

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 408 856**

51 Int. Cl.:

A01N 43/40 (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
C07D 213/04 (2006.01)
C07D 211/68 (2006.01)
C07D 211/06 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **22.06.2005 E 05757532 (6)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **06.03.2013 EP 1763302**

54 Título: **Compuestos químicos**

30 Prioridad:

28.06.2004 GB 0414438

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

21.06.2013

73 Titular/es:

**SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (100.0%)
SCHWARZWALDALLEE 215
4058 BASEL, CH**

72 Inventor/es:

**MAIENFISCH, PETER;
MOLLEYRES, LOUIS-P.;
CASSAYRE, JÉRÔME;
CEDERBAUM, FREDRIK;
CORSI, CAMILLA y
PITTERNA, THOMAS**

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 408 856 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

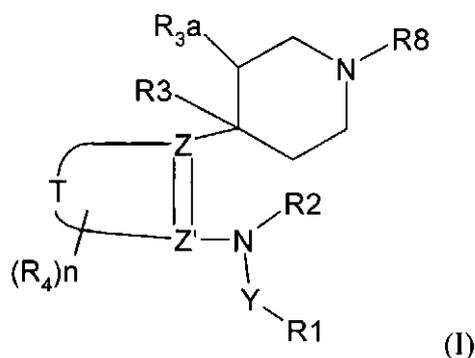
Compuestos químicos

La presente invención se refiere a derivados de piperidina, a procedimientos para prepararlos, a composiciones insecticidas y acaricidas que los comprenden, y a métodos para usarlos para combatir y controlar plagas de insectos y de ácaros.

Los derivados de piperidina con propiedades fungicidas se describen, por ejemplo, en el documento EP494717, que también describe un procedimiento para preparar los derivados de piperidina y composiciones que los contienen.

Ahora se ha encontrado sorprendentemente que ciertas piperidinas tienen propiedades insecticidas.

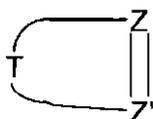
Por lo tanto, la presente invención proporciona un método para combatir y controlar insectos y ácaros, que comprende aplicar a una plaga, a un lugar de una plaga, a una planta susceptible al ataque por una plaga, una cantidad insecticida o acaricidamente eficaz de un compuesto de fórmula (I):



en la que

Y es un enlace sencillo, C=O o C=S;

el anillo



es un anillo de benceno, piridina, pirimidina, pirazina, piridazina, triazina, pirrol, imidazol, quinolina, isoquinolina, tiofeno, pirazol, oxazol, tiazol, isoxazol, isotiazol, [1,2,3]triazol, [1,2,3]oxadiazol o [1,2,3]tiadiazol;

R¹ es hidrógeno, alquilo de C₁₋₆, cianoalquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₇-alquilo de (C₁₋₄), alcoxi de C₁₋₆-alquilo de (C₁₋₆), heteroaril-alquilo de (C₁₋₆) (en el que el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfinilo, alquil C₁₋₆-tio, alcoxi de C₁₋₆-carbonilo, alquil C₁₋₆-carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), aril-alquilo de (C₁₋₆) (en el que el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfinilo, alquil C₁₋₆-tio, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, alquil C₁₋₆-carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema arílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), alquil C₁₋₆-carbonilamino-alquilo (C₁₋₆), arilo (el cual puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfinilo, alquil C₁₋₆-tio, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, alquil C₁₋₆-carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema arílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), heteroarilo (el cual puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfinilo, alquil C₁₋₆-tio, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, alquil C₁₋₆-carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, fenoxi (en el que el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroariloxi (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o

haloalcoxi de C₁₋₆), heterociclilo (opcionalmente sustituido con halo, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆), ciano, alqueno de C₂₋₆, alquino de C₂₋₆, cicloalquilo de C₃₋₆, cicloalqueno de C₅₋₇, heterociclilo (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆), alquil C₁₋₆-tio, haloalquil C₁₋₆-tio o NR¹³R¹⁴, en el que R¹³ y R¹⁴ son independientemente hidrógeno, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆-alquilo de (C₁₋₆), fenilo (el cual puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino o alcoxi de C₁₋₄-carbonilo), fenil-alquilo de (C₁₋₆) (en el que el grupo fenilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo fenílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), heteroaril-alquilo de (C₁₋₆) (en el que el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfino, alquil C₁₋₆-tio, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, alquil C₁₋₆-carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno) o heteroarilo (el cual puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₄-carbonilo, alquil C₁₋₆-carbonilamino, feniloxycarbonilamino (en el que el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), amino, alquil C₁₋₆-amino o fenilamino (en el que el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino));

R² es hidrógeno, hidroxilo, alquilo de C₁₋₆ o haloalquilo de C₁₋₆;

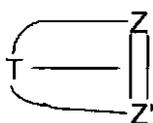
R³ es hidrógeno, hidroxilo, halógeno, alquilo de C₁₋₆ o haloalquilo de C₁₋₆;

R^{3a} es H, o R³ y R^{3a} forman juntos un enlace;

cada R⁴ es independientemente halógeno, ciano, alquilo de C₁₋₈, haloalquilo de C₁₋₈, alcoxi de C₁₋₈, haloalcoxi de C₁₋₆, cianoalquilo, alcoxi de C₁₋₆-alquilo de (C₁₋₆), cicloalquil C₃₋₇-alquilo de (C₁₋₆), cicloalqueno C₅₋₆-alquilo de (C₁₋₆), alqueno C₃₋₆-oxi-alquilo de (C₁₋₆), alquino C₃₋₆-oxi-alquilo de (C₁₋₆), ariloalquilo de (C₁₋₆), carboxialquilo de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-carbonil-alquilo de (C₁₋₆), alqueno C₂₋₆-carbonil-alquilo de (C₁₋₆), alquino C₂₋₆-carbonil-alquilo de (C₁₋₆), alcoxi C₁₋₆-carbonil-alquilo de (C₁₋₆), alqueno C₃₋₆-oxycarbonil-alquilo de (C₁₋₆), alquino C₃₋₆-oxycarbonil-alquilo de (C₁₋₆), ariloxycarbonil-alquilo de (C₁₋₆), alquil C₁₋₆-tio-alquilo de (C₁₋₆), alquil C₁₋₆-sulfino-alquilo de (C₁₋₆), alquil C₁₋₆-sulfonalquilo de (C₁₋₆), aminocarbonil-alquilo de (C₁₋₆), alquil C₁₋₆-aminocarbonil-alquilo de (C₁₋₆), dialquil (C₁₋₆)-aminocarbonil-alquilo de (C₁₋₆), fenil-alquilo de (C₁₋₄) (en el que el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroaril-alquilo de (C₁₋₄) (en el que el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆), heterociclil-alquilo de (C₁₋₄) (en el que el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆), alqueno de C₂₋₆, aminocarbonil-alqueno de (C₂₋₆), alquil C₁₋₆-aminocarbonil-alqueno de (C₂₋₆), dialquil (C₁₋₆)-aminocarbonil-alqueno de (C₂₋₆), fenil-alqueno de (C₂₋₄), (en el que el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), alquino de C₂₋₆, trimetilsilil-alquino de (C₂₋₆), aminocarbonil-alquino de (C₂₋₆), alquil C₁₋₆-aminocarbonil-alquino de (C₂₋₆), dialquil (C₁₋₆)-aminocarbonil-alquino de (C₂₋₆), alcoxi C₁₋₆-carbonilo, cicloalquilo de C₃₋₇, halocicloalquilo de C₃₋₇, cianocicloalquilo de C₃₋₇, alquil C₁₋₃-cicloalquilo de (C₃₋₇), alquil C₁₋₃-halocicloalquilo de (C₃₋₇), fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroarilo (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆), heterociclilo (en el que el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆), o 2 grupos R⁴ adyacentes, junto con el átomo de carbono al que están unidos, forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 4, 5, 6 ó 7 miembros que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi de C₁₋₈, haloalcoxi de C₁₋₆, fenoxi (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆), heteroariloxi (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆), alquil C₁₋₈-tio o R¹⁹R²⁰N, en el que R¹⁹ y R²⁰ son, independientemente, hidrógeno, alquilo de C₁₋₈, cicloalquilo de C₃₋₇, alqueno de C₃₋₆, alquino de C₃₋₆, haloalquilo de C₂₋₆, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, o R¹⁹ y R²⁰, junto con el átomo de N al que están unidos, forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados de O, N o S y que puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos grupos alquilo de C₁₋₆; n es 0, 1, 2 ó 3;

R⁸ es alquilo de C₁₋₁₀, haloalquilo de C₁₋₁₀, aril-alquilo de (C₁₋₆) (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroaril-alquilo de (C₁₋₆) (en el que el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), arilcarbonil-alquilo de (C₁₋₆) (en el que el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o

dialquilamino, y el grupo alquilo puede estar opcionalmente sustituido con arilo), alqueniilo de C₂₋₈, haloalqueniilo de C₂₋₈, aril-alqueniilo de (C₂₋₆) (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, o dos sustituyentes adyacentes se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros), heteroaril-alqueniilo de (C₂₋₆) (en el que el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, o dos sustituyentes adyacentes se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros), alquinilo de C₂₋₆, fenil-alquinilo de (C₂₋₆) (en el que el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), cicloalquilo de C₃₋₇, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, alquil C₁₋₆-carbonilo, haloalquil C₁₋₆-carbonilo o aril-alqueniil (C₂₋₆)-carbonilo (en el que el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), o -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵, en el que z es 1 ó 2, R⁵¹ y R⁵² son cada uno independientemente H, halo o alquilo de C₁₋₂, R⁵³ y R⁵⁴ son cada uno independientemente H, halógeno, alquilo de C₁₋₄ o haloalquilo de C₁₋₄, y R⁵⁵ es arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido, o sales o N-óxidos del mismo, con la condición de que el método no sea para el tratamiento del cuerpo humano o animal mediante terapia.



Los compuestos de fórmula (I) pueden existir en diferentes isómeros geométricos u ópticos o formas tautómeras. Esta invención cubre todos los citados isómeros y tautómeros y sus mezclas en todas las proporciones, así como formas isotópicas tales como compuestos deuterados.

Cada resto alquilo, ya sea solo o como parte de un grupo más grande (tal como alcoxi, alcoxicarbonilo, alquilcarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo), es una cadena lineal o ramificada, y es, por ejemplo, metilo, etilo, n-propilo, n-butilo, n-pentilo, n-hexilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, iso-butilo, terc-butilo o neo-pentilo. Los grupos alquilo son adecuadamente grupos alquilo de C₁ a C₁₂, pero son preferiblemente grupos alquilo de C₁-C₁₀, más preferiblemente de C₁-C₈, aún más preferiblemente de C₁-C₆ y lo más preferible de C₁-C₄.

Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en un resto alquilo (solo o como parte de un grupo más grande, tal como alcoxi, alcoxicarbonilo, alquilcarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo) incluyen uno o más de halógeno, nitro, ciano, NCS-, cicloalquilo de C₃₋₇ (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), cicloalqueniilo de C₅₋₁ (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), hidroxilo, alcoxi de C₁₋₁₀, alcoxi de C₁₋₁₀-alcoxi de (C₁₋₁₀), tri-alquil (C₁₋₄)-silil-alcoxi de (C₁₋₆), alcoxi de C₁₋₆-carbonil-alcoxi de (C₁₋₁₀), haloalcoxi de C₁₋₁₀, aril-alcoxi de C₁₋₄) (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido), cicloalquil C₃₋₇-oxi (en el que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), alqueniil C₂₋₁₀-oxi, alquil C₁₋₁₀-tio, haloalquil C₁₋₁₀-tio, aril-alquil (C₁₋₄)-tio (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido), cicloalquil C₃₋₇-tio (en el que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), tri-alquil (C₁₋₄)-sililalquil (C₁₋₆)-tio, ariltio (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido), alquil C₁₋₆-sulfonilo, haloalquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfonilo, haloalquil C₁₋₆-sulfonilo, arilsulfonilo (en el que el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido), tri-alquil (C₁₋₄)-sililo, arildi-alquil (C₁₋₄)-sililo, alquil (C₁₋₄)-diarilsililo, triarilsililo, alquil C₁₋₁₀-carbonilo, HO₂C, alcoxi de C₁₋₁₀-carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁₋₆-aminocarbonilo, di-(alquil C₁₋₆)-aminocarbonilo, N-(alquil C₁₋₃)-N-(alcoxi de C₁₋₃)-aminocarbonilo, alquil C₁₋₆-carboniloxi, arilcarboniloxi (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido), dialquil (C₁₋₆)-aminocarboniloxi, oximas tales como =NOalquilo, =NOhaloalquilo y =NOarilo (él mismo opcionalmente sustituido), arilo (él mismo opcionalmente sustituido), heteroarilo (él mismo opcionalmente sustituido), heterociclilo (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), ariloxi (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido), heteroariloxi, (en el que el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido), heterociclioxi (en el que el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), amino, alquil C₁₋₆-amino, dialquil (C₁₋₆)-amino, alquil C₁₋₆-carbonilamino, N-alquil (C₁₋₆)-carbonil-N-alquil (C₁₋₆)-amino, alqueniil C₂₋₆-carbonilo, alquinil C₂₋₆-carbonilo, alqueniil C₃₋₆-oxicarbonilo, alquil C₃₋₆-oxicarbonilo, ariloxicarbonilo (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido) y arilcarbonilo (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido).

Los restos alqueniilo y alquinilo pueden estar en forma de cadenas lineales o ramificadas, y los restos alqueniílicos, cuando sea apropiado, pueden tener la configuración (E) o (Z). Los ejemplos son vinilo, alilo y propargilo.

Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en alqueniilo o alquinilo incluyen aquellos sustituyentes opcionales dados anteriormente para un resto alquílico.

En el contexto de esta memoria descriptiva, acilo es alquil C₁₋₆-carbonilo opcionalmente sustituido (por ejemplo acetilo), alqueniil C₂₋₆-carbonilo opcionalmente sustituido, alquinil C₂₋₆-carbonilo opcionalmente sustituido, arilcarbonilo opcionalmente sustituido (por ejemplo benzoilo) o heteroarilcarbonilo opcionalmente sustituido.

Halógeno es flúor, cloro, bromo o yodo.

Los grupos haloalquilo son grupos alquilo que están sustituidos con one o más de los mismos átomos de halógeno o diferentes, y son, por ejemplo, CF_3 , CF_2Cl , CF_3CH_2 o CHF_2CH_2 .

5 En el contexto de la presente memoria descriptiva, las expresiones “arilo”, “anillo aromático” y “sistema anular aromático” se refieren a sistemas anulares que pueden ser mono-, bi- o tricíclicos. Ejemplos de tales anillos incluyen fenilo, naftalenilo, antraceno, indenilo o fenantrenilo. Un grupo arilo preferido es fenilo. Además, las expresiones “heteroarilo”, “anillo heteroaromático” o “sistema anular heteroaromático” se refieren a un sistema anular aromático que contiene al menos un heteroátomo y que consiste además en un único anillo o en dos o más anillos condensados. Preferiblemente, los anillos individuales contendrán tres, y los sistemas bicíclicos hasta cuatro
10 heteroátomos que se escogerán preferiblemente de nitrógeno, oxígeno y azufre. Ejemplos de tales grupos incluyen furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, bencisotiazolilo,
15 benzoxazolilo, bencisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizínilo. Ejemplos preferidos de radicales heteroaromáticos incluyen piridilo, pirimidilo, triazinilo, tienilo, furilo, oxazolilo, isoxazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol y tiazolilo.

20 Los términos heterocíclico y heterociclilo se refieren a un anillo no aromático que contiene hasta 10 átomos que incluyen uno o más (preferiblemente uno o dos) heteroátomos seleccionados de O, S y N. Ejemplos de tales anillos incluyen 1,3-dioxolano, tetrahidrofurano y morfolina.

Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en el heterociclilo incluyen alquilo de C_{1-6} y haloalquilo de C_{1-6} , así como aquellos sustituyentes opcionales dados anteriormente para un resto alquilo.

Cicloalquilo incluye ciclopropilo, ciclopentilo y ciclohexilo.

25 Cicloalquenilo incluye ciclopentenilo y ciclohexenilo.

Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en cicloalquilo o cicloalquenilo incluyen alquilo de C_{1-3} , así como aquellos sustituyentes opcionales dados anteriormente para un resto alquilo.

Los anillos carbocíclicos incluyen grupos arilo, cicloalquilo y cicloalquenilo.

30 Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en arilo o heteroarilo se seleccionan, independientemente, de halógeno, nitro, ciano, NCS-, alquilo de C_{1-6} , haloalquilo de C_{1-6} , alcoxi de C_{1-6} -alquilo de (C_{1-6}), alquenilo de C_{2-6} , haloalquenilo de C_{2-6} , alquenilo de C_{2-6} , cicloalquilo de C_{3-7} (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C_{1-6} o halógeno), cicloalquenilo de C_{5-7} (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C_{1-6} o halógeno), hidroxilo, alcoxi de C_{1-10} , alcoxi de C_{1-10} -alcoxi de (C_{1-10}), tri-alquil (C_{1-4})-silil-alcoxi de (C_{1-6}), alcoxi de C_{1-6} -carbonil-alcoxi de (C_{1-10}), haloalcoxi de C_{1-10} , aril-alcoxi de (C_{1-4}) (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo de C_{1-6}), cicloalquilo de C_{3-7} (en el que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C_{1-6} o halógeno), alquilo C_{2-10} -oxi, alquil C_{2-10} -oxi, SH, alquil C_{1-10} -tio, haloalquil C_{1-10} -tio, aril-alquil (C_{1-4})-tio, cicloalquil C_{3-7} -tio (en el que el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C_{1-6} o halógeno), tri-alquil (C_{1-4})-silil-alquil (C_{1-6})-tio, aril-tio, alquil C_{1-6} -sulfonilo, haloalquil C_{1-6} -sulfonilo, alquil C_{1-6} -sulfonilo, haloalquil C_{1-6} -sulfonilo, arilsulfonilo, tri-alquil (C_{1-4})-sililo, arildi-alquil (C_{1-4})-sililo, alquil (C_{1-4})-diarilsililo, triarilsililo, alquil C_{1-10} -carbonilo, HO_2C , alcoxi de C_{1-10} -carbonilo, aminocarbonilo, alquil C_{1-6} -aminocarbonilo, di(alquil C_{1-6})-aminocarbonilo, N-(alquil C_{1-3})-N-(alcoxi de C_{1-3})-aminocarbonilo, alquil C_{1-6} -carboniloxi, arilcarboniloxi, dialquil (C_{1-6})-amino-carboniloxi, arilo (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C_{1-6} o halógeno), heteroarilo (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C_{1-6} o halógeno), heterociclilo (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de C_{1-6} o halógeno), ariloxi (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C_{1-6} o halógeno), heteroariloxi (en el que el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C_{1-6} o halógeno), heterocicliloxi (en el que el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con alquilo de C_{1-6} o halógeno), amino, alquil C_{1-6} -amino, dialquilo (C_{1-6})-amino, alquil C_{1-6} -carbonilamino, N-alquilo (C_{1-6})-carbonil-N-alquil (C_{1-6})-amino, arilcarbonilo, (en el que el grupo arilo está él mismo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo de C_{1-6}), o dos posiciones adyacentes en el sistema arílico o heteroarílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo de C_{1-6} . Otros sustituyentes para arilo o heteroarilo incluyen aril carbonil amino (en el que el grupo arilo está sustituido con alquilo de C_{1-6} o halógeno), alquil (C_{1-6})-oxicarbonilamino, alquil (C_{1-6})-oxicarbonil-N-alquil (C_{1-6})-amino, ariloxicarbonilamino (en el que el grupo arilo está sustituido con alquilo de C_{1-6} o halógeno), ariloxicarbonil-N-alquil (C_{1-6})-amino, (en el que el grupo arilo está sustituido con alquilo de C_{1-6} o halógeno), arilsulfonilamino (en el que el grupo arilo está sustituido con alquilo de C_{1-6} o halógeno), arilsulfonil-N-alquil (C_{1-6})-amino (en el que el grupo arilo está sustituido con alquilo de C_{1-6} o halógeno), aril-N-alquil (C_{1-6})-amino (en el que el grupo arilo está sustituido con alquilo de C_{1-6} o halógeno), arilamino (en el que el grupo arilo está sustituido con alquilo de C_{1-6} o halógeno), heteroarilamino (en el que el grupo heteroarilo está sustituido con alquilo de C_{1-6} o halógeno), heterociclilamino (en el que el grupo heterociclilo está sustituido con

alquilo de C₁₋₆ o halógeno), aminocarbonilamino, alquil C₁₋₆-aminocarbonilamino, dialquil (C₁₋₆)aminocarbonilamino, arilaminocarbonilamino (en el que el grupo arilo está sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), aril-N-alquil (C₁₋₆)aminocarbonilamino (en el que el grupo arilo está sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno), alquil C₁₋₆-aminocarbonil-N-alquil (C₁₋₆)-amino, dialquil (C₁₋₆)-aminocarbonil-N-alquil (C₁₋₆)-amino, arilaminocarbonil-N-alquil (C₁₋₆)-amino en el que el grupo arilo está sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno) y aril-N-alquil (C₁₋₆)aminocarbonil-N-alquil (C₁₋₆)-amino (en el que el grupo arilo está sustituido con alquilo de C₁₋₆ o halógeno).

