 7,66 (br s, 1H); 7,52 (m, 1H), 7,35 (m, 1H), 5,18 (m, 1H), 4,46 (d, 2H), 4,14 (in, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,71 (m, 2H), 0,54 (m, 2H), 0,01 (m, 9H),
3	δ 7,66 (br s, 1H), 7,53 (m, 1H), 7,35 (d, 4H), 5,18 (br s, 1H), 4,92 (d, 1H), 4,74 (s, 1H), 4,58 (s, 2H), 4,46 (d, 2H), 3,70 (s, 3H), 2,25 (s, 3H), 1,60 (s, 2H), 0,06 (m, 9H),
4	δ 7,65 (m, 1H), 7,50 (in, 1H), 7,34 (d, 1H), 6,20 (m, 1H), 6,03 (m, 1H), 5,79 (m, 1H), 5,19 (s, 1H), 4,45 (d, 2H), 4,04 (s, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 0,20 (m, 6 H),
5	δ 7,62 (s, 1H), 7,51 (m, 2H), 7,44 (m, 1H), 7,33 (m, 3H), 5,18 (s, 1H), 4,44 (d, 2H), 4,17 (s, 2H), 3,68 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 0,38 (m, 6 H),
6	δ 7,66 (s, 1H), 7,51 (m, 1H), 7,35 (d, 1H), 5,18 (s, 1H), 4,47 (d, 2H), 3,98 (s, 2H), 3,70 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 0,13 (m, 9H),
7	δ 7,65 (s, 1H), 7,49 (in, 1H), 7,33 (d, 1H), 5,25 (s, 1H), 4,45 (d, 2H), 4,00 (s, 2H), 3,68 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 1,00 (m, 3H), 0,62 (m, 2H), 0,09 (m, 6 H)
10	δ 7,54 (d, 2H), 7,35 (d, 1H), 7,27 (d, 2H), 7,11 (d, 1H), 7,00 (dd, 1H), 6,49 (br s, 1H), 6,31 (br s, 1H), 4,22 (q, 2H), 1,28 (m, 3H),
14	δ 7,60 (m, 3H), 7,54 (d, 2H), 7,43 (m, 2H), 5,18 (br s, 1H), 4,51 (d, 2H), 3,69 (s, 3H), 0,30 (s, 9H),
15	δ 7,62 (br s, 1H), 7,59 (br m, 2H), 7,46 (br d, 1H), 7,38 (br m, 3H), 7,33 (br d, 1H), 4,45 (br d, 2H), 4,19 (s, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 0,4 (s, 6H),
16	δ 7,63 (br s, 1H), 7,56 (m, 2H), 7,46 (d, 1H), 7,33 (d, 1H), 7,07 (t, 2H), 4,45 (d, 2H), 4,16 (s, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 0,4 (s, 6H),
17	δ 7,66 (br s, 1H), 7,50 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 7,21 (t, 2H), 7,08 (t, 1H), 7,04 (d, 2H), 4,46 (m, 2H), 3,98 (s, 2H), 3,68 (s, 3H), 2,22 (s, 2H), 2,17 (s, 3H), 0,1 (s, 6H),

^a los datos ¹H RMN están en ppm campo abajo de tetrametilsilano. Los acoplamientos están diseñados por (s)-singlete, (br s)-singlete ancho, (d)-doblete, (t)-tripleto, (q)-cuadruplete, (m)-multiplete, (dd)-doblete de dobletes.

Ejemplos biológicos de la invención**Protocolo general para preparar suspensiones de prueba para las****Pruebas A-L**

- 5 Los compuestos de prueba primero se disolvieron en acetona en una cantidad igual a 3% del volumen final y después se suspendieron en la concentración deseada (en ppm) en acetona y agua purificada (50/50 mix) que contenía 250 ppm del tensioactivo Trem[®] 014 (éteres de alcohol polihídrico). Las suspensiones de prueba resultantes después se utilizaron en las Pruebas A-L. La pulverización de 200 ppm de suspensión de prueba al punto de escurrimiento en la plantas de prueba era el equivalente de una tasa de aplicación de 500 g/ha.

Prueba A

- 10 La suspensión de prueba se pulverizó al punto de escurrimiento en las plántulas de trigo. El día siguiente las plántulas se inocularon con un polvo de esporas de *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici* (el agente causal del moho polvoriento de trigo) y se incubaron en una cámara de crecimiento a 20 °C durante 8 días, después de cuyo tiempo se realizaron las clasificaciones de la enfermedad.

Prueba B

- 15 La suspensión de prueba se pulverizó al punto de escurrimiento en plántulas de trigo. El día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* (el agente causal de roya de hoja de trigo) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20 °C durante 24 horas, y después se movieron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 7 días, después de cuyo tiempo se realizaron las clasificaciones de la enfermedad.