Para restos fenílicos sustituidos, grupos heterocíclico y heteroarilo, se prefiere que uno o más sustituyentes se seleccionen independientemente de halógeno, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆-alquilo de (C₁₋₆), alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-tio, haloalquil C₁₋₆-tio, alquil C₁₋₆-sulfínico, haloalquil C₁₋₆-sulfínico, alquil C₁₋₆-sulfonilo, haloalquil C₁₋₆-sulfonilo, alqueno de C₂₋₆, haloalqueno de C₂₋₆, alquínico de C₂₋₆, cicloalquilo de C₃₋₇, nitro, ciano, CO₂H, alquil C₁₋₆-carbonilo, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, R²⁵R²⁶N o R²⁷R²⁸NC(O); en los que R²⁵, R²⁶, R²⁷ y R²⁸ son, independientemente, hidrógeno o alquilo de C₁₋₆. Sustituyentes adicionalmente preferidos son grupos arilo y heteroarilo.

Los grupos haloalqueno son grupos alqueno que están sustituidos con uno o más átomos de los mismos átomos de halógeno o diferentes.

Se entiende que los sustituyentes dialquilamino incluyen aquellos en los que los grupos dialquilo, junto con el átomo de N al que están unidos, forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados de O, N o S y que está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos alquilo de (C₁₋₆) seleccionados independientemente. Cuando los anillos heterocíclicos se forman uniendo dos grupos en un átomo de N, los anillos resultantes son adecuadamente pirrolidina, piperidina, tiomorfolina y morfolina, cada uno de los cuales puede estar sustituido con uno o dos grupos alquilo de (C₁₋₆) seleccionados independientemente.

Preferiblemente, los sustituyentes opcionales en el resto alquilo incluyen uno o más de halógeno, nitro, ciano, HO₂C, alcoxi de C₁₋₁₀ (él mismo opcionalmente sustituido con alcoxi de C₁₋₁₀), aril-alcoxi de (C₁₋₄), alquil C₁₋₁₀-tio, alquil C₁₋₁₀-carbonilo, alcoxi C₁₋₁₀-carbonilo, alquil C₁₋₆-aminocarbonilo, di(alquil C₁₋₆)aminocarbonilo, alquil (C₁₋₆)carboniloxi, fenilo opcionalmente sustituido, heteroarilo, ariloxi, arilcarboniloxi, heteroariloxi, heterocíclico, heterocíclicoxi, cicloalquilo de C₃₋₇ (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo de (C₁₋₆) o halógeno), cicloalquil C₃₋₇-oxi, cicloalqueno de C₅₋₇, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfínico, tri-alquil (C₁₋₄)sililo, tri-alquil (C₁₋₄)-silil-alcoxi de (C₁₋₆), arildi-alquil (C₁₋₄)sililo, alquil (C₁₋₄)-diarilsililo y triarilsililo.

Preferiblemente, los sustituyentes opcionales en alqueno o alquínico incluyen uno o más de halógeno, arilo y cicloalquilo de C₃₋₇.

Un sustituyente opcional preferido para heterocíclico es alquilo de C₁₋₆.

Preferiblemente, los sustituyentes opcionales para cicloalquilo incluyen halógeno, ciano y alquilo de C₁₋₃.

Preferiblemente, los sustituyentes opcionales para cicloalqueno incluyen alquilo de C₁₋₃, halógeno y ciano.

Más abajo se exponen grupos preferidos para T, Y, R¹, R², R³, R^{3a}, R⁴ y R⁸ en cualquier combinación de los mismos.

Preferiblemente, Y es un enlace sencillo o C=O.

Lo más preferible, Y es C=O.

Preferiblemente, R¹ es alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆-alquilo (C₁₋₆), heteroaril-alquilo (C₁₋₃) (en el que el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alcoxi de C₁₋₆-carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), fenil-alquilo de (C₁₋₃) (en el que el grupo fenilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo fenílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), fenilo (el cual puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo fenílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), heteroarilo (el cual puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alqueno de C₂₋₆, heterocíclico (opcionalmente sustituido con halo, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆), alquil C₁₋₆-tio, haloalquil C₁₋₆tio o NR¹³R¹⁴, en el que R¹³ y R¹⁴ son independientemente hidrógeno, alquilo de C₁₋₆ o haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆-alquilo (C₁₋₆), alquil C₂₋₆-carbonilo, fenilcarbonilo, (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN,

- NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), fenil-alquilo de (C₁₋₃) (en el que el grupo fenilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alcoxi de C₁₋₆-carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo fenílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno) o heteroaril-alquilo de (C₁₋₃) (en el que el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfino, alquil C₁₋₆-tio, alcoxi de C₁₋₆-carbonilo, alquil C₁₋₆-carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarílico ése pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, el mismo opcionalmente sustituido con halógeno).
- Más preferiblemente R¹ es alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, heteroaril-alquilo de (C₁₋₃) (en el que el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, y en el que el grupo heteroarilo es un anillo de tiazol, piridina, pirimidina, pirazina o piridazina), heteroarilo (opcionalmente sustituido con halo, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, y en el que el grupo heteroarilo es un anillo de piridina, pirimidina, 2,1,3-benzoxadiazol, pirazina o piridazina), alcoxi de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆-alquilo (C₁₋₆), alquil C₁₋₆-amino, alquil C₁₋₆-oxi-alquil (C₁₋₆)-amino o heteroaril-alquil (C₁₋₃)-amino (en el que el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, y en el que el grupo heteroarilo es un anillo de tiazol, piridina, pirimidina, pirazina o piridazina).
- Lo más preferible, R¹ es piridilo (opcionalmente sustituido con halo, alquilo de C₁₋₃ o haloalquilo de C₁₋₃), especialmente piridilo sustituido con halo.
- Se prefiere que R² sea hidrógeno, alquilo de C₁₋₄ o haloalquilo de C₁₋₄.
- Más preferiblemente, R² es hidrógeno o alquilo de C₁₋₄.
- Aún más preferiblemente, R² es independientemente hidrógeno o metilo.
- Lo más preferible, R² es hidrógeno.
- Se prefiere que R³ sea hidrógeno, hidroxil, halógeno, alquilo de C₁₋₄ o haloalquilo de C₁₋₄.
- Más preferiblemente, R³ es hidrógeno o alquilo de C₁₋₄.
- Aún más preferiblemente, R³ es independientemente hidrógeno o metilo.
- Lo más preferible, R³ es hidrógeno.
- R^{3a} es preferiblemente hidrógeno, o R³ y R^{3a}, juntos, forman un doble enlace.
- Preferiblemente, cada R⁴ es independientemente halógeno, ciano, alquilo de C₁₋₈, haloalquilo de C₁₋₈, cianoalquilo de C₁₋₈, alcoxi de C₁₋₆-alquilo de (C₁₋₆), alquil de C₂₋₆, trimetilsilil-alquil de (C₂₋₆), alcoxi de C₁₋₆-carbonilo, cicloalquilo de C₃₋₇, alquil C₁₋₃-cicloalquilo de (C₃₋₇), fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heterociclilo (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆), alcoxi de C₁₋₈, haloalcoxi de C₁₋₆, fenoxi (opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroariloxi (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₃, haloalquilo de C₁₋₃, alcoxi de C₁₋₃ o haloalcoxi de C₁₋₃), di-alquil (C₁₋₈)-amino, o 2 grupos R⁴ adyacentes, junto con los átomos de carbono a los que están unidos, forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 4, 5, 6 ó 7 miembros que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno; n es 0, 1, 2 ó 3.
- Más preferiblemente, cada R⁴ es independientemente halógeno, ciano, alquilo de C₁₋₈, haloalquilo de C₁₋₈, cianoalquilo de C₁₋₈, alcoxi de C₁₋₆-alquilo de (C₁₋₆), alquil de C₂₋₆, heterociclilo (opcionalmente sustituido con alquilo de C₁₋₆), alcoxi de C₁₋₈, haloalcoxi de C₁₋₆, fenoxi (opcionalmente sustituido con halo, ciano, alquilo de C₁₋₃ o haloalquilo de C₁₋₃), di-alquil (C₁₋₈)-amino, o 2 grupos R⁴, junto con los átomos de carbono a los que están unidos, forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 4, 5, 6 ó 7 miembros que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno; n es 0, 1, 2 ó 3.
- Aún más preferiblemente, cada R⁴ es independientemente fluoro, cloro, bromo, ciano, alquilo de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, cianoalquilo de C₁₋₄ o alcoxi de C₁₋₃-alquilo de (C₁₋₃); n es 0, 1, 2 ó 3, preferiblemente 0, 1 ó 2.
- Lo más preferible, cada R⁴ es independientemente fluoro, cloro, bromo, alquilo de C₁₋₄ o haloalquilo de C₁₋₄; n es 1, 2 ó 3, preferiblemente 1 ó 2.
- Preferiblemente, R⁸ es fenil-alquilo de (C₁₋₄) (en el que el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroaril-alquilo de (C₁₋₆) (en el que el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con halógeno,

alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), fenil-alquenilo de (C₂₋₆) (en el que el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroaril-alquenilo de (C₂₋₆) (en el que el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino) o fenil-alquinilo de (C₂₋₆) (en el que el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino, o -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]z-R⁵⁵, en el que z es 1 ó 2, R⁵¹ y R⁵² son cada uno independientemente H, halo o alquilo de C₁₋₂, R⁵³ y R⁵⁴ son cada uno independientemente H, halógeno, alquilo de C₁₋₄ o haloalquilo de C₁₋₄, y R⁵⁵ es arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido.

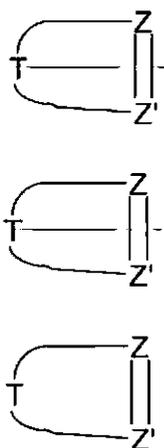
Lo más preferible, R⁸ es -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]z-R⁵⁵, en el que z es 1 ó 2, preferiblemente 1, R⁵¹ y R⁵² son cada uno independientemente H o alquilo de C₁₋₂, R⁵³ y R⁵⁴ son cada uno independientemente H, halógeno, alquilo de C₁₋₄ o haloalquilo de C₁₋₄, y R⁵⁵ es fenilo sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino, o heteroarilo sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino.

R⁵¹ y R⁵² son preferiblemente hidrógeno.

R⁵³ y R⁵⁴ son preferiblemente hidrógeno o halógeno, especialmente hidrógeno.

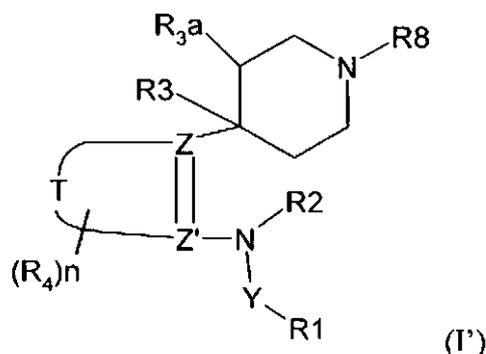
R⁵⁵ es preferiblemente fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino.

Se prefiere que estos anillos



sean un anillo de benceno, piridina, pirimidina, pirazina, tiofeno o pirazol, especialmente un anillo de benceno.

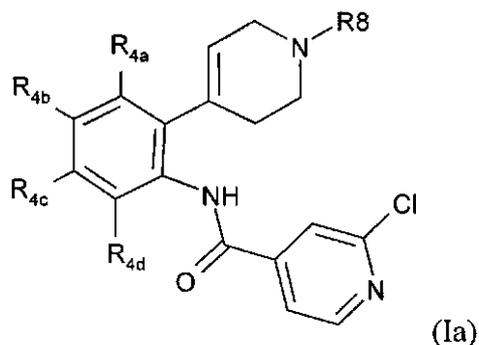
Algunos compuestos de fórmula (I) son nuevos, y como tales forman un aspecto adicional de la invención. Un grupo de los nuevos compuestos son compuestos de fórmula I'



en la que R¹, R², R³, R^{3a}, R⁴, T, Y, y n p son como se definen en relación con la fórmula I, y R⁸ es -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]z-R⁵⁵, en el que z es 1 ó 2, preferiblemente 1, R⁵¹ y R⁵² son cada uno independientemente H o alquilo de C₁₋₂, R⁵³ y R⁵⁴ son cada uno independientemente H, halógeno, alquilo de C₁₋₄ o haloalquilo de C₁₋₄, y R⁵⁵ es fenilo sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo,

heteroarilo, amino o dialquilamino, o heteroarilo sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino, o sales o N-óxidos de los mismos.

Los compuestos en las Tablas I a XCV a continuación ilustran los compuestos de la invención. La Tabla I proporciona 1127 compuestos de fórmula Ia



5

en la que los valores de R⁸, R^{4a}, R^{4b}, R^{4c} y R^{4d} se dan en la Tabla 1.

Tabla 1

Compuesto nº	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-1	4-clorobencilo	H	H	H	H
I-2	Cinamilo	H	H	H	H
I-3	4-clorocinamilo	H	H	H	H
I-4	4-fluorocinamilo	H	H	H	H
I-5	4-bromocinamilo	H	H	H	H
I-6	4-trifluorometilcinamilo	H	H	H	H
I-7	4-trifluorometoxicinamilo	H	H	H	H
I-8	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	H	H	H
I-9	4-metoxicinamilo	H	H	H	H
I-10	4-etoxicinamilo	H	H	H	H
I-11	4-cianocinamilo	H	H	H	H
I-12	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	H	H	H
I-13	3-(4-clorofenil)-but-2-enil	H	H	H	H
I-14	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	H	H	H
I-15	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	H	H	H
I-16	3,5-dicloro-cinamilo	H	H	H	H
I-17	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	H	H	H
I-18	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	H	H	H
I-19	3-naftalen-2-il-alilo	H	H	H	H
I-20	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	H	H	H
I-21	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	H	H	H
I-22	3-piridin-4-il-alilo	H	H	H	H

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-23	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	H	H	H
I-24	4-clorobencilo	H	F	H	H
I-25	Cinamilo	H	F	H	H
I-26	4-clorocinamilo	H	F	H	H
I-27	4-fluorocinamilo	H	F	H	H
I-28	4-bromocinamilo	H	F	H	H
I-29	4-trifluorometilcinamilo	H	F	H	H
I-30	4-trifluorometoxicinamilo	H	F	H	H
I-31	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	F	H	H
I-32	4-metoxicinamilo	H	F	H	H
I-33	4-etoxicinamilo	H	F	H	H
I-34	4-cianocinamilo	H	F	H	H
I-35	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	F	H	H
I-36	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	F	H	H
I-37	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	F	H	H
I-38	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	F	H	H
I-39	3,5-dicloro-cinamilo	H	F	H	H
I-40	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	F	H	H
I-41	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	F	H	H
I-42	3-naftalen-2-il-alilo	H	F	H	H
I-43	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	F	H	H
I-44	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	F	H	H
I-45	3-piridin-4-il-alilo	H	F	H	H
I-46	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	F	H	H
I-47	4-clorobencilo	H	Cl	H	H
I-48	Cinamilo	H	Cl	H	H
I-49	4-clorocinamilo	H	Cl	H	H
I-50	4-fluorocinamilo	H	Cl	H	H
I-51	4-bromocinamilo	H	Cl	H	H
I-52	4-trifluorometilcinamilo	H	Cl	H	H
I-53	4-trifluorometoxicinamilo	H	Cl	H	H
I-54	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	Cl	H	H
I-55	4-metoxicinamilo	H	Cl	H	H
I-56	4-etoxicinamilo	H	Cl	H	H

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-57	4-cianocinamilo	H	Cl	H	H
I-58	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	Cl	H	H
I-59	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	Cl	H	H
I-60	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	Cl	H	H
I-61	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	Cl	H	H
I-62	3,5-dicloro-cinamilo	H	Cl	H	H
I-63	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	Cl	H	H
I-64	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	Cl	H	H
I-65	3-naftalen-2-il-alilo	H	Cl	H	H
I-66	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	Cl	H	H
I-67	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	Cl	H	H
I-68	3-piridin-4-il-alilo	H	Cl	H	H
I-69	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	Cl	H	H
I-70	4-clorobencilo	H	H	F	H
I-71	Cinamilo	H	H	F	H
I-72	4-clorocinamilo	H	H	F	H
I-73	4-fluorocinamilo	H	H	F	H
I-74	4-bromocinamilo	H	H	F	H
I-75	4-trifluorometilcinamilo	H	H	F	H
I-76	4-trifluorometoxicinamilo	H	H	F	H
I-77	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	H	F	H
I-78	4-metoxicinamilo	H	H	F	H
I-79	4-etoxicinamilo	H	H	F	H
I-80	4-cianocinamilo	H	H	F	H
I-81	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	H	F	H
I-82	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	H	F	H
I-83	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	H	F	H
I-84	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	H	F	H
I-85	3,5-dicloro-cinamilo	H	H	F	H
I-86	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	H	F	H
I-87	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	H	F	H
I-88	3-naftalen-2-il-alilo	H	H	F	H
I-89	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	H	F	H
I-90	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	H	F	H

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-91	3-piridin-4-il-alilo	H	H	F	H
I-92	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	H	F	H
I-93	4-clorobencilo	H	H	Cl	H
I-94	Cinamilo	H	H	Cl	H
I-95	4-clorocinamilo	H	H	Cl	H
I-96	4-fluorocinamilo	H	H	Cl	H
I-97	4-bromocinamilo	H	H	Cl	H
I-98	4-trifluorometilcinamilo	H	H	Cl	H
I-99	4-trifluorometoxicinamilo	H	H	Cl	H
I-100	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	H	Cl	H
I-101	4-metoxicinamilo	H	H	Cl	H
I-102	4-etoxicinamilo	H	H	Cl	H
I-103	4-cianocinamilo	H	H	Cl	H
I-104	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	H	Cl	H
I-105	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	H	Cl	H
I-106	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	H	Cl	H
I-107	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	H	Cl	H
I-108	3,5-dicloro-cinamilo	H	H	Cl	H
I-109	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	H	Cl	H
I-110	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	H	Cl	H
I-111	3-naftalen-2-il-alilo	H	H	Cl	H
I-112	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	H	Cl	H
I-113	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	H	Cl	H
I-114	3-piridin-4-il-alilo	H	H	Cl	H
I-115	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	H	Cl	H
I-116	4-clorobencilo	Cl	Cl	H	H
I-117	Cinamilo	Cl	Cl	H	H
I-118	4-clorocinamilo	Cl	Cl	H	H
I-119	4-fluorocinamilo	Cl	Cl	H	H
I-120	4-bromocinamilo	Cl	Cl	H	H
I-121	4-trifluorometilcinamilo	Cl	Cl	H	H
I-122	4-trifluorometoxicinamilo	Cl	Cl	H	H
I-123	4-pentafluoroetoxicinamilo	Cl	Cl	H	H
I-124	4-metoxicinamilo	Cl	Cl	H	H

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-125	4-etoxicinamilo	Cl	Cl	H	H
I-126	4-cianocinamilo	Cl	Cl	H	H
I-127	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	Cl	Cl	H	H
I-128	3-(4-clorofenil)-but-2-enil	Cl	Cl	H	H
I-129	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	Cl	Cl	H	H
I-130	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	Cl	Cl	H	H
I-131	3,5-dicloro-cinamilo	Cl	Cl	H	H
I-132	5-fenil-penta-2,4-dienilo	Cl	Cl	H	H
I-133	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	Cl	Cl	H	H
I-134	3-naftalen-2-il-alilo	Cl	Cl	H	H
I-135	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	Cl	Cl	H	H
I-136	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	Cl	Cl	H	H
I-137	3-piridin-4-il-alilo	Cl	Cl	H	H
I-138	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	Cl	Cl	H	H
I-139	4-clorobencilo	F	F	H	H
I-140	Cinamilo	F	F	H	H
I-141	4-clorocinamilo	F	F	H	H
I-142	4-fluorocinamilo	F	F	H	H
I-143	4-bromocinamilo	F	F	H	H
I-144	4-trifluorometilcinamilo	F	F	H	H
I-145	4-trifluorometoxicinamilo	F	F	H	H
I-146	4-pentafluoroetoxicinamilo	F	F	H	H
I-147	4-metoxicinamilo	F	F	H	H
I-148	4-etoxicinamilo	F	F	H	H
I-149	4-cianocinamilo	F	F	H	H
I-150	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	F	F	H	H
I-151	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	F	F	H	H
I-152	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	F	F	H	H
I-153	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	F	F	H	H
I-154	3,5-dicloro-cinamilo	F	F	H	H
I-155	5-fenil-penta-2,4-dienilo	F	F	H	H
I-156	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	F	F	H	H
I-157	3-naftalen-2-il-alilo	F	F	H	H
I-158	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	F	F	H	H

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-159	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	F	F	H	H
I-160	3-piridin-4-il-alilo	F	F	H	H
I-161	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	F	F	H	H
I-162	4-clorobencilo	F	H	F	H
I-163	Cinamilo	F	H	F	H
I-164	4-clorocinamilo	F	H	F	H
I-165	4-fluorocinamilo	F	H	F	H
I-166	4-bromocinamilo	F	H	F	H
I-167	4-trifluorometilcinamilo	F	H	F	H
I-168	4-trifluorometoxicinamilo	F	H	F	H
I-169	4-pentafluoroetoxicinamilo	F	H	F	H
I-170	4-metoxicinamilo	F	H	F	H
I-171	4-etoxicinamilo	F	H	F	H
I-172	4-cianocinamilo	F	H	F	H
I-173	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	F	H	F	H
I-174	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	F	H	F	H
I-175	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	F	H	F	H
I-176	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	F	H	F	H
I-177	3,5-dicloro-cinamilo	F	H	F	H
I-178	5-fenil-penta-2,4-dienilo	F	H	F	H
I-179	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	F	H	F	H
I-180	3-naftalen-2-il-alilo	F	H	F	H
I-181	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	F	H	F	H
I-182	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	F	H	F	H
I-183	3-piridin-4-il-alilo	F	H	F	H
I-184	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	F	H	F	H
I-185	4-clorobencilo	F	H	H	F
I-186	Cinamilo	F	H	H	F
I-187	4-clorocinamilo	F	H	H	F
I-188	4-fluorocinamilo	F	H	H	F
I-189	4-bromocinamilo	F	H	H	F
I-190	4-trifluorometilcinamilo	F	H	H	F
I-191	4-trifluorometoxicinamilo	F	H	H	F
I-192	4-pentafluoroetoxicinamilo	F	H	H	F

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-193	4-metoxicinamilo	F	H	H	F
I-194	4-etoxicinamilo	F	H	H	F
I-195	4-cianocinamilo	F	H	H	F
I-196	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	F	H	H	F
I-197	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	F	H	H	F
I-198	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	F	H	H	F
I-199	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	F	H	H	F
I-200	3,5-dicloro-cinamilo	F	H	H	F
I-201	5-fenil-penta-2,4-dienilo	F	H	H	F
I-202	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	F	H	H	F
I-203	3-naftalen-2-il-alilo	F	H	H	F
I-204	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	F	H	H	F
I-205	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	F	H	H	F
I-206	3-piridin-4-il-alilo	F	H	H	F
I-207	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	F	H	H	F
I-208	4-clorobencilo	Cl	H	Cl	H
I-209	Cinamilo	Cl	H	Cl	H
I-210	4-clorocinamilo	Cl	H	Cl	H
I-211	4-fluorocinamilo	Cl	H	Cl	H
I-212	4-bromocinamilo	Cl	H	Cl	H
I-213	4-trifluorometilcinamilo	Cl	H	Cl	H
I-214	4-trifluorometoxicinamilo	Cl	H	Cl	H
I-215	4-pentafluoroetoxicinamilo	Cl	H	Cl	H
I-216	4-metoxicinamilo	Cl	H	Cl	H
I-217	4-etoxicinamilo	Cl	H	Cl	H
I-218	4-cianocinamilo	Cl	H	Cl	H
I-219	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	Cl	H	Cl	H
I-220	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	Cl	H	Cl	H
I-221	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	Cl	H	Cl	H
I-222	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	Cl	H	Cl	H
I-223	3,5-dicloro-cinamilo	Cl	H	Cl	H
I-224	5-fenil-penta-2,4-dienilo	Cl	H	Cl	H
I-225	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	Cl	H	Cl	H
I-226	3-naftalen-2-il-alilo	Cl	H	Cl	H

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-227	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	Cl	H	Cl	H
I-228	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	Cl	H	Cl	H
I-229	3-piridin-4-il-alilo	Cl	H	Cl	H
I-230	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	Cl	H	Cl	H
I-231	4-clorobencilo	Cl	H	H	Cl
I-232	Cinamilo	Cl	H	H	Cl
I-233	4-clorocinamilo	Cl	H	H	Cl
I-234	4-fluorocinamilo	Cl	H	H	Cl
I-235	4-bromocinamilo	Cl	H	H	Cl
I-236	4-trifluorometilcinamilo	Cl	H	H	Cl
I-237	4-trifluorometoxicinamilo	Cl	H	H	Cl
I-238	4-pentafluoroetoxicinamilo	Cl	H	H	Cl
I-239	4-metoxicinamilo	Cl	H	H	Cl
I-240	4-etoxicinamilo	Cl	H	H	Cl
I-241	4-cianocinamilo	Cl	H	H	Cl
I-242	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	Cl	H	H	Cl
I-243	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	Cl	H	H	Cl
I-244	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	Cl	H	H	Cl
I-245	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	Cl	H	H	Cl
I-246	3,5-dicloro-cinamilo	Cl	H	H	Cl
I-247	5-fenil-penta-2,4-dienilo	Cl	H	H	Cl
I-248	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	Cl	H	H	Cl
I-249	3-naftalen-2-il-alilo	Cl	H	H	Cl
I-250	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	Cl	H	H	Cl
I-251	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	Cl	H	H	Cl
I-252	3-piridin-4-il-alilo	Cl	H	H	Cl
I-253	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	Cl	H	H	Cl
I-254	4-clorobencilo	F	Cl	H	H
I-255	Cinamilo	F	Cl	H	H
I-256	4-clorocinamilo	F	Cl	H	H
I-257	4-fluorocinamilo	F	Cl	H	H
I-258	4-bromocinamilo	F	Cl	H	H
I-259	4-trifluorometilcinamilo	F	Cl	H	H
I-260	4-trifluorometoxicinamilo	F	Cl	H	H

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-261	4-pentafluoroetoxicinamilo	F	Cl	H	H
I-262	4-metoxicinamilo	F	Cl	H	H
I-263	4-etoxicinamilo	F	Cl	H	H
I-264	4-cianocinamilo	F	Cl	H	H
I-265	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	F	Cl	H	H
I-266	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	F	Cl	H	H
I-267	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	F	Cl	H	H
I-268	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	F	Cl	H	H
I-269	3,5-dicloro-cinamilo	F	Cl	H	H
I-270	5-fenil-penta-2,4-dienilo	F	Cl	H	H
I-271	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	F	Cl	H	H
I-272	3-naftalen-2-il-alilo	F	Cl	H	H
I-273	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	F	Cl	H	H
I-274	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	F	Cl	H	H
I-275	3-piridin-4-il-alilo	F	Cl	H	H
I-276	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	F	Cl	H	H
I-277	4-clorobencilo	F	H	Cl	H
I-278	Cinamilo	F	H	Cl	H
I-279	4-clorocinamilo	F	H	Cl	H
I-280	4-fluorocinamilo	F	H	Cl	H
I-281	4-bromocinamilo	F	H	Cl	H
I-282	4-trifluorometilcinamilo	F	H	Cl	H
I-283	4-trifluorometoxicinamilo	F	H	Cl	H
I-284	4-pentafluoroetoxicinamilo	F	H	Cl	H
I-285	4-metoxicinamilo	F	H	Cl	H
I-286	4-etoxicinamilo	F	H	Cl	H
I-287	4-cianocinamilo	F	H	Cl	H
I-288	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	F	H	Cl	H
I-289	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	F	H	Cl	H
I-290	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	F	H	Cl	H
I-291	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	F	H	Cl	H
I-292	3,5-dicloro-cinamilo	F	H	Cl	H
I-293	5-fenil-penta-2,4-dienilo	F	H	Cl	H
I-294	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	F	H	Cl	H

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-295	3-naftalen-2-il-alilo	F	H	Cl	H
I-296	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	F	H	Cl	H
I-297	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	F	H	Cl	H
I-298	3-piridin-4-il-alilo	F	H	Cl	H
I-299	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	F	H	Cl	H
I-300	4-clorobencilo	F	H	H	Cl
I-301	Cinamilo	F	H	H	Cl
I-302	4-clorocinamilo	F	H	H	Cl
I-303	4-fluorocinamilo	F	H	H	Cl
I-304	4-bromocinamilo	F	H	H	Cl
I-305	4-trifluorometilcinamilo	F	H	H	Cl
I-306	4-trifluorometoxicinamilo	F	H	H	Cl
I-307	4-pentafluoroetoxicinamilo	F	H	H	Cl
I-308	4-metoxicinamilo	F	H	H	Cl
I-309	4-etoxicinamilo	F	H	H	Cl
I-310	4-cianocinamilo	F	H	H	Cl
I-311	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	F	H	H	Cl
I-312	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	F	H	H	Cl
I-313	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	F	H	H	Cl
I-314	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	F	H	H	Cl
I-315	3,5-dicloro-cinamilo	F	H	H	Cl
I-316	5-fenil-penta-2,4-dienilo	F	H	H	Cl
I-317	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	F	H	H	Cl
I-318	3-naftalen-2-il-alilo	F	H	H	Cl
I-319	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	F	H	H	Cl
I-320	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	F	H	H	Cl
I-321	3-piridin-4-il-alilo	F	H	H	Cl
I-322	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	F	H	H	Cl
I-323	4-clorobencilo	Cl	F	H	H
I-324	Cinamilo	Cl	F	H	H
I-325	4-clorocinamilo	Cl	F	H	H
I-326	4-fluorocinamilo	Cl	F	H	H
I-327	4-bromocinamilo	Cl	F	H	H
I-328	4-trifluorometilcinamilo	Cl	F	H	H

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-329	4-trifluorometoxicinamilo	Cl	F	H	H
I-330	4-pentafluoroetoxicinamilo	Cl	F	H	H
I-331	4-metoxicinamilo	Cl	F	H	H
I-332	4-etoxicinamilo	Cl	F	H	H
I-333	4-cianocinamilo	Cl	F	H	H
I-334	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	Cl	F	H	H
I-335	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	Cl	F	H	H
I-336	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	Cl	F	H	H
I-337	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	Cl	F	H	H
I-338	3,5-dicloro-cinamilo	Cl	F	H	H
I-339	5-fenil-penta-2,4-dienilo	Cl	F	H	H
I-340	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	Cl	F	H	H
I-341	3-naftalen-2-il-alilo	Cl	F	H	H
I-342	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	Cl	F	H	H
I-343	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	Cl	F	H	H
I-344	3-piridin-4-il-alilo	Cl	F	H	H
I-345	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	Cl	F	H	H
I-346	4-clorobencilo	H	F	Cl	H
I-347	Cinamilo	H	F	Cl	H
I-348	4-clorocinamilo	H	F	Cl	H
I-349	4-fluorocinamilo	H	F	Cl	H
I-350	4-bromocinamilo	H	F	Cl	H
I-351	4-trifluorometilcinamilo	H	F	Cl	H
I-352	4-trifluorometoxicinamilo	H	F	Cl	H
I-353	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	F	Cl	H
I-354	4-metoxicinamilo	H	F	Cl	H
I-355	4-etoxicinamilo	H	F	Cl	H
I-356	4-cianocinamilo	H	F	Cl	H
I-357	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	F	Cl	H
I-358	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	F	Cl	H
I-359	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	F	Cl	H
I-360	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	F	Cl	H
I-361	3,5-dicloro-cinamilo	H	F	Cl	H
I-362	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	F	Cl	H

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-363	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	F	Cl	H
I-364	3-naftalen-2-il-alilo	H	F	Cl	H
I-365	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	F	Cl	H
I-366	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	F	Cl	H
I-367	3-piridin-4-il-alilo	H	F	Cl	H
I-368	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	F	Cl	H
I-369	4-clorobencilo	H	F	H	Cl
I-370	Cinamilo	H	F	H	Cl
I-371	4-clorocinamilo	H	F	H	Cl
I-372	4-fluorocinamilo	H	F	H	Cl
I-373	4-bromocinamilo	H	F	H	Cl
I-374	4-trifluorometilcinamilo	H	F	H	Cl
I-375	4-trifluorometoxicinamilo	H	F	H	Cl
I-376	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	F	H	Cl
I-377	4-metoxicinamilo	H	F	H	Cl
I-378	4-etoxicinamilo	H	F	H	Cl
I-379	4-cianocinamilo	H	F	H	Cl
I-380	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	F	H	Cl
I-381	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	F	H	Cl
I-382	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	F	H	Cl
I-383	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	F	H	Cl
I-384	3,5-dicloro-cinamilo	H	F	H	Cl
I-385	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	F	H	Cl
I-386	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	F	H	Cl
I-387	3-naftalen-2-il-alilo	H	F	H	Cl
I-388	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	F	H	Cl
I-389	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	F	H	Cl.
I-390	3-piridin-4-il-alilo	H	F	H	Cl
I-391	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	F	H	Cl
I-392	4-clorobencilo	Cl	H	F	H
I-393	Cinamilo	Cl	H	F	H
I-394	4-clorocinamilo	Cl	H	F	H
I-395	4-fluorocinamilo	Cl	H	F	H
I-396	4-bromocinamilo	Cl	H	F	H

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-397	4-trifluorometilcinamilo	Cl	H	F	H
I-398	4-trifluorometoxicinamilo	Cl	H	F	H
I-399	4-pentafluoroetoxicinamilo	Cl	H	F	H
I-400	4-metoxicinamilo	Cl	H	F	H
I-401	4-etoxicinamilo	Cl	H	F	H
I-402	4-cianocinamilo	Cl	H	F	H
I-403	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	Cl	H	F	H
I-404	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	Cl	H	F	H
I-405	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	Cl	H	F	H
I-406	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	Cl	H	F	H
I-407	3,5-dicloro-cinamilo	Cl	H	F	H
I-408	5-fenil-penta-2,4-dienilo	Cl	H	F	H
I-409	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	Cl	H	F	H
I-410	3-naftalen-2-il-alilo	Cl	H	F	H
I-411	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	Cl	H	F	H
I-412	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	Cl	H	F	H
I-413	3-piridin-4-il-alilo	Cl	H	F	H
I-414	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	Cl	H	F	H
I-415	4-clorobencilo	H	Cl	F	H
I-416	Cinamilo	H	Cl	F	H
I-417	4-clorocinamilo	H	Cl	F	H
I-418	4-fluorocinamilo	H	Cl	F	H
I-419	4-bromocinamilo	H	Cl	F	H
I-420	4-trifluorometilcinamilo	H	Cl	F	H
I-421	4-trifluorometoxicinamilo	H	Cl	F	H
I-422	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	Cl	F	H
I-423	4-metoxicinamilo	H	Cl	F	H
I-424	4-etoxicinamilo	H	Cl	F	H
I-425	4-cianocinamilo	H	Cl	F	H
I-426	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	Cl	F	H
I-427	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	Cl	F	H
I-428	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	Cl	F	H
I-429	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	Cl	F	H
I-430	3,5-dicloro-cinamilo	H	Cl	F	H

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-431	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	Cl	F	H
I-432	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	Cl	F	H
I-433	3-naftalen-2-il-alilo	H	Cl	F	H
I-434	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	Cl	F	H
I-435	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	Cl	F	H
I-436	3-piridin-4-il-alilo	H	Cl	F	H
I-437	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	Cl	F	H
I-438	4-clorobencilo	H	H	F	Cl
I-439	Cinamilo	H	H	F	Cl
I-440	4-clorocinamilo	H	H	F	Cl
I-441	4-fluorocinamilo	H	H	F	Cl
I-442	4-bromocinamilo	H	H	F	Cl
I-443	4-trifluorometilcinamilo	H	H	F	Cl
I-444	4-trifluorometoxicinamilo	H	H	F	Cl
I-445	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	H	F	Cl
I-446	4-metoxicinamilo	H	H	F	Cl
I-447	4-etoxicinamilo	H	H	F	Cl
I-448	4-cianocinamilo	H	H	F	Cl
I-449	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	H	F	Cl
I-450	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	H	F	Cl
I-451	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	H	F	Cl
I-452	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	H	F	Cl
I-453	3,5-dicloro-cinamilo	H	H	F	Cl
I-454	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	H	F	Cl
I-455	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	H	F	Cl
I-456	3-naftalen-2-il-alilo	H	H	F	Cl
I-457	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	H	F	Cl
I-458	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	H	F	Cl
I-459	3-piridin-4-il-alilo	H	H	F	Cl
I-460	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	H	F	Cl
I-461	4-clorobencilo	Cl	H	H	F
I-462	Cinamilo	Cl	H	H	F
I-463	4-clorocinamilo	Cl	H	H	F
I-464	4-fluorocinamilo	Cl	H	H	F