Prueba C

- 20 La suspensión de prueba se pulverizó al punto de escurrimiento en plántulas de trigo. El día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Septoria nodorum* (el agente causal de mancha de la gluma del trigo) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20 °C durante 48 horas, y después se movieron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 7 días, después de cuyo tiempo se realizaron las clasificaciones de la enfermedad.

Prueba D

- 25 La suspensión de prueba se pulverizó al punto de escurrimiento en plántulas de trigo. El día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Septoria tritici* (el agente causal de mancha de la hoja del trigo) y se incubaron en una atmósfera saturada a 24 °C durante 48 horas, y después se movieron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 19 días, después de cuyo tiempo se realizaron las clasificaciones de la enfermedad.

Prueba E

- 30 La suspensión de prueba se pulverizó al punto de escurrimiento en plántulas de trigo. El día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Fusarium graminearum* (el agente causal de costra de la cabeza del trigo) y se incubaron en una atmósfera saturada a 24 °C durante 72 horas, y después se movieron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 5 días, después de cuyo tiempo se realizaron las clasificaciones de la enfermedad.

Prueba F

- 35 La suspensión de prueba se pulverizó al punto de escurrimiento en plántulas de tomate. El día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Botrytis cinerea* (el agente causal de Botrytis de tomate) y se incubaron en atmósfera saturada a 20 °C durante 48 horas, y después se movieron a una cámara de crecimiento a 24 °C for 3 días adicionales, después de cuyo tiempo se realizaron las clasificaciones de la enfermedad.

Prueba G

- 40 La suspensión de prueba se pulverizó al punto de escurrimiento en plántulas de pepino. El día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Colletotrichum orbiculare* (el agente causal de *Colletotrichum anthracnose* de pepino) y se incubaron en atmósfera saturada a 20 °C durante 24 horas, y se movieron a una cámara de crecimiento a 24 °C durante 5 días adicionales, después de cuyo tiempo se realizaron las clasificaciones de la enfermedad.

- 45 Prueba H

La suspensión de prueba se pulverizó al punto de escurrimiento en plántulas de tomate. El día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Alternaria solani* (el agente causal de roya temprana de tomate) y se incubaron en una atmósfera saturada a 27 °C durante 48 horas, y después se movieron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 5 días, después de cuyo tiempo se realizaron las clasificaciones de la enfermedad.

- 50 Prueba I

5 La suspensión de prueba se pulverizó al punto de escurrimiento en plántulas de césped doblado rastrero. El día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Rhizoctonia oryzae* (el agente causal de mancha marrón de turf) y se incubaron en una atmósfera saturada a 27 °C durante 48 horas, y después se movieron a una cámara de crecimiento a 27 °C durante 3 días, después de cuyo tiempo se realizaron las clasificaciones de la enfermedad.

Prueba J

10 La suspensión de prueba se pulverizó al punto de escurrimiento en plántulas de tomate. El día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Phytophthora infestans* (el agente causal de roya tardía de tomate) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20 °C durante 24 horas, y después se movieron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 4 días, después de cuyo tiempo se realizaron las clasificaciones de la enfermedad.

Prueba K

15 Las plántulas de uva se inocularon con una suspensión de esporas de *Plasmopara viticola* (el agente causal de oídio de uva) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20 °C durante 24 horas. Después de un corto período de secado, la suspensión de prueba se pulverizó al punto de escurrimiento en las plántulas de uva y después se movieron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 6 días, después de lo que las unidades de prueba se colocaron de nuevo en una atmósfera saturada a 20 °C durante 24 horas. Con la eliminación se realizaron, las clasificaciones de la enfermedad.

Prueba L

20 La suspensión de prueba se pulverizó al punto de escurrimiento en plántulas de hierba para forraje. El día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Pythium aphanidermatum* (el agente causal de roya de pythium de hierba para forraje) y se incubaron en una atmósfera saturada cubierta a 27 °C durante 48 horas, y después las cubiertas se sacaron y la plantas de dejaron a 27 °C durante 3 días adicionales, después de cuyo tiempo se realizaron las clasificaciones de la enfermedad.

25 Los resultados para las Pruebas A-L se proporcionan en la Tabla A. En la tabla, una clasificación de 100 indica 100% de control de la enfermedad, y una clasificación de 0 indica ningún control de la enfermedad (con respecto a los controles). Un guión (-) indica ningún resultado de la. Todos los resultados son para 200 ppm excepto donde están seguidos por "**", lo que indica 40 ppm o "****", lo que indica 50 ppm.

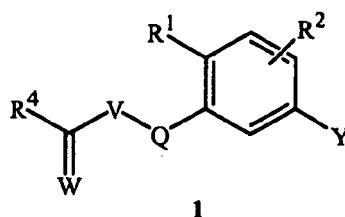
TABLA A

RESULTADOS DE PRUEBAS BIOLÓGICAS												
Control de la enfermedad porcentual												
Compuesto	Prueba	Prueba	Prueba	Prueba	Prueba	Prueba	Prueba	Prueba	Prueba	Prueba	Prueba	Prueba
No.	A	B	C	D	E	F	G	H	I	J	K	L
1	100	100	100	100*	100	0	-	0	0	0	66	0
2	100	100	99	91*	100	0	-	-	0	0	70	0
3	98	100	99	16*	87	0	-		0	0	26	0
4	98	99	99	59*	97	37		-	0	0	74	0
5	99	100	99	100*	0	0	-	77	0	0	23	0
6	99*	100*	96*	100*	68*	-	-	-	-	-	-	-
7	100*	100*	99*	100*	0*	-	-	-			-	-
Ref. 8	100	100	99	-	92	0	100	-	0	100	99	33
Ref. 10	98	79	82	-	0	0	25	-	0	0	0	0
Ref 14	96	98	93	-	0	0.	0	-	0	0	0	80
15	100*	100*	100*	100*	-	0	-	33	-	-	-	-
16	99*	100*	100*	100'	-	67	-	95*	-	-	-	-
17	67	99*	100	100*	-	0	-	38	-	-	-	-

30

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto seleccionado de Fórmula 1, N-óxidos y sales del mismo,



en la que

- 5 cada R^1 y R^2 es independientemente H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , trialquilsililo C_3-C_{15} o halotrialquilsililo C_3-C_{15} ;
- V es un enlace directo o NR^3 ;
- R^3 es H, alquilo C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_3 , alquilcarbonilo C_2-C_6 , haloalquilcarbonilo C_2-C_6 , alcoxycarbonilo C_2-C_6 o haloalcoxycarbonilo C_2-C_6 ;
- 10 R^4 es H, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , alquilamino C_1-C_6 , haloalquilamino C_1-C_6 , dialquilamino C_2-C_8 , halodialquilamino C_2-C_8 o cicloalquilamino C_3-C_6 ;
- W es O o S;
- Q es $CR^{6a}R^{6b}$, O, NR^7 , $C(=N)-O-R^7$ o $C(=O)$;
- Y es $-C(R^5)=N-O-(CR^{8a}R^{8b})_p$, $X-(CR^{9a}R^{9b})_q$, $SiR^{10a}R^{10b}R^{10c}$
- 15 R^5 es H, CN, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , trialquilsililo C_3-C_{15} o halotrialquilsililo C_3-C_{15} ;
- R^{6a} es H, OH, halógeno, CN, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxialquilo C_2-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 o alquilsulfonilo C_1-C_6 ;
- R^{6b} es H, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxialquilo C_2-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o haloalcoxi C_1-C_6 ; o
- 20 R^{6a} y R^{6b} se toman juntos con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo cicloalquilo C_3-C_6 o anillo halocicloalquilo C_3-C_6 ;
- R^7 es H, alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alquilcarbonilo C_2-C_3 o haloalquilcarbonilo C_2-C_3 ;
- cada R^{8a} y R^{8b} es independientemente H, OH, CN, halógeno, alquilo C_1-C_5 , haloalquilo C_1-C_5 o alcoxi C_1-C_5 ;
- cada R^{8b} y R^{9b} es independientemente H, CN, halógeno, alquilo C_1-C_5 , haloalquilo C_1-C_5 o alcoxi C_1-C_5 ; o
- 25 cada par de R^{8a} y R^{8b} o R^{9a} y R^{9b} unidos al mismo átomo de carbono pueden tomarse independientemente juntos con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo cicloalquilo C_3-C_6 o anillo halocicloalquilo C_3-C_6 ; o
- cada R^{8a} , R^{8b} , R^{9a} o R^{9b} pueden tomarse independientemente juntos con un R^{8a} , R^{8b} , R^{9a} o R^{9b} unido a un átomo de carbono adyacente y los átomos de carbono al que están unidos para formar un anillo cicloalquilo C_3-C_6 o halocicloalquilo C_3-C_6 ;
- 30 cada R^{10a} , R^{10b} y R^{10c} es independientemente alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alcoxialquilo C_2-C_3 , haloalcoxialquilo C_2-C_8 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alquilcicloalquilo C_4-C_7 , alquilcicloalquilalquilo C_5-C_{10} , haloalqueno C_2-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , alquilcarbonilo C_2-C_6 , alcoxycarbonilo C_2-C_6 , trialquilsililalquilo C_4-C_{12} o J;
- 35 cada J es independientemente un anillo fenilo; un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros; o un sistema anular bicíclico fusionado de 8, 9 o 10 miembros, o anillo heterocíclico o carbocíclico no aromático de 3 a 6 miembros, dicho anillo o sistema anular incluyendo opcionalmente miembros anulares seleccionados del grupo que consiste en $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^{11})$, NR^{11} , $SiR^{12a}R^{12b}$ y $S(=O)_u(=NR^{11})_z$, y cada anillo o sistema anular opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes independientemente seleccionados de R13; o
- 40 dos de R^{10a} , R^{10b} o R^{10c} se toman juntos con el átomo de silicio al que están unidos para formar un anillo saturado que contiene de 3 a 6 átomos de carbono además del átomo de silicio como miembros anulares, el anillo opcionalmente sustituido en los átomos de carbono con halógeno;