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-465	4-bromocinamilo	Cl	H	H	F
I-466	4-trifluorometilcinamilo	Cl	H	H	F
I-467	4-trifluorometoxicinamilo	Cl	H	H	F
I-468	4-pentafluoroetoxicinamilo	Cl	H	H	F
I-469	4-metoxicinamilo	Cl	H	H	F
I-470	4-etoxicinamilo	Cl	H	H	F
I-471	4-cianocinamilo	Cl	H	H	F
I-472	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	Cl	H	H	F
I-473	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	Cl	H	H	F
I-474	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	Cl	H	H	F
I-475	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	Cl	H	H	F
I-476	3,5-dicloro-cinamilo	Cl	H	H	F
I-477	5-fenil-penta-2,4-dienilo	Cl	H	H	F
I-478	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	Cl	H	H	F
I-479	3-naftalen-2-il-alilo	Cl	H	H	F
I-480	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	Cl	H	H	F
I-481	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	Cl	H	H	F
I-482	3-piridin-4-il-alilo	Cl	H	H	F
I-483	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	Cl	H	H	F
I-484	4-clorobencilo	H	Cl	H	F
I-485	Cinamilo	H	Cl	H	F
I-486	4-clorocinamilo	H	Cl	H	F
I-487	4-fluorocinamilo	H	Cl	H	F
I-488	4-bromocinamilo	H	Cl	H	F
I-489	4-trifluorometilcinamilo	H	Cl	H	F
I-490	4-trifluorometoxicinamilo	H	Cl	H	F
I-491	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	Cl	H	F
I-492	4-metoxicinamilo	H	Cl	H	F
I-493	4-etoxicinamilo	H	Cl	H	F
I-494	4-cianocinamilo	H	Cl	H	F
I-495	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	Cl	H	F
I-496	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	Cl	H	F
I-497	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	Cl	H	F
I-498	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	Cl	H	F

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-499	3,5-dicloro-cinamilo	H	Cl	H	F
I-500	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	Cl	H	F
I-501	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	Cl	H	F
I-502	3-naftalen-2-il-alilo	H	Cl	H	F
I-503	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	Cl	H	F
I-504	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	Cl	H	F
I-505	3-piridin-4-il-alilo	H	Cl	H	F
I-506	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	Cl	H	F
I-507	4-clorobencilo	H	H	Cl	F
I-508	Cinamilo	H	H	Cl	F
I-509	4-clorocinamilo	H	H	Cl	F
I-510	4-fluorocinamilo	H	H	Cl	F
I-511	4-bromocinamilo	H	H	Cl	F
I-512	4-trifluorometilcinamilo	H	H	Cl	F
I-513	4-trifluorometoxicinamilo	H	H	Cl	F
I-514	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	H	Cl	F
I-515	4-metoxicinamilo	H	H	Cl	F
I-516	4-etoxicinamilo	H	H	Cl	F
I-517	4-cianocinamilo	H	H	Cl	F
I-518	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	H	Cl	F
I-519	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	H	Cl	F
I-520	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	H	Cl	F
I-521	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	H	Cl	F
I-522	3,5-dicloro-cinamilo	H	H	Cl	F
I-523	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	H	Cl	F
I-524	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	H	Cl	F
I-525	3-naftalen-2-il-alilo	H	H	Cl	F
I-526	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	H	Cl	F
I-527	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	H	Cl	F
I-528	3-piridin-4-il-alilo	H	H	Cl	F
I-529	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	H	Cl	F
I-530	4-clorobencilo	H	F	F	F
I-531	Cinamilo	H	F	F	F
I-532	4-clorocinamilo	H	F	F	F

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-533	4-fluorocinamilo	H	F	F	F
I-534	4-bromocinamilo	H	F	F	F
I-535	4-trifluorometilcinamilo	H	F	F	F
I-536	4-trifluorometoxicinamilo	H	F	F	F
I-537	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	F	F	F
I-538	4-metoxicinamilo	H	F	F	F
I-539	4-etoxicinamilo	H	F	F	F
I-540	4-cianocinamilo	H	F	F	F
I-541	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	F	F	F
I-542	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	F	F	F
I-543	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	F	F	F
I-544	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	F	F	F
I-545	3,5-dicloro-cinamilo	H	F	F	F
I-546	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	F	F	F
I-547	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	F	F	F
I-548	3-naftalen-2-il-alilo	H	F	F	F
I-549	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	F	F	F
I-550	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	F	F	F
I-551	3-piridin-4-il-alilo	H	F	F	F
I-552	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	F	F	F
I-553	4-clorobencilo	F	H	F	F
I-554	Cinamilo	F	H	F	F
I-555	4-clorocinamilo	F	H	F	F
I-556	4-fluorocinamilo	F	H	F	F
I-557	4-bromocinamilo	F	H	F	F
I-558	4-trifluorometilcinamilo	F	H	F	F
I-559	4-trifluorometoxicinamilo	F	H	F	F
I-560	4-pentafluoroetoxicinamilo	F	H	F	F
I-561	4-metoxicinamilo	F	H	F	F
I-562	4-etoxicinamilo	F	H	F	F
I-563	4-cianocinamilo	F	H	F	F
I-564	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	F	H	F	F
I-565	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	F	H	F	F
I-566	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	F	H	F	F

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-567	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	F	H	F	F
I-568	3,5-dicloro-cinamilo	F	H	F	F
I-569	5-fenil-penta-2,4-dienilo	F	H	F	F
I-570	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	F	H	F	F
I-571	3-naftalen-2-il-alilo	F	H	F	F
I-572	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	F	H	F	F
I-573	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	F	H	F	F
I-574	3-piridin-4-il-alilo	F	H	F	F
I-575	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	F	H	F	F
I-576	4-clorobencilo	F	F	H	F
I-577	Cinamilo	F	F	H	F
I-578	4-clorocinamilo	F	F	H	F
I-579	4-fluorocinamilo	F	F	H	F
I-580	4-bromocinamilo	F	F	H	F
I-581	4-trifluorometilcinamilo	F	F	H	F
I-582	4-trifluorometoxicinamilo	F	F	H	F
I-583	4-pentafluoroetoxicinamilo	F	F	H	F
I-584	4-metoxicinamilo	F	F	H	F
I-585	4-etoxicinamilo	F	F	H	F
I-586	4-cianocinamilo	F	F	H	F
I-587	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	F	F	H	F
I-588	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	F	F	H	F
I-589	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	F	F	H	F
I-590	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	F	F	H	F
I-591	3,5-dicloro-cinamilo	F	F	H	F
I-592	5-fenil-penta-2,4-dienilo	F	F	H	F
I-593	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	F	F	H	F
I-594	3-naftalen-2-il-alilo	F	F	H	F
I-595	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	F	F	H	F
I-596	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	F	F	H	F
I-597	3-piridin-4-il-alilo	F	F	H	F
I-598	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	F	F	H	F
I-599	4-clorobencilo	F	F	F	H
I-600	Cinamilo	F	F	F	H

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-601	4-clorocinamilo	F	F	F	H
I-602	4-fluorocinamilo	F	F	F	H
I-603	4-bromocinamilo	F	F	F	H
I-604	4-trifluorometilcinamilo	F	F	F	H
I-605	4-trifluorometoxicinamilo	F	F	F	H
I-606	4-pentafluoroetoxicinamilo	F	F	F	H
I-607	4-metoxicinamilo	F	F	F	H
I-608	4-etoxicinamilo	F	F	F	H
I-609	4-cianocinamilo	F	F	F	H
I-610	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	F	F	F	H
I-611	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	F	F	F	H
I-612	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	F	F	F	H
I-613	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	F	F	F	H
I-614	3,5-dicloro-cinamilo	F	F	F	H
I-615	5-fenil-penta-2,4-dienilo	F	F	F	H
I-616	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	F	F	F	H
I-617	3-naftalen-2-il-alilo	F	F	F	H
I-618	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	F	F	F	H
I-619	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	F	F	F	H
I-620	3-piridin-4-il-alilo	F	F	F	H
I-621	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	F	F	F	H
I-622	4-clorobencilo	H	Cl	Cl	Cl
I-623	Cinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-624	4-clorocinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-625	4-fluorocinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-626	4-bromocinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-627	4-trifluorometilcinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-628	4-trifluorometoxicinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-629	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-630	4-metoxicinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-631	4-etoxicinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-632	4-cianocinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-633	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	Cl	Cl	Cl
I-634	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	Cl	Cl	Cl

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-635	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	Cl	Cl	Cl
I-636	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-637	3,5-dicloro-cinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-638	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	Cl	Cl	Cl
I-639	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-640	3-naftalen-2-il-alilo	H	Cl	Cl	Cl
I-641	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	Cl	Cl	Cl
I-642	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	Cl	Cl	Cl
I-643	3-piridin-4-il-alilo	H	Cl	Cl	Cl
I-644	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	Cl	Cl	Cl
I-645	4-clorobencilo	Cl	H	Cl	Cl
I-646	Cinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-647	4-clorocinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-648	4-fluorocinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-649	4-bromocinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-650	4-trifluorometilcinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-651	4-trifluorometoxicinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-652	4-pentafluoroetoxicinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-653	4-metoxicinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-654	4-etoxicinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-655	4-cianocinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-656	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	Cl	H	Cl	Cl
I-657	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	Cl	H	Cl	Cl
I-658	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	Cl	H	Cl	Cl
I-659	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-660	3,5-dicloro-cinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-661	5-fenil-penta-2,4-dienilo	Cl	H	Cl	Cl
I-662	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-663	3-naftalen-2-il-alilo	Cl	H	Cl	Cl
I-664	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	Cl	H	Cl	Cl
I-665	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	Cl	H	Cl	Cl
I-666	3-piridin-4-il-alilo	Cl	H	Cl	Cl
I-667	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	Cl	H	Cl	Cl
I-668	4-clorobencilo	Cl	Cl	H	Cl

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-669	Cinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-670	4-clorocinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-671	4-fluorocinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-672	4-bromocinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-673	4-trifluorometilcinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-674	4-trifluorometoxicinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-675	4-pentafluoroetoxicinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-676	4-metoxicinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-677	4-etoxicinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-678	4-cianocinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-679	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	Cl	Cl	H	Cl
I-680	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	Cl	Cl	H	Cl
I-681	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	Cl	Cl	H	Cl
I-682	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-683	3,5-dicloro-cinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-684	5-fenil-penta-2,4-dienilo	Cl	Cl	H	Cl
I-685	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-686	3-naftalen-2-il-alilo	Cl	Cl	H	Cl
I-687	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	Cl	Cl	H	Cl
I-688	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	Cl	Cl	H	Cl
I-689	3-piridin-4-il-alilo	Cl	Cl	H	Cl
I-690	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	Cl	Cl	H	Cl
I-691	4-clorobencilo	Cl	Cl	Cl	H
I-692	Cinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-693	4-clorocinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-694	4-fluorocinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-695	4-bromocinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-696	4-trifluorometilcinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-697	4-trifluorometoxicinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-698	4-pentafluoroetoxicinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-699	4-metoxicinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-700	4-etoxicinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-701	4-cianocinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-702	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	Cl	Cl	Cl	H

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-703	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	Cl	Cl	Cl	H
I-704	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	Cl	Cl	Cl	H
I-705	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-706	3,5-dicloro-cinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-707	5-fenil-penta-2,4-dienilo	Cl	Cl	Cl	H
I-708	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-709	3-naftalen-2-il-alilo	Cl	Cl	Cl	H
I-710	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	Cl	Cl	Cl	H
I-711	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	Cl	Cl	Cl	H
I-712	3-piridin-4-il-alilo	Cl	Cl	Cl	H
I-713	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	Cl	Cl	Cl	H
REF. I-714	4-clorobencilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-715	Cinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-716	4-clorocinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-717	4-fluorocinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-718	4-bromocinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-719	4-trifluorometilcinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-720	4-trifluorometoxicinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-721	4-pentafluoroetoxicinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-722	4-metoxicinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-723	4-etoxicinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-724	4-cianocinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-725	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-726	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-727	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-728	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-729	3,5-dicloro-cinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-730	5-fenil-penta-2,4-dienilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-731	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-732	3-naftalen-2-il-alilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-733	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-734	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-735	3-piridin-4-il-alilo	Cl	Cl	Cl	Cl
REF. I-736	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	Cl	Cl	Cl	Cl

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
REF. I-737	4-clorobencilo	F	F	F	F
REF. I-738	Cinamilo	F	F	F	F
REF. I-739	4-clorocinamilo	F	F	F	F
REF. I-740	4-fluorocinamilo	F	F	F	F
REF. I-741	4-bromocinamilo	F	F	F	F
REF. I-742	4-trifluorometilcinamilo	F	F	F	F
REF. I-743	4-trifluorometoxicinamilo	F	F	F	F
REF. I-744	4-pentafluoroetoxicinamilo	F	F	F	F
REF. I-745	4-metoxicinamilo	F	F	F	F
REF. I-746	4-etoxicinamilo	F	F	F	F
REF. I-747	4-cianocinamilo	F	F	F	F
REF. I-748	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	F	F	F	F
REF. I-749	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	F	F	F	F
REF. I-750	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	F	F	F	F
REF. I-751	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	F	F	F	F
REF. I-752	3,5-dicloro-cinamilo	F	F	F	F
REF. I-753	5-fenil-penta-2,4-dienilo	F	F	F	F
REF. I-754	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	F	F	F	F
REF. I-755	3-naftalen-2-il-alilo	F	F	F	F
REF. I-756	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	F	F	F	F
REF. I-757	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	F	F	F	F
REF. I-758	3-piridin-4-il-alilo	F	F	F	F
REF. I-759	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	F	F	F	F
I-760	4-clorobencilo	H	F	H	F
I-761	Cinamilo	H	F	H	F
I-762	4-clorocinamilo	H	F	H	F
I-763	4-fluorocinamilo	H	F	H	F
I-764	4-bromocinamilo	H	F	H	F
I-765	4-trifluorometilcinamilo	H	F	H	F
I-766	4-trifluorometoxicinamilo	H	F	H	F
I-767	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	F	H	F
I-768	4-metoxicinamilo	H	F	H	F
I-769	4-etoxicinamilo	H	F	H	F
I-770	4-cianocinamilo	H	F	H	F

ES 2 408 856 T3

Compuesto n°	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-771	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	F	H	F
I-772	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	F	H	F
I-773	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	F	H	F
I-774	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	F	H	F
I-775	3,5-dicloro-cinamilo	H	F	H	F
I-776	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	F	H	F
I-777	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	F	H	F
I-778	3-naftalen-2-il-alilo	H	F	H	F
I-779	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	F	H	F
I-780	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	F	H	F
I-781	3-piridin-4-il-alilo	H	F	H	F
I-782	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	F	H	F
I-783	4-clorobencilo	H	F	F	H
I-784	Cinamilo	H	F	F	H
I-785	4-clorocinamilo	H	F	F	H
I-786	4-fluorocinamilo	H	F	F	H
I-787	4-bromocinamilo	H	F	F	H
I-788	4-trifluorometilcinamilo	H	F	F	H
I-789	4-trifluorometoxicinamilo	H	F	F	H
I-790	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	F	F	H
I-791	4-metoxicinamilo	H	F	F	H
I-792	4-etoxicinamilo	H	F	F	H
I-793	4-cianocinamilo	H	F	F	H
I-794	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	F	F	H
I-795	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	F	F	H
I-796	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	F	F	H
I-797	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	F	F	H
I-798	3,5-dicloro-cinamilo	H	F	F	H
I-799	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	F	F	H
I-800	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	F	F	H
I-801	3-naftalen-2-il-alilo	H	F	F	H
I-802	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	F	F	H
I-803	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	F	F	H
I-804	3-piridin-4-il-alilo	H	F	F	H

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-805	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	F	F	H
I-806	4-clorobencilo	H	F	F	H
I-807	Cinamilo	H	H	F	F
I-808	4-clorocinamilo	H	H	F	F
I-809	4-fluorocinamilo	H	H	F	F
I-810	4-bromocinamilo	H	H	F	F
I-811	4-trifluorometilcinamilo	H	H	F	F
I-812	4-trifluorometoxicinamilo	H	H	F	F
I-813	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	H	F	F
I-814	4-metoxicinamilo	H	H	F	F
I-815	4-etoxicinamilo	H	H	F	F
I-816	4-cianocinamilo	H	H	F	F
I-817	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	H	F	F
I-818	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	H	F	F
I-819	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	H	F	F
I-820	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	H	F	F
I-821	3,5-dicloro-cinamilo	H	H	F	F
I-822	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	H	F	F
I-823	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	H	F	F
I-824	3-naftalen-2-il-alilo	H	H	F	F
I-825	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	H	F	F
I-826	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	H	F	F
I-827	3-piridin-4-il-alilo	H	H	F	F
I-828	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	H	F	F
I-829	4-clorobencilo	H	H	Cl	Cl
I-830	Cinamilo	H	H	Cl	Cl
I-831	4-clorocinamilo	H	H	Cl	Cl
I-832	4-fluorocinamilo	H	H	Cl	Cl
I-833	4-bromocinamilo	H	H	Cl	Cl
I-834	4-trifluorometilcinamilo	H	H	Cl	Cl
I-835	4-trifluorometoxicinamilo	H	H	Cl	Cl
I-836	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	H	Cl	Cl
I-837	4-metoxicinamilo	H	H	Cl	Cl
I-838	4-etoxicinamilo	H	H	Cl	Cl

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-839	4-cianocinamilo	H	H	Cl	Cl
I-840	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	H	Cl	Cl
I-841	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	H	Cl	Cl
I-842	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	H	Cl	Cl
I-843	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	H	Cl	Cl
I-844	3,5-dicloro-cinamilo	H	H	Cl	Cl
I-845	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	H	Cl	Cl
I-846	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	H	Cl	Cl
I-847	3-naftalen-2-il-alilo	H	H	Cl	Cl
I-848	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	H	Cl	Cl
I-849	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	H	Cl	Cl
I-850	3-piridin-4-il-alilo	H	H	Cl	Cl
I-851	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	H	Cl	Cl
I-852	4-clorobencilo	H	Cl	Cl	H
I-853	Cinamilo	H	Cl	Cl	H
I-854	4-clorocinamilo	H	Cl	Cl	H
I-855	4-fluorocinamilo	H	Cl	Cl	H
I-856	4-bromocinamilo	H	Cl	Cl	H
I-857	4-trifluorometilcinamilo	H	Cl	Cl	H
I-858	4-trifluorometoxicinamilo	H	Cl	Cl	H
I-859	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	Cl	Cl	H
I-860	4-metoxicinamilo	H	Cl	Cl	H
I-861	4-etoxicinamilo	H	Cl	Cl	H
I-862	4-cianocinamilo	H	Cl	Cl	H
I-863	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	Cl	Cl	H
I-864	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	Cl	Cl	H
I-865	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	Cl	Cl	H
I-866	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	Cl	Cl	H
I-867	3,5-dicloro-cinamilo	H	Cl	Cl	H
I-868	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	Cl	Cl	H
I-869	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	Cl	Cl	H
I-870	3-naftalen-2-il-alilo	H	Cl	Cl	H
I-871	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	Cl	Cl	H
I-872	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	Cl	Cl	H

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-873	3-piridin-4-il-alilo	H	Cl	Cl	H
I-874	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	Cl	Cl	H
I-875	4-clorobencilo	H	Cl	H	Cl
I-876	Cinamilo	H	Cl	H	Cl
I-877	4-clorocinamilo	H	Cl	H	Cl
I-878	4-fluorocinamilo	H	Cl	H	Cl
I-879	4-bromocinamilo	H	Cl	H	Cl
I-880	4-trifluorometilcinamilo	H	Cl	H	Cl
I-881	4-trifluorometoxicinamilo	H	Cl	H	Cl
I-882	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	Cl	H	Cl
I-883	4-metoxicinamilo	H	Cl	H	Cl
I-884	4-etoxicinamilo	H	Cl	H	Cl
I-885	4-cianocinamilo	H	Cl	H	Cl
I-886	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	Cl	H	Cl
I-887	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	Cl	H	Cl
I-888	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	Cl	H	Cl
I-889	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	Cl	H	Cl
I-890	3,5-dicloro-cinamilo	H	Cl	H	Cl
I-891	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	Cl	H	Cl
I-S92	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	Cl	H	Cl
I-893	3-naftalen-2-il-alilo	H	Cl	H	Cl
I-894	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	Cl	H	Cl
I-895	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	Cl	H	Cl
I-896	3-piridin-4-il-alilo	H	Cl	H	Cl
I-897	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	Cl	H	Cl
I-898	4-clorobencilo	H	H	CH ₃	H
I-899	Cinamilo	H	H	CH ₃	H
I-900	4-clorocinamilo	H	H	CH ₃	H
I-901	4-fluorocinamilo	H	H	CH ₃	H
I-902	4-bromocinamilo	H	H	CH ₃	H
I-903	4-trifluorometilcinamilo	H	H	CH ₃	H
I-904	4-trifluorometoxicinamilo	H	H	CH ₃	H
I-905	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	H	CH ₃	H
I-906	4-metoxicinamilo	H	H	CH ₃	H

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-907	4-etoxicinamilo	H	H	CH ₃	H
I-908	4-cianocinamilo	H	H	CH ₃	H
I-909	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	H	CH ₃	H
I-910	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	H	CH ₃	H
I-911	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	H	CH ₃	H
I-912	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	H	CH ₃	H
I-913	3,5-dicloro-cinamilo	H	H	CH ₃	H
I-914	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	H	CH ₃	H
I-915	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	H	CH ₃	H
I-916	3-naftalen-2-il-alilo	H	H	CH ₃	H
I-917	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	H	CH ₃	H
I-918	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	H	CH ₃	H
I-919	3-piridin-4-il-alilo	H	H	CH ₃	H
I-920	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	H	CH ₃	H
I-921	4-clorobencilo	H	H	CF ₃	H
I-922	Cinamilo	H	H	CF ₃	H
I-923	4-clorocinamilo	H	H	CF ₃	H
I-924	4-fluorocinamilo	H	H	CF ₃	H
I-925	4-bromocinamilo	H	H	CF ₃	H
I-926	4-trifluorometilcinamilo	H	H	CF ₃	H
I-927	4-trifluorometoxicinamilo	H	H	CF ₃	H
I-928	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	H	CF ₃	H
I-929	4-metoxicinamilo	H	H	CF ₃	H
I-930	4-etoxicinamilo	H	H	CF ₃	H
I-931	4-cianocinamilo	H	H	CF ₃	H
I-932	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	H	CF ₃	H
I-933	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	H	CF ₃	H
I-934	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	H	CF ₃	H
I-935	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	H	CF ₃	H
I-936	3,5-dicloro-cinamilo	H	H	CF ₃	H
I-937	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	H	CF ₃	H
I-938	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	H	CF ₃	H
I-939	3-naftalen-2-il-alilo	H	H	CF ₃	H
I-940	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	H	CF ₃	H

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-941	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	H	CF ₃	H
I-942	3-piridin-4-il-alilo	H	H	CF ₃	H
I-943	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	H	CF ₃	H
I-944	4-clorobencilo	H	H	OCH ₃	H
I-945	Cinamilo	H	H	OCH ₃	H
I-946	4-clorocinamilo	H	H	OCH ₃	H
I-947	4-fluorocinamilo	H	H	OCH ₃	H
I-948	4-bromocinamilo	H	H	OCH ₃	H
I-949	4-trifluorometilcinamilo	H	H	OCH ₃	H
I-950	4-trifluorometoxicinamilo	H	H	OCH ₃	H
I-951	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	H	OCH ₃	H
I-952	4-metoxicinamilo	H	H	OCH ₃	H
I-953	4-etoxicinamilo	H	H	OCH ₃	H
I-954	4-cianocinamilo	H	H	OCH ₃	H
I-955	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	H	OCH ₃	H
I-956	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	H	OCH ₃	H
I-957	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	H	OCH ₃	H
I-958	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	H	OCH ₃	H
I-959	3,5-dicloro-cinamilo	H	H	OCH ₃	H
I-960	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	H	OCH ₃	H
I-961	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	H	OCH ₃	H
I-962	3-naftalen-2-il-alilo	H	H	OCH ₃	H
I-963	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	H	OCH ₃	H
I-964	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	H	OCH ₃	H
I-965	3-piridin-4-il-alilo	H	H	OCH ₃	H
I-966	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	H	OCH ₃	H
I-967	4-clorobencilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-968	Cinamilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-969	4-clorocinamilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-970	4-fluorocinamilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-971	4-bromocinamilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-972	4-trifluorometilcinamilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-973	4-trifluorometoxicinamilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-974	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-975	4-metoxicinamilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-976	4-etoxicinamilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-977	4-cianocinamilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-978	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-979	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-980	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-981	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-982	3,5-dicloro-cinamilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-983	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-984	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-985	3-naftalen-2-il-alilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-986	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-987	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-988	3-piridin-4-il-alilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-989	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	H	CO ₂ CH ₃	H
I-990	4-clorobencilo	CH ₃	H	H	H
I-991	Cinamilo	CH ₃	H	H	H
I-992	4-clorocinamilo	CH ₃	H	H	H
I-993	4-fluorocinamilo	CH ₃	H	H	H
I-994	4-bromocinamilo	CH ₃	H	H	H
I-995	4-trifluorometilcinamilo	CH ₃	H	H	H
I-996	4-trifluorometoxicinamilo	CH ₃	H	H	H
I-997	4-pentafluoroetoxicinamilo	CH ₃	H	H	H
I-998	4-metoxicinamilo	CH ₃	H	H	H
I-999	4-etoxicinamilo	CH ₃	H	H	H
I-1000	4-cianocinamilo	CH ₃	H	H	H
I-1001	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	CH ₃	H	H	H
I-1002	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	CH ₃	H	H	H
I-1003	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	CH ₃	H	H	H
I-1004	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	CH ₃	H	H	H
I-1005	3,5-dicloro-cinamilo	CH ₃	H	H	H
I-1006	5-fenil-penta-2,4-dienilo	CH ₃	H	H	H
I-1007	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	CH ₃	H	H	H
I-1008	3-naftalen-2-il-alilo	CH ₃	H	H	H

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-1009	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	CH ₃	H	H	H
I-1010	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	CH ₃	H	H	H
I-1011	3-piridin-4-il-alilo	CH ₃	H	H	H
I-1012	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	CH ₃	H	H	H
I-1013	4-clorobencilo	H	CH ₃	H	H
I-1014	Cinamilo	H	CH ₃	H	H
I-1015	4-clorocinamilo	H	CH ₃	H	H
I-1016	4-fluorocinamilo	H	CH ₃	H	H
I-1017	4-bromocinamilo	H	CH ₃	H	H
I-1018	4-trifluorometilcinamilo	H	CH ₃	H	H
I-1019	4-trifluorometoxicinamilo	H	CH ₃	H	H
I-1020	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	CH ₃	H	H
I-1021	4-metoxicinamilo	H	CH ₃	H	H
I-1022	4-etoxicinamilo	H	CH ₃	H	H
I-1023	4-cianocinamilo	H	CH ₃	H	H
I-1024	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	CH ₃	H	H
I-1025	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	CH ₃	H	H
I-1026	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	CH ₃	H	H
I-1027	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	CH ₃	H	H
I-1028	3,5-dicloro-cinamilo	H	CH ₃	H	H
I-1029	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	CH ₃	H	H
I-1030	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	CH ₃	H	H
I-1031	3-naftalen-2-il-alilo	H	CH ₃	H	H
I-1032	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	CH ₃	H	H
I-1033	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	CH ₃	H	H
I-1034	3-piridin-4-il-alilo	H	CH ₃	H	H
I-1035	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	CH ₃	H	H
I-1036	4-clorobencilo	H	H	H	CH ₃
I-1037	Cinamilo	H	H	H	CH ₃
I-1038	4-clorocinamilo	H	H	H	CH ₃
I-1039	4-fluorocinamilo	H	H	H	CH ₃
I-1040	4-bromocinamilo	H	H	H	CH ₃
I-1041	4-trifluorometilcinamilo	H	H	H	CH ₃
I-1042	4-trifluorometoxicinamilo	H	H	H	CH ₃

ES 2 408 856 T3

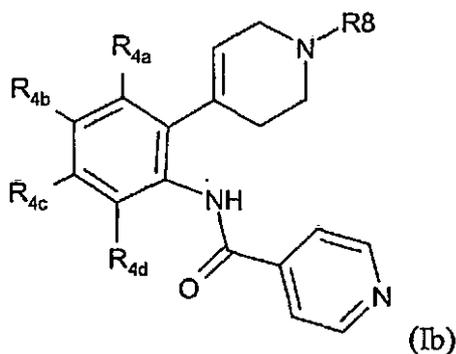
Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-1043	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	H	H	CH ₃
I-1044	4-metoxicinamilo	H	H	H	CH ₃
I-1045	4-etoxicinamilo	H	H	H	CH ₃
I-1046	4-cianocinamilo	H	H	H	CH ₃
I-1047	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	H	H	CH ₃
I-1048	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	H	H	CH ₃
I-1049	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	H	H	CH ₃
I-1050	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	H	H	CH ₃
I-1451	3,5-dicloro-cinamilo	H	H	H	CH ₃
I-1052	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	H	H	CH ₃
I-1053	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	H	H	CH ₃
I-1054	3-naftalen-2-il-alilo	H	H	H	CH ₃
I-1055	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	H	H	CH ₃
I-1056	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	H	H	CH ₃
I-1057	3-piridin-4-il-alilo	H	H	H	CH ₃
I-1058	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	H	H	CH ₃
I-1059	4-clorobencilo	H	CF ₃	H	H
I-1060	Cinamilo	H	CF ₃	H	H
I-1061	4-clorocinamilo	H	CF ₃	H	H
I-1062	4-fluorocinamilo	H	CF ₃	H	H
I-1063	4-bromocinamilo	H	CF ₃	H	H
I-1064	4-trifluorometilcinamilo	H	CF ₃	H	H
I-1065	4-trifluorometoxicinamilo	H	CF ₃	H	H
I-1066	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	CF ₃	H	H
I-1067	4-metoxicinamilo	H	CF ₃	H	H
I-1068	4-etoxicinamilo	H	CF ₃	H	H
I-1069	4-cianocinamilo	H	CF ₃	H	H
I-1070	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	CF ₃	H	H
I-1071	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	CF ₃	H	H
I-1072	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	CF ₃	H	H
I-1073	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	CF ₃	H	H
I-1074	3,5-dicloro-cinamilo	H	CF ₃	H	H
I-1075	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	CF ₃	H	H
I-1076	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	CF ₃	H	H

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ^b	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-1077	3-naftalen-2-il-alilo	H	CF ₃	H	H
I-1078	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	CF ₃	H	H
I-1079	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	CF ₃	H	H
I-1080	3-piridin-4-il-alilo	H	CF ₃	H	H
I-1081	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	CF ₃	H	H
I-1082	4-clorobencilo	H	iPr	H	H
I-1083	Cinamilo	H	iPr	H	H
I-1084	4-clorocinamilo	H	iPr	H	H
I-1085	4-fluorocinamilo	H	iPr	H	H
I-1086	4-bromocinamilo	H	iPr	H	H
I-1087	4-trifluorometilcinamilo	H	iPr	H	H
I-1088	4-trifluorometoxicinamilo	H	iPr	H	H
I-1089	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	iPr	H	H
I-1090	4-metoxicinamilo	H	iPr	H	H
I-1091	4-etoxicinamilo	H	iPr	H	H
I-1092	4-cianocinamilo	H	iPr	H	H
I-1093	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	iPr	H	H
I-1094	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	iPr	H	H
I-1095	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	iPr	H	H
I-1096	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	iPr	H	H
I-1097	3,5-dicloro-cinamilo	H	iPr	H	H
I-1098	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	iPr	H	H
I-1099	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	iPr	H	H
I-1100	3-naftalen-2-il-alilo	H	iPr	H	H
I-1101	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	iPr	H	H
I-1102	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	iPr	H	H
I-1103	3-piridin-4-il-alilo	H	iPr	H	H
I-1104	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	iPr	H	H
I-1105	4-clorobencilo	H	OCF ₃	H	H
I-1106	Cinamilo	H	OCF ₃	H	H
I-1107	4-clorocinamilo	H	OCF ₃	H	H
I-1108	4-fluorocinamilo	H	OCF ₃	H	H
I-1109	4-bromocinamilo	H	OCF ₃	H	H
I-1110	4-trifluorometilcinamilo	H	OCF ₃	H	H

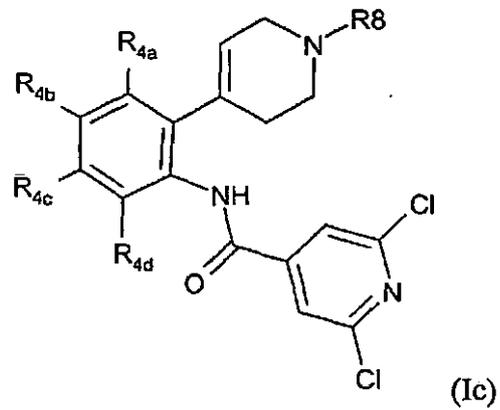
Compuesto n°	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-1111	4-trifluorometoxicinamilo	H	OCF ₃	H	H
I-1112	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	OCF ₃	H	H
I-1113	4-metoxicinamilo	H	OCF ₃	H	H
I-1114	4-etoxicinamilo	H	OCF ₃	H	H
I-1115	4-cianocinamilo	H	OCF ₃	H	H
I-1116	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	H	OCF ₃	H	H
I-1117	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	OCF ₃	H	H
I-1118	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	H	OCF ₃	H	H
I-1119	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	OCF ₃	H	H
I-1120	3,5-dicloro-cinamilo	H	OCF ₃	H	H
I-1121	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	OCF ₃	H	H
I-1122	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	OCF ₃	H	H
I-1123	3-naftalen-2-il-alilo	H	OCF ₃	H	H
I-1124	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	H	OCF ₃	H	H
I-1125	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	H	OCF ₃	H	H
I-1126	3-piridin-4-il-alilo	H	OCF ₃	H	H
I-1127	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	H	OCF ₃	H	H

La tabla II proporciona 1127 compuestos de fórmula Ib



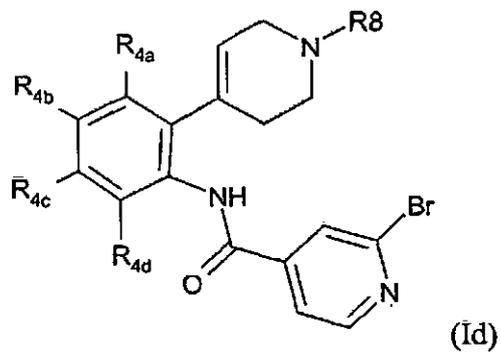
en la que los valores de R⁸, R^{4a}, R^{4b}, R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

5 La tabla III proporciona 1127 compuestos de fórmula Ic



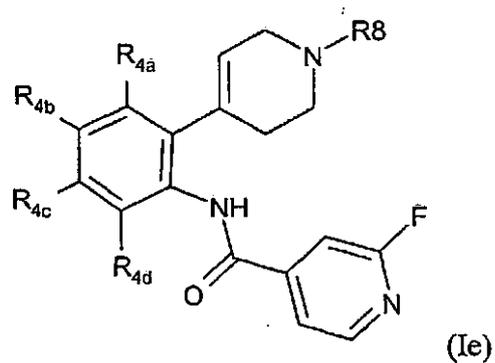
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla IV proporciona 1127 compuestos de fórmula Id



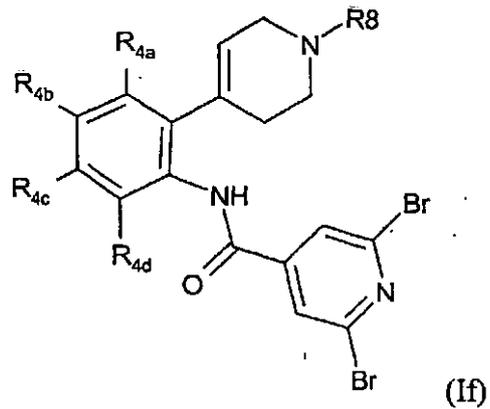
5 en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla V proporciona 1127 compuestos de fórmula Ie



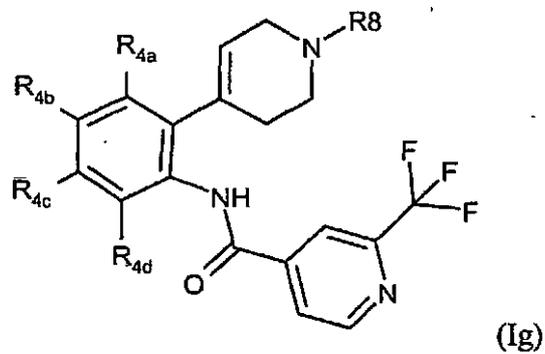
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla VI proporciona 1127 compuestos de fórmula If



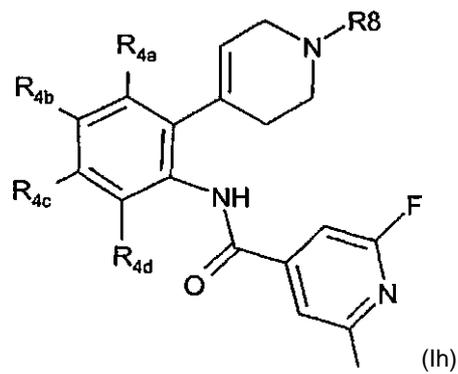
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla VII proporciona 1127 compuestos de fórmula Ig



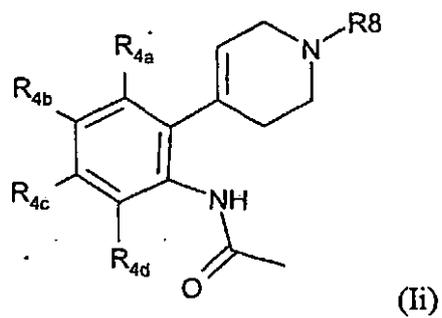
5 en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla VIII proporciona 1127 compuestos de fórmula Ih



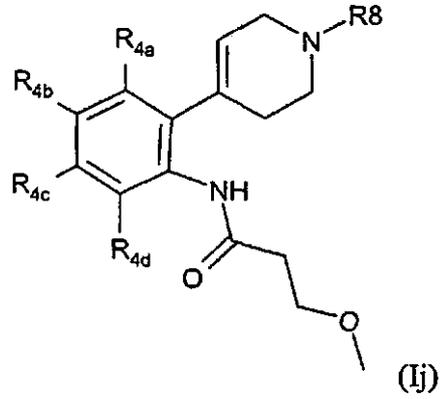
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla IX proporciona 1127 compuestos de fórmula Ii



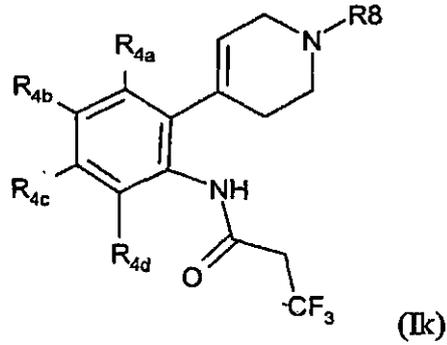
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla X proporciona 1127 compuestos de fórmula Ij



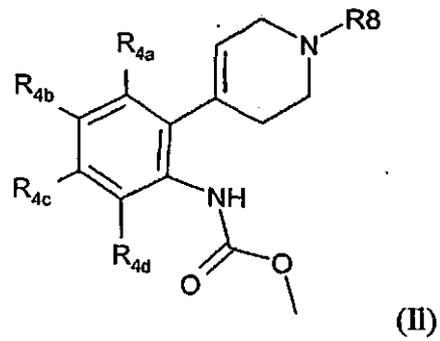
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

5 La tabla XI proporciona 1127 compuestos de fórmula Ik



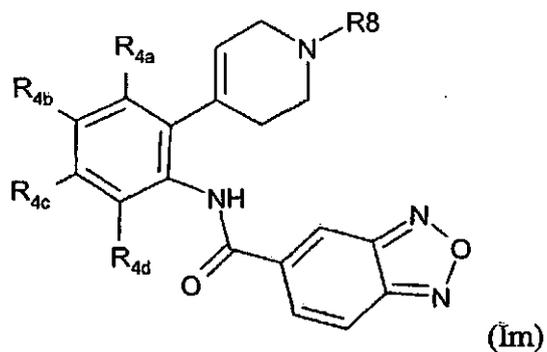
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XII proporciona 1127 compuestos de fórmula II



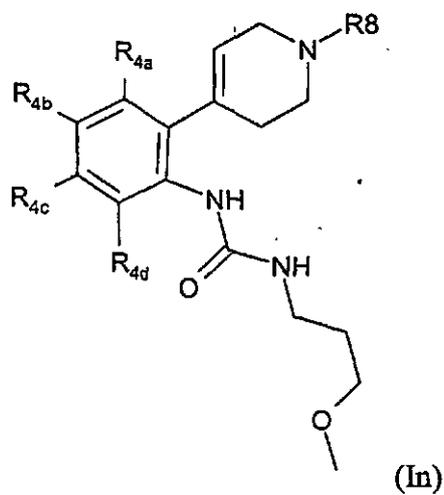
10 en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XIII proporciona 1127 compuestos de fórmula Im



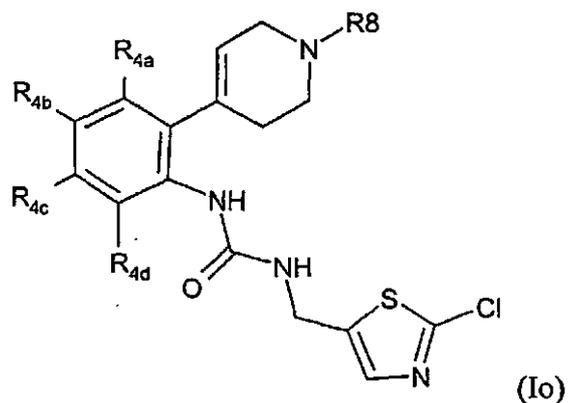
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XIV proporciona 1127 compuestos de fórmula In



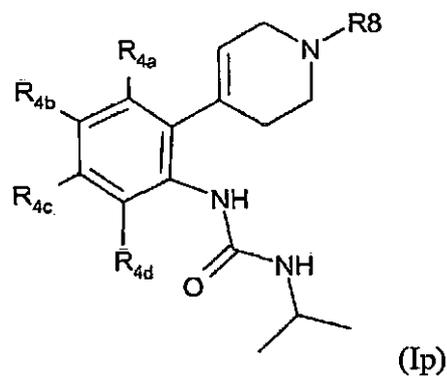
5 en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XV proporciona 1127 compuestos de fórmula Io



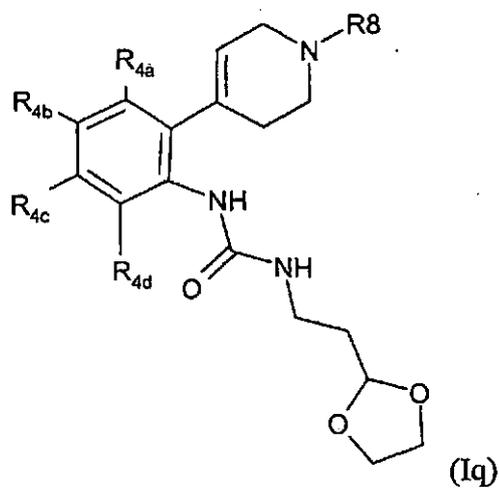
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XVI proporciona 1127 compuestos de fórmula Ip



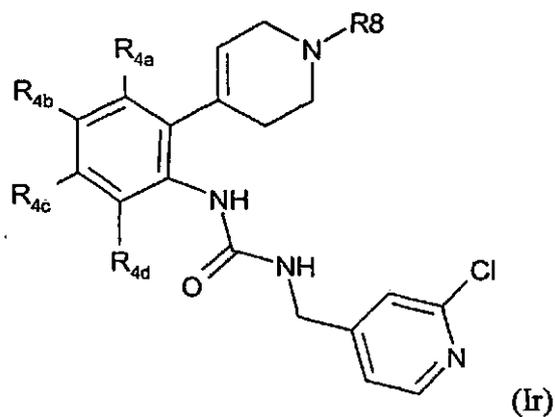
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XVII proporciona 1127 compuestos de fórmula Iq



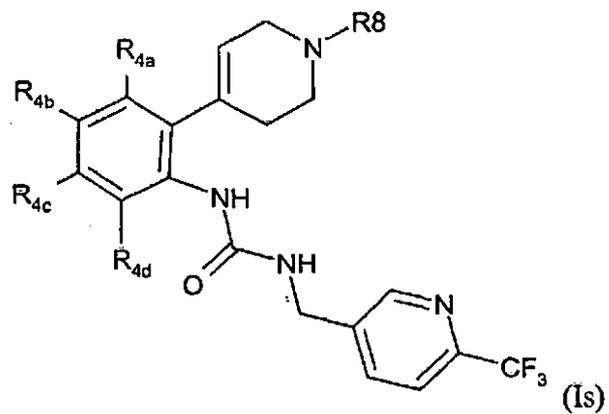
5 en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XVIII proporciona 1127 compuestos de fórmula Ir



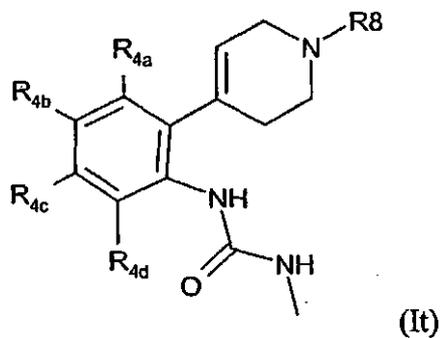
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XIX proporciona 1127 compuestos de fórmula Is



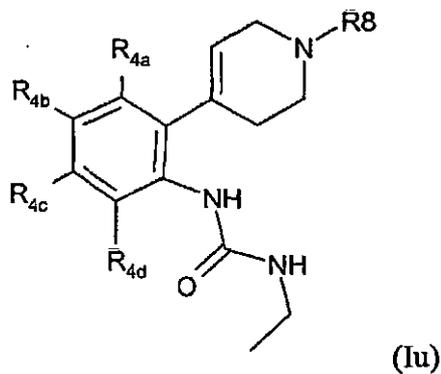
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XX proporciona 1127 compuestos de fórmula It



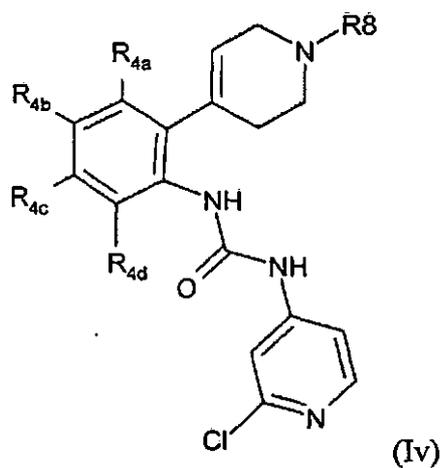
5 en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XXI proporciona 1127 compuestos de fórmula Iu



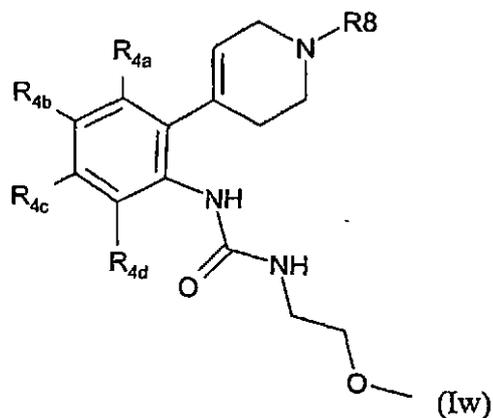
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XXII proporciona 1127 compuestos de fórmula Iv



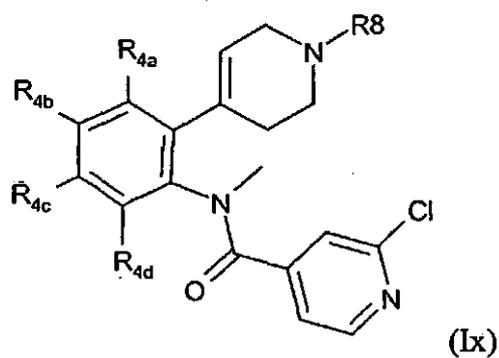
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XXIII proporciona 1127 compuestos de fórmula Iw



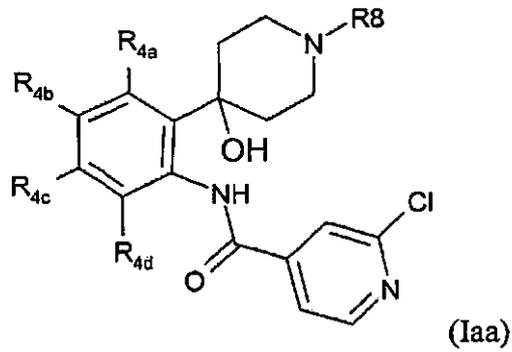
5 en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XXIV proporciona 1127 compuestos de fórmula Ix



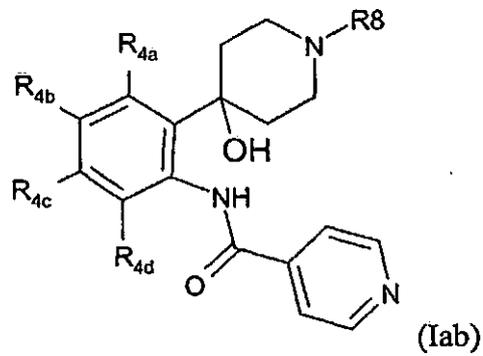
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XXV proporciona 1127 compuestos de fórmula Iaa



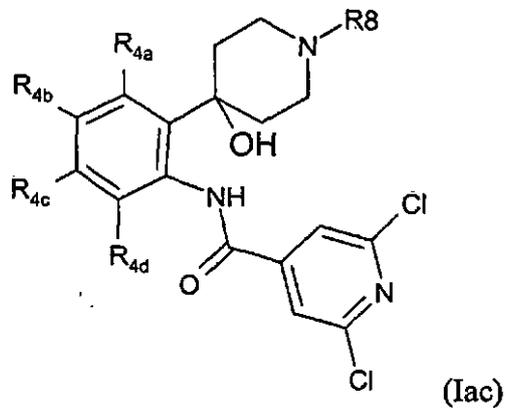
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XXVI proporciona 1127 compuestos de fórmula lab



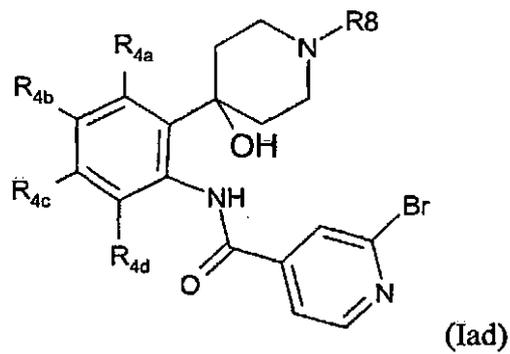
5 en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XXVII proporciona 1127 compuestos de fórmula lac



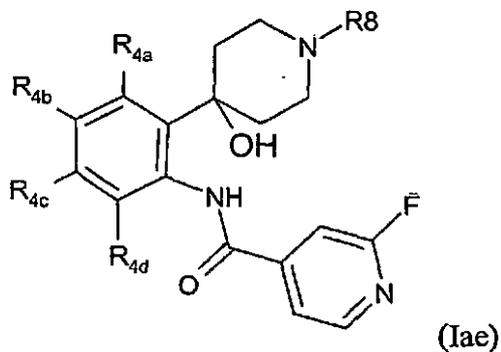
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XXVIII proporciona 1127 compuestos de fórmula lad



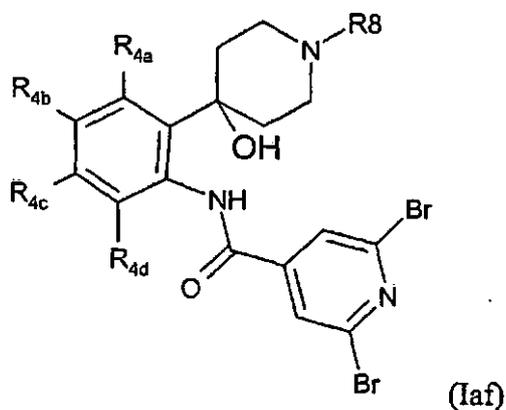
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XXIX proporciona 1127 compuestos de fórmula lae



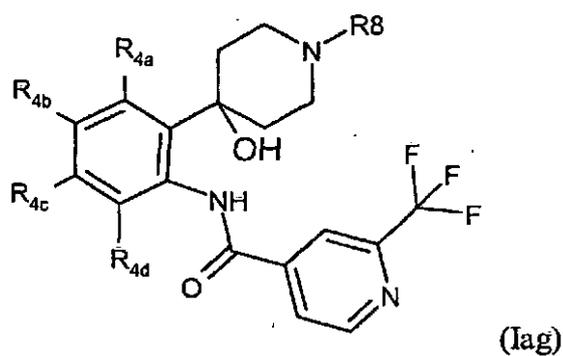
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

5 La tabla XXX proporciona 1127 compuestos de fórmula laf



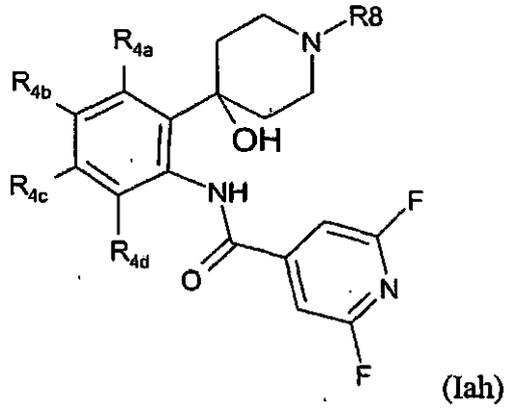
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XXXI proporciona 1127 compuestos de fórmula lag



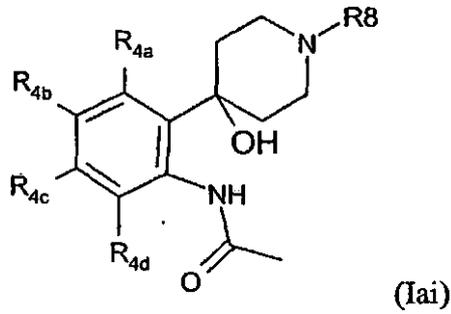
10 en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XXXII proporciona 1127 compuestos de fórmula lah



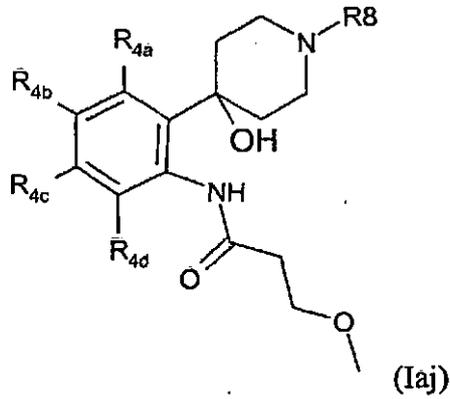
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XXXIII proporciona 1127 compuestos de fórmula Iai



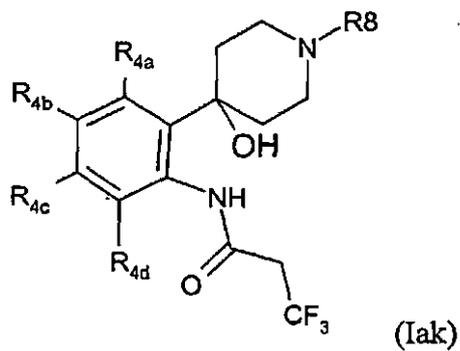
5 en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XXXIV proporciona 1127 compuestos de fórmula Iaj



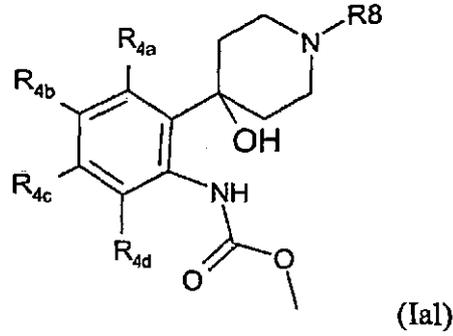
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XXXV proporciona 1127 compuestos de fórmula Iak



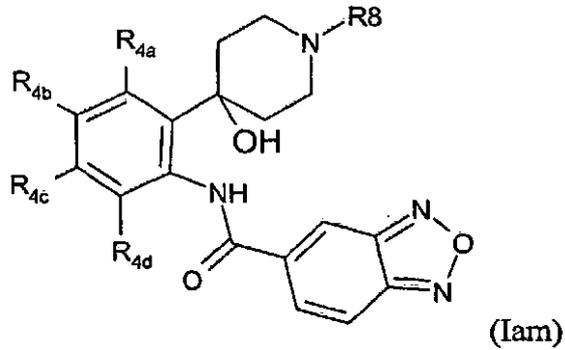
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XXXVI proporciona 1127 compuestos de fórmula Ia1



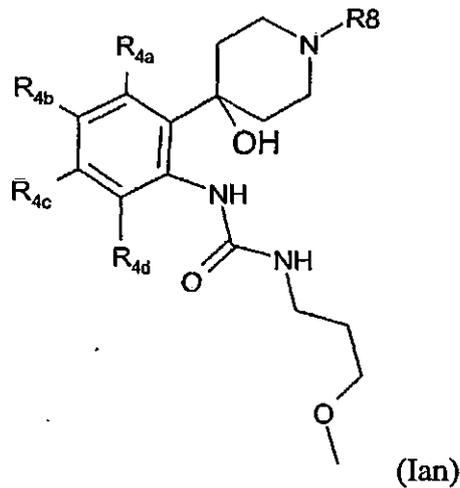
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

5 La tabla XXXVII proporciona 1127 compuestos de fórmula Ia2



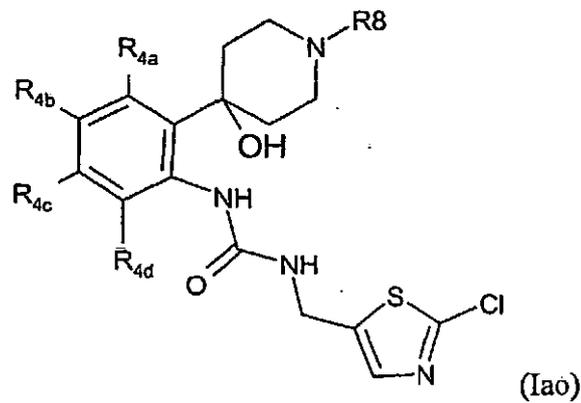
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XXXVIII proporciona 1127 compuestos de fórmula Ia3



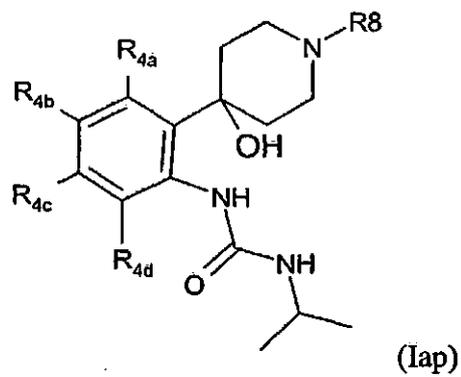
10 en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XXXIX proporciona 1127 compuestos de fórmula Ia4



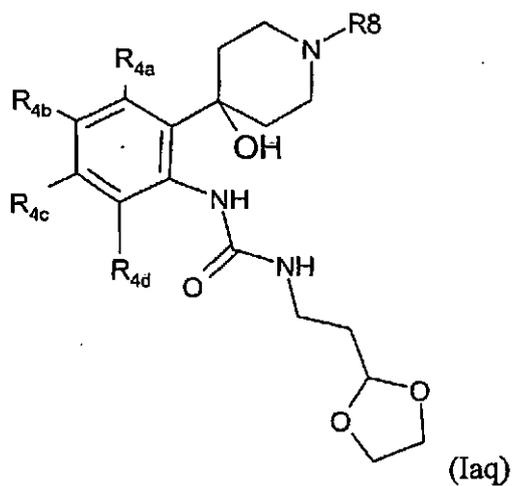
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XL proporciona 1127 compuestos de fórmula Iap



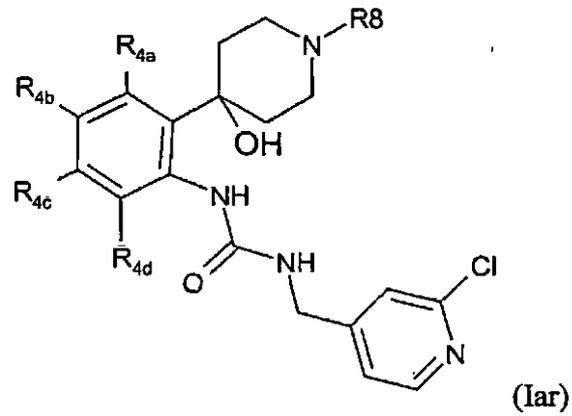
5 en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XLI proporciona 1127 compuestos de fórmula Iaq



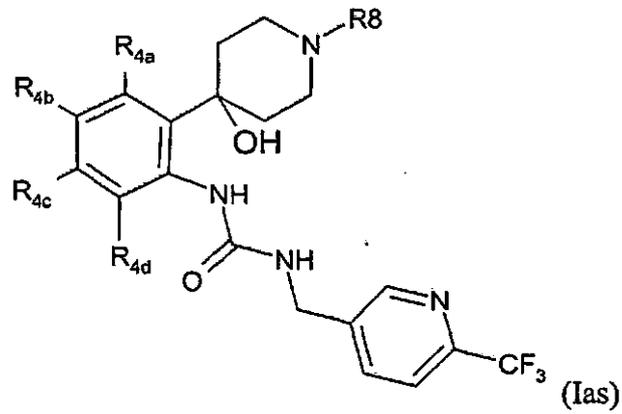
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XLII proporciona 1127 compuestos de fórmula Iar



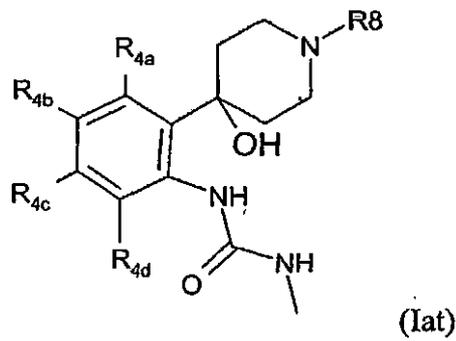
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XLIII proporciona 1127 compuestos de fórmula Ias



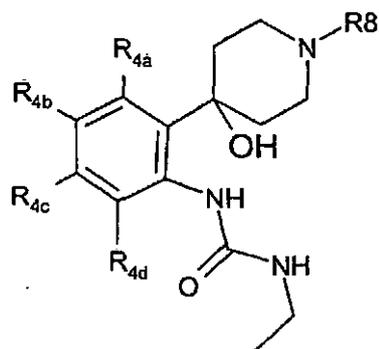
5 en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XLIV proporciona 1127 compuestos de fórmula Iat



en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

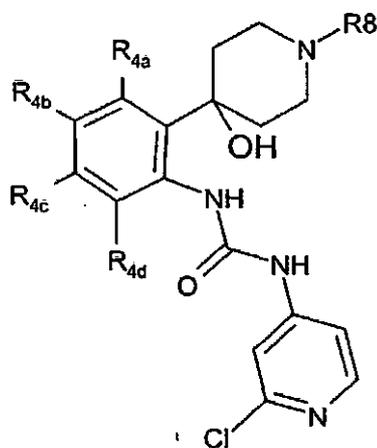
La tabla XLV proporciona 1127 compuestos de fórmula Iau



(Iau)

en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

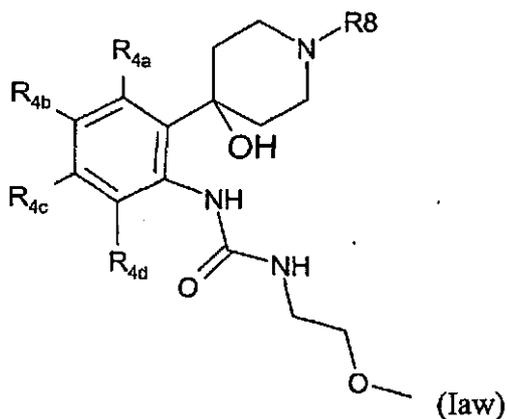
La tabla XLVI proporciona 1127 compuestos de fórmula Iau



(Iav)

5 en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

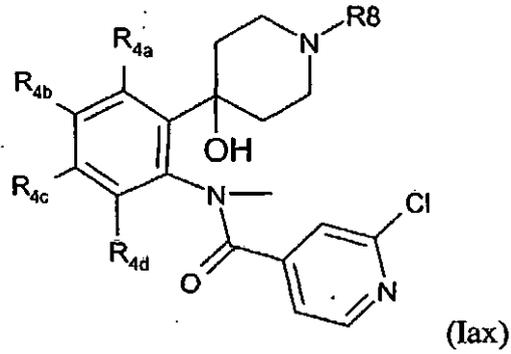
La tabla XLVII proporciona 1127 compuestos de fórmula Iav



(Iaw)

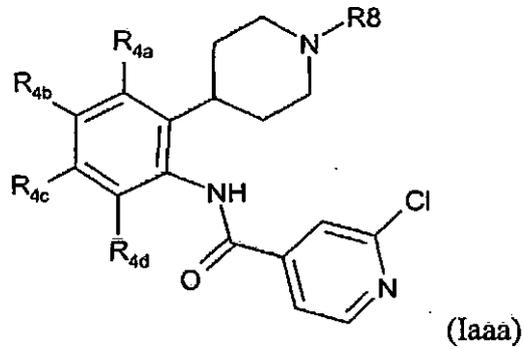
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla XLVIII proporciona 1127 compuestos de fórmula Iax

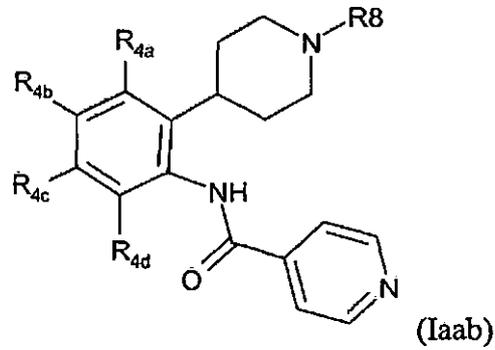


en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla IL proporciona 1127 compuestos de fórmula Iaaa

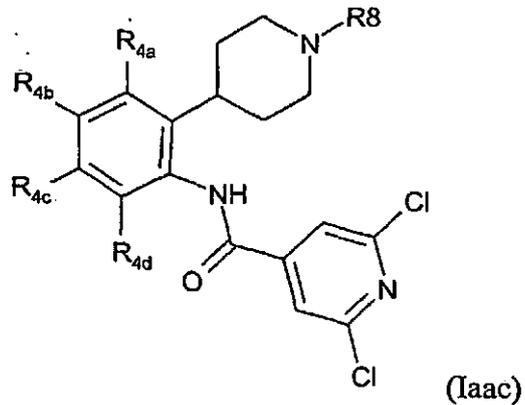


5 La tabla L proporciona 1127 compuestos de fórmula Iaab



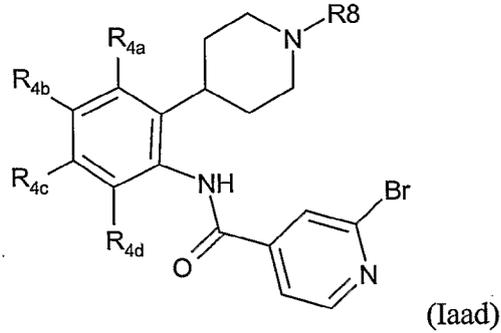
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla LI proporciona 1127 compuestos de fórmula Iaac



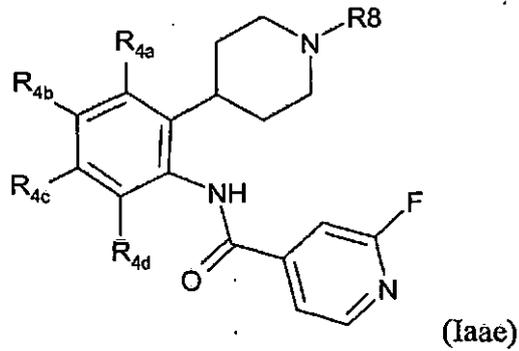
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla LII proporciona 1127 compuestos de fórmula Iaad



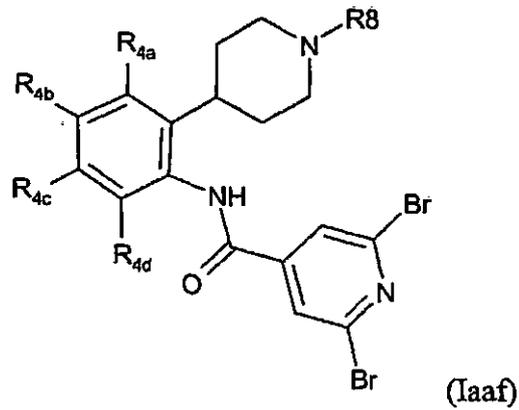
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

5 La tabla LIII proporciona 1127 compuestos de fórmula Iaae



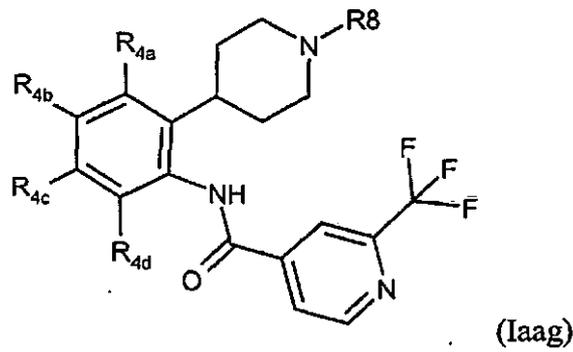
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla LIV proporciona 1127 compuestos de fórmula Iaaf



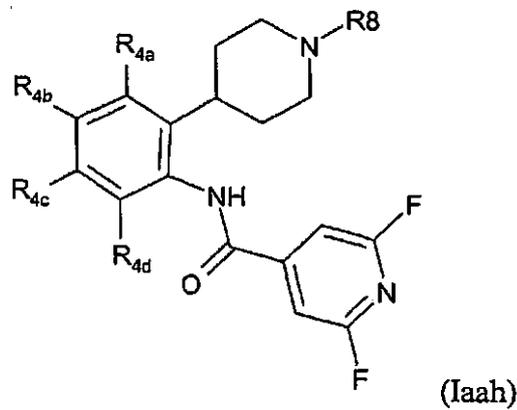
10 en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla LV proporciona 1127 compuestos de fórmula Iaag



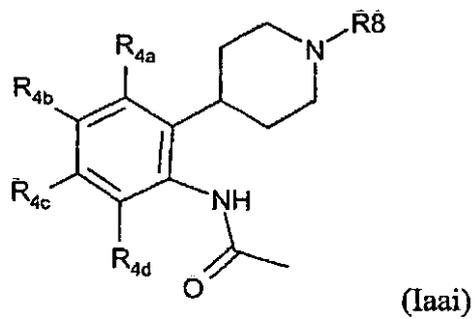
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla LVI proporciona 1127 compuestos de fórmula Iaah



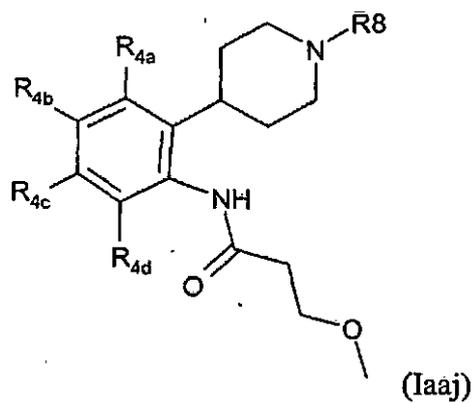
5 en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla LVII proporciona 1127 compuestos de fórmula Iaai



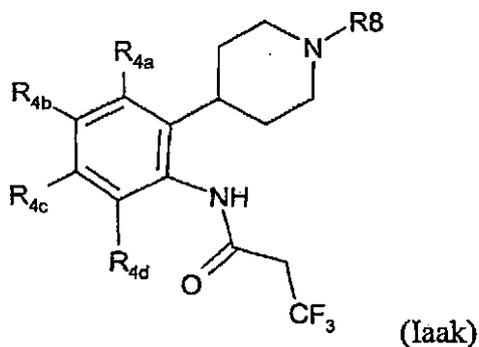
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla LVIII proporciona 1127 compuestos de fórmula Iaaj



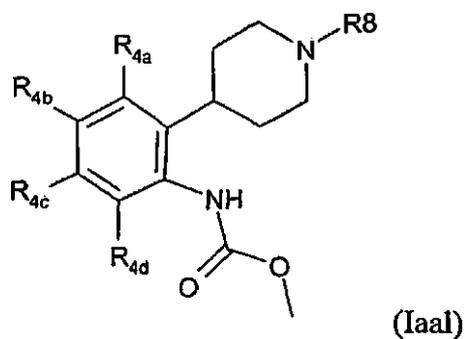
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla LIX proporciona 1127 compuestos de fórmula laak



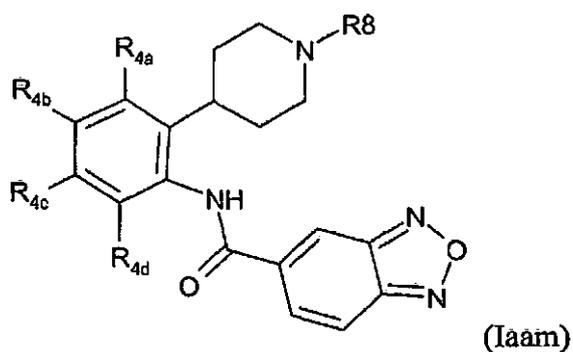
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

5 La tabla LX proporciona 1127 compuestos de fórmula laal



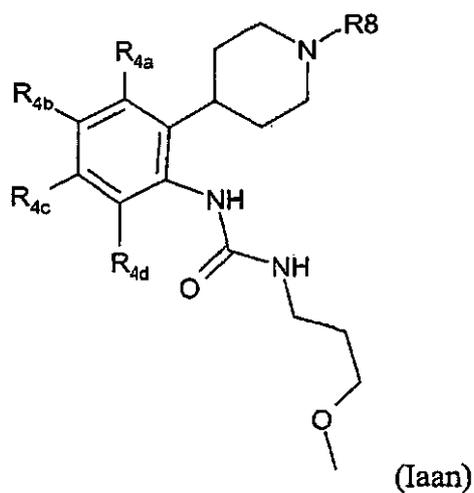
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla LXI proporciona 1127 compuestos de fórmula laam



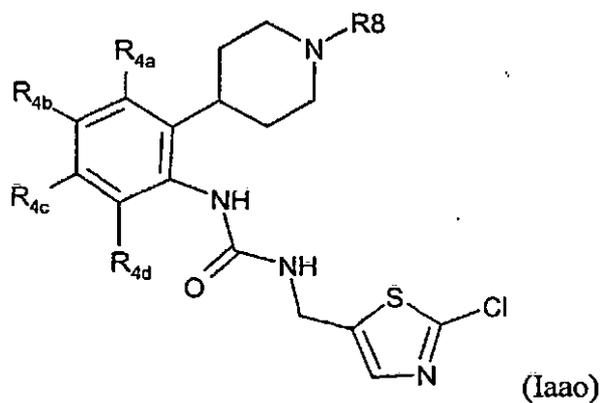
10 en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla LXII proporciona 1127 compuestos de fórmula laan



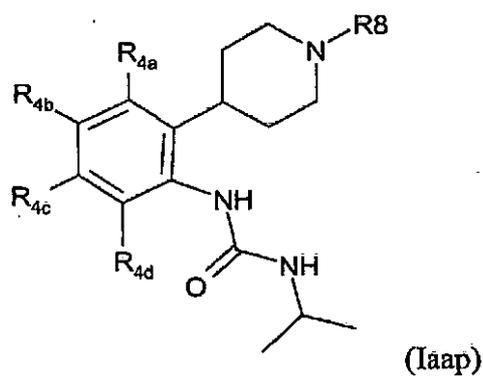
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla LXIII proporciona 1127 compuestos de fórmula Iaa0



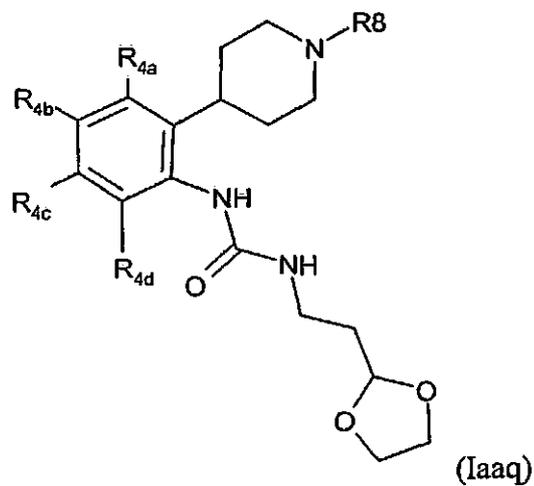
5 en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla LXIV proporciona 1127 compuestos de fórmula IaaP



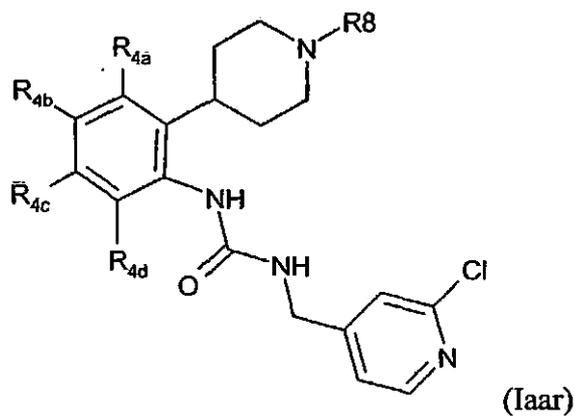
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla LXV proporciona 1127 compuestos de fórmula IaaQ



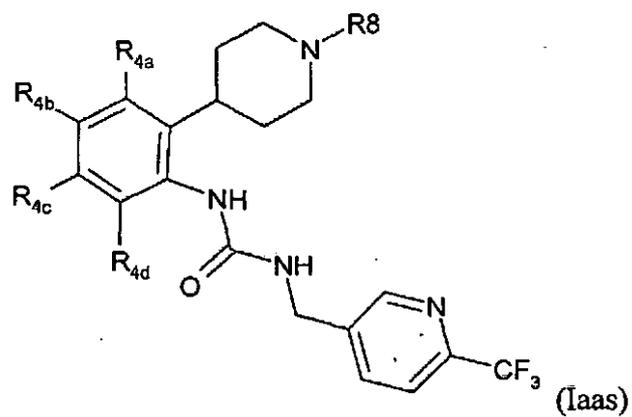
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla LXVI proporciona 1127 compuestos de fórmula Iaaq



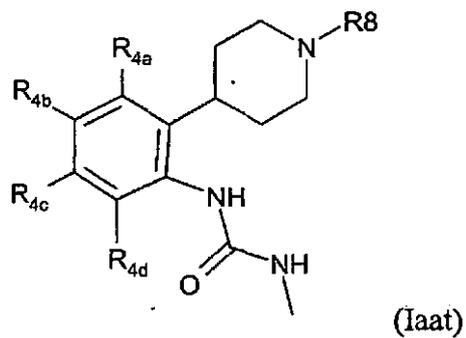
5 en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla LXVII proporciona 1127 compuestos de fórmula Iaaq



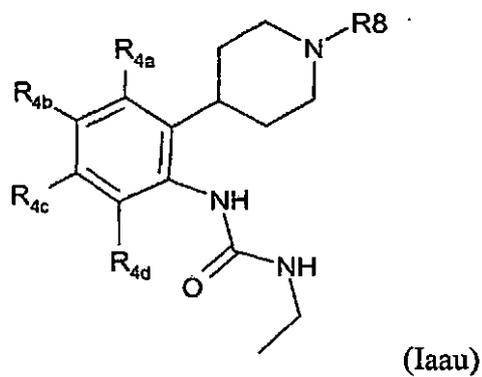
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla LXVIII proporciona 1127 compuestos de fórmula Iaaq



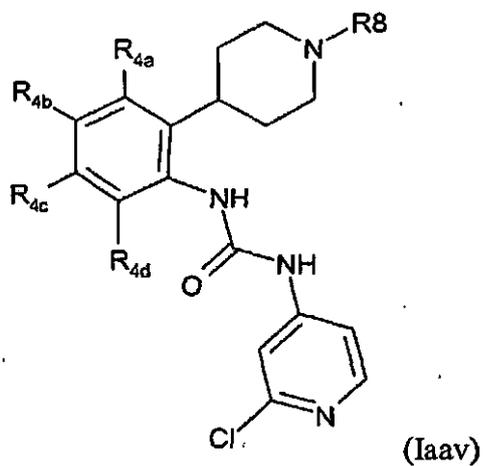
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla LXIX proporciona 1127 compuestos de fórmula IaaU



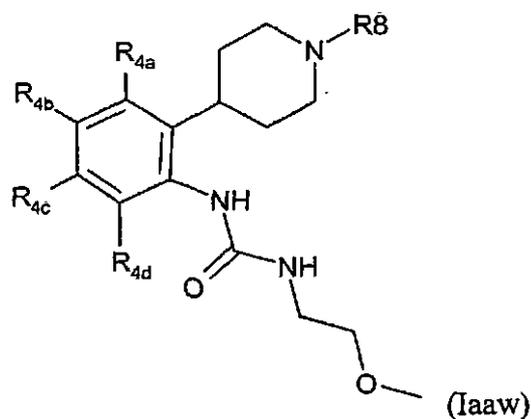
5 en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla LXX proporciona 1127 compuestos de fórmula IaaV



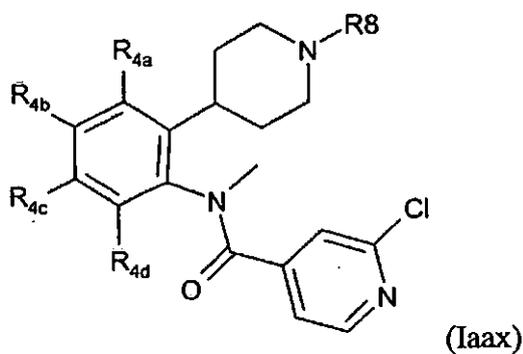
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla LXXI proporciona 1127 compuestos de fórmula IaaW



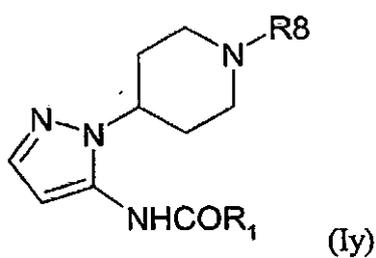
en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla LXXII proporciona 1127 compuestos de fórmula Iaax



5 en la que los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se dan en la tabla 1.

La tabla LXXIII proporciona 506 compuestos de fórmula Iy



en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

Tabla 73

Compuesto n ^o	R^8	R^1
LXXIII-1	Cinamilo	2-cloro-pirid-4-ilo
LXXIII-2	4-clorocinamilo	2-cloro-pirid-4-ilo
LXXIII-3	4-fluorocinamilo	2-cloro-pirid-4-ilo
LXXIII-4	4-bromocinamilo	2-cloro-pirid-4-ilo
LXXIII-5	4-trifluorometilcinamilo	2-cloro-pirid-4-ilo
LXXIII-6	4-trifluorometoxicinamilo	2-cloro-pirid-4-ilo
LXXIII-7	4-pentafluoroetoxicinamilo	2-cloro-pirid-4-ilo

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ⁸	R ¹
LXXIII-8	4-metoxicinamilo	2-cloro-pirid-4-ilo
LXXIII-9	4-etoxicinamilo	2-cloro-pirid-4-ilo
LXXIII-10	4-cianocinamilo	2-cloro-pirid-4-ilo
LXXIII-11	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	2-cloro-pirid-4-ilo
LXXIII-12	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	2-cloro-pirid-4-ilo
LXXIII-13	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	2-cloro-pirid-4-ilo
LXXIII-14	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	2-cloro-pirid-4-ilo
LXXIII-15	3,5-dicloro-cinamilo	2-cloro-pirid-4-ilo
LXXIII-16	5-fenil-penta-2,4-dienilo	2-cloro-pirid-4-ilo
LXXIII-17	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	2-cloro-pirid-4-ilo
LXXIII-18	3-naftalen-2-il-alilo	2-cloro-pirid-4-ilo
LXXII-19	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	2-cloro-pirid-4-ilo
LXXIII-20	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	2-cloro-pirid-4-ilo
LXXIII-21	3-piridin-4-il-alilo	2-cloro-pirid-4-ilo
LXXIII-22	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	2-cloro-pirid-4-ilo
LXXIII-23	Cinamilo	pirid-4-ilo
LXXIII-24	4-clorocinamilo	pirid-4-ilo
LXXIII-25	4-fluorocinamilo	pirid-4-ilo
LXXIII-26	4-bromocinamilo	pirid-4-ilo
LXXIII-27	4-trifluorometilcinamilo	pirid-4-ilo
LXXIII-28	4-trifluorometoxicinamilo	pirid-4-ilo
LXXIII-29	4-pentafluoroetoxicinamilo	pirid-4-ilo
LXXIII-30	4-metoxicinamilo	pirid-4-ilo
LXXIII-31	4-etoxicinamilo	pirid-4-ilo
LXXIII-32	4-cianocinamilo	pirid-4-ilo
LXXIII-33	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	pirid-4-ilo
LXXIII-34	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	pirid-4-ilo
LXXIII-35	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	pirid-4-ilo
LXXIII-36	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	pirid-4-ilo
LXXIII-37	3,5-dicloro-cinamilo	pirid-4-ilo
LXXIII-38	5-fenil-penta-2,4-dienilo	pirid-4-ilo
LXXIII-39	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	pirid-4-ilo
LXXIII-40	3-naftalen-2-il-alilo	pirid-4-ilo
LXXIII-41	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	pirid-4-ilo

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ⁸	R ¹
LXXIII-42	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	pirid-4-ilo
LXXIII-43	3-piridin-4-il-alilo	pirid-4-ilo
LXXIII-44	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	pirid-4-ilo
LXXIII-45	Cinamilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-46	4-clorocinamilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-47	4-fluorocinamilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-48	4-bromocinamilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-49	4-trifluorometilcinamilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-50	4-trifluorometoxicinamilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-51	4-pentafluoroetoxicinamilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-52	4-metoxicinamilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-53	4-etoxicinamilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-54	4-cianocinamilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-55	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-56	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-57	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-58	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-59	3,5-dicloro-cinamilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-60	5-fenil-penta-2,4-dienilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-61	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-62	3-naftalen-2-il-alilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-63	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-64	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-65	3-piridin-4-il-alilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-66	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	2,6-dicloro-pirid-4-ilo
LXXIII-67	Cinamilo	2-bromo-pirid-4-ilo
LXXIII-68	4-clorocinamilo	2-bromo-pirid-4-ilo
LXXIII-69	4-fluorocinamilo	2-bromo-pirid-4-ilo
LXXIII-70	4-bromocinamilo	2-bromo-pirid-4-ilo
LXXIII-71	4-trifluorometilcinamilo	2-bromo-pirid-4-ilo
LXXIII-72	4-trifluorometoxicinamilo	2-bromo-pirid-4-ilo
LXXIII-73	4-pentafluoroetoxicinamilo	2-bromo-pirid-4-ilo
LXXIII-74	4-metoxicinamilo	2-bromo-pirid-4-ilo
LXXIII-75	4-etoxicinamilo	2-bromo-pirid-4-ilo

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ⁸	R ¹
LXXIII-76	4-cianocinamilo	2-bromo-pirid-4-ilo
LXXIII-77	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	2-bromo-pirid-4-ilo
LXXIII-78	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	2-bromo-pirid-4-ilo
LXXIII-79	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	2-bromo-pirid-4-ilo
LXXIII-80	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	2-bromo-pirid-4-ilo
LXXIII-81	3,5-dicloro-cinamilo	2-bromo-pirid-4-ilo
LXXIII-82	5-fenil-penta-2,4-dienilo	2-bromo-pirid-4-ilo
LXXIII-83	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	2-bromo-pirid-4-ilo
LXXIII-84	3-naftalen-2-il-alilo	2-bromo-pirid-4-ilo
LXXIII-85	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	2-bromo-pirid-4-ilo
LXXIII-86	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	2-bromo-pirid-4-ilo
LXXIII-87	3-piridin-4-il-alilo	2-bromo-pirid-4-ilo
LXXIII-88	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	2-bromo-pirid-4-ilo
LXXIII-89	Cinamilo	2-fluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-90	4-clorocinamilo	2-fluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-91	4-fluorocinamilo	2-fluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-92	4-bromocinamilo	2-fluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-93	4-trifluorometilcinamilo	2-fluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-94	4-trifluorometoxicinamilo	2-fluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-95	4-pentafluoroetoxicinamilo	2-fluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-96	4-metoxicinamilo	2-fluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-97	4-etoxicinamilo	2-fluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-98	4-cianocinamilo	2-fluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-99	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	2-fluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-100	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	2-fluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-101	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	2-fluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-102	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	2-fluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-103	3,5-dicloro-cinamilo	2-fluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-104	5-fenil-penta-2,4-dienilo	2-fluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-105	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	2-fluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-106	3-naftalen-2-il-alilo	2-fluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-107	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	2-fluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-108	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	2-fluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-109	3-piridin-4-il-alilo	2-fluoro-pirid-4-ilo

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ⁸	R ¹
LXXIII-110	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	2-fluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-111	Cinamilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-112	4-clorocinamilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-113	4-fluorocinamilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-114	4-bromocinamilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-115	4-trifluorometilcinamilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-116	4-trifluorometoxicinamilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-117	4-pentafluoroetoxicinamilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-118	4-metoxicinamilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-119	4-etoxicinamilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-120	4-cianocinamilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-121	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-122	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-123	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-124	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-125	3,5-dicloro-cinamilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-126	5-fenil-penta-2,4-dienilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-127	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-128	3-naftalen-2-il-alilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-129	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-130	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-131	3-piridin-4-il-alilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-132	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	2,6-dibromo-pirid-4-ilo
LXXIII-133	Cinamilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo
LXXIII-134	4-clorocinamilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo
LXXIII-135	4-fluorocinamilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo
LXXIII-136	4-bromocinamilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo
LXXIII-137	4-trifluorometilcinamilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo
LXXIII-138	4-trifluorometoxicinamilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo
LXXIII-139	4-pentafluoroetoxicinamilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo
LXXIII-140	4-metoxicinamilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo
LXXIII-141	4-etoxicinamilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo
LXXIII-142	4-cianocinamilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo
LXXIII-143	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ⁸	R ¹
LXXIII-144	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo
LXXIII-145	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo
LXXIII-146	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo
LXXIII-147	3,5-dicloro-cinamilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo
LXXIII-148	5-fenil-penta-2,4-dienilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo
LXXIII-149	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo
LXXIII-150	3-naftalen-2-il-alilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo
LXXIII-151	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo
LXXIII-152	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo
LXXIII-153	3-piridin-4-il-alilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo
LXXIII-154	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	2-trifluorometil-pirid-4-ilo
LXXIII-155	Cinamilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-156	4-clorocinamilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-157	4-fluorocinamilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-158	4-bromocinamilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-159	4-trifluorometilcinamilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-160	4-trifluoromedioxicinamilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-161	4-pentafluoroetoxicinamilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-162	4-metoxicinamilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-163	4-etoxicinamilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-164	4-cianocinamilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-165	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-166	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-167	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-168	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-169	3,5-dicloro-cinamilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-170	5-fenil-penta-2,4-dienilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-171	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-172	3-naftalen-2-il-alilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-173	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-174	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-175	3-piridin-4-il-alilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-176	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	2,6-difluoro-pirid-4-ilo
LXXIII-177	Cinamilo	metilo

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ⁸	R ¹
LXXIII-178	4-clorocinamilo	metilo
LXXIII-179	4-fluorocinamilo	metilo
LXXIII-180	4-bromocinamilo	metilo
LXXIII-181	4-trifluorometilcinamilo	metilo
LXXIII-182	4-trifluorometoxicinamilo	metilo
LXXIII-183	4-pentafluoroetoxicinamilo	metilo
LXXIII-184	4-metoxicinamilo	metilo
LXXIII-185	4-etoxicinamilo	metilo
LXXIII-186	4-cianocinamilo	metilo
LXXIII-187	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	metilo
LXXIII-188	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	metilo
LXXIII-189	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	metilo
LXXIII-190	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	metilo
LXXIII-191	3,5-dicloro-cinamilo	metilo
LXXIII-192	5-fenil-penta-2,4-dienilo	metilo
LXXIII-193	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	metilo
LXXIII-194	3-naftalen-2-il-alilo	metilo
LXXIII-195	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	metilo
LXXIII-196	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	metilo
LXXIII-197	3-piridin-4-il-alilo	metilo
LXXIII-198	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	metilo
LXXIII-199	Cinamilo	metoxietilo
LXXIII-200	4-clorocinamilo	metoxietilo
LXXIII-201	4-fluorocinamilo	metoxietilo
LXXIII-202	4-bromocinamilo	metoxietilo
LXXIII-203	4-trifluorometilcinamilo	metoxietilo
LXXIII-204	4-trifluorometoxicinamilo	metoxietilo
LXXIII-205	4-pentafluoroetoxicinamilo	metoxietilo
LXXIII-206	4-metoxicinamilo	metoxietilo
LXXIII-207	4-etoxicinamilo	metoxietilo
LXXIII-208	4-cianocinamilo	metoxietilo
LXXIII-209	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	metoxietilo
LXXIII-210	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	metoxietilo
LXXIII-211	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	metoxietilo

ES 2 408 856 T3

Compuesto n°	R ⁸	R ¹
LXXIII-212	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	metoxietilo
LXXIII-213	3,5-dicloro-cinamilo	metoxietilo
LXXIII-214	5-fenil-penta-2,4-dienilo	metoxietilo
LXXIII-215	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	metoxietilo
LXXIII-216	3-naftalen-2-il-alilo	metoxietilo
LXXIII-217	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	metoxietilo
LXXIII-218	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	metoxietilo
LXXIII-219	3-piridin-4-il-alilo	metoxietilo
LXXIII-220	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	metoxietilo
LXXIII-221	Cinamilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-222	4-clorocinamilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-223	4-fluorocinamilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-224	4-bromocinamilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-225	4-trifluorometilcinamilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-226	4-trifluorometoxicinamilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-227	4-pentafluoroetoxicinamilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-228	4-metoxicinamilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-229	4-etoxicinamilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-230	4-cianocinamilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-231	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-232	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-233	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-234	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-235	3,5-dicloro-cinamilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-236	5-fenil-penta-2,4-dienilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-237	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-238	3-naftalen-2-il-alilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-239	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-240	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-241	3-piridin-4-il-alilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-242	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	2,2,2-trifluoroetilo
LXXIII-243	Cinamilo	metoxi
LXXIII-244	4-clorocinamilo	metoxi
LXXIII-245	4-fluorocinamilo	metoxi

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ⁸	R ¹
LXXIII-246	4-bromocinamilo	metoxi
LXXIII-247	4-trifluorometilcinamilo	metoxi
LXXIII-248	4-trifluorometoxicinamilo	metoxi
LXXIII-249	4-pentafluoroetoxicinamilo	metoxi
LXXIII-250	4-metoxicinamilo	metoxi
LXXIII-251	4-etoxicinamilo	metoxi
LXXIII-252	4-cianocinamilo	metoxi
LXXIII-253	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	metoxi
LXXIII-254	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	metoxi
LXXIII-255	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	metoxi
LXXIII-256	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	metoxi
LXXIII-257	3,5-dicloro-cinamilo	metoxi
LXXIII-258	5-fenil-penta-2,4-dienilo	metoxi
LXXIII-259	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	metoxi
LXXIII-260	3-naftalen-2-il-alilo	metoxi
LXXIII-261	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	metoxi
LXXIII-262	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	metoxi
LXXIII-263	3-piridin-4-il-alilo	metoxi
LXXIII-264	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	metoxi
LXXIII-265	Cinamilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo
LXXIII-266	4-clorocinamilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo
LXXIII