- 5 X es un enlace directo, O, NR¹¹, C(=O), C(=S) o C(=NR¹¹); o un anillo fenilo, un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un anillo heterocíclico o carbocíclico no aromático de 3 a 8 miembros, dicho anillo incluyendo opcionalmente miembros anulares seleccionados del grupo que consiste en C(=O), C(=S), C(=NR¹¹), NR¹¹, SiR^{12a}R^{12b} y S(=O)_u(=NR¹¹)_z, y opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes independientemente seleccionados de R¹³;
- cada R¹¹ es independientemente H, CN, NH₂, OH, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alquilcarbonilo C₂-C₆, haloalquilcarbonilo C₂-C₆ o alcoxi C₁-C₆;
- 10 cada R^{12a} y R^{12b} es independientemente alquilo C₁-C₅, alqueno C₂-C₅, alquino C₂-C₅, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilo C₄-C₇, alquilocicloalquilalquilo C₅-C₈, haloalquilo C₁-C₅, alcoxi C₁-C₅ o haloalcoxi C₁-C₅;
- 15 cada R¹³ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₇, haloalquilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₆, alquilcarbonilo C₂-C₆, alcoxycarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₆, trialquilsililo C₃-C₁₅ o halotrialquilsililo C₃-C₁₅;
- p y q son independientemente un número entero de 0 a 5; siempre que cuando p es 0, después X es distinto de 0 o NR¹¹; y
- u y z en cada caso de S(=O)_u(=NR¹¹)_z son independientemente 0, 1 o 2, siempre que la suma de u y z en cada caso de S(=O)_u(=NR¹¹)_z es 0, 1 o 2.
- 20 2. Un compuesto de la reivindicación 1 en la que:
- R¹ es halógeno, CN, alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₂, o haloalcoxi C₁-C₂;
- R² es H, halógeno, CN, metilo o trifluorometilo;
- V es NR³;
- R³ es H, alquilo C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₂, alquilcarbonilo C₂-C₃ o haloalquilcarbonilo C₂-C₃;
- 25 R⁴ es alcoxi C₁-C₂, haloalcoxi C₁-C₂, alquilamino C₁-C₂ o dialquilamino C₂-C₄;
- W es O;
- Q es CR^{6a}R^{6b}, C=N-O-R⁷, o NR⁷; y
- R⁵ es alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₁-C₃.
3. Un compuesto de la reivindicación 2 en la que:
- 30 R¹ es F, Cl, Br, CN, metilo o haloalquilo C₁;
- R² es H, F o Cl;
- R³ es H, alquilo C₁-C₂ o haloalquilo C₁-C₂;
- R⁴ es alcoxi C₁-C₂ o haloalcoxi C₁-C₂;
- Q es CR^{6a}R^{6b} o NR⁷;
- 35 R⁵ es alquilo C₁-C₃;
- p es 0; y
- X es enlace directo.
4. Un compuesto de la reivindicación 1 que es seleccionado del grupo que consiste en:
- N-[[2-cloro-5-[1-[[2-(trimetilsilil)etoxi]imino]etil]fenil]-metil]carbamato de metilo;
- 40 N-[[2-cloro-5-[1-[[2-(trimetilsilil)propoxi]imino]etil]fenil]-metil] carbamato de metilo;
- N-[[2-cloro-5-[1-[[2-(trimetilsilil)metoxi]imino]etil]fenil]-metil] carbamato de metilo; y
- N-[[2-cloro-5-[1-[[2-(etil dimetilsilil)metoxi]imino]etil]fenil]-metil] carbamato de metilo.

5. Una composición fungicida que comprende (a) un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4; y (b) al menos otro fungicida.

5 6. Una composición fungicida que comprende (1) una cantidad fungicidamente efectiva de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4; y (2) al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos.

7. Un procedimiento para controlar enfermedades de plantas provocadas por patógeno micóticos de plantas que comprende aplicar a la planta o parte de la misma, o a la semilla de la planta, una cantidad fungicidamente efectiva de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4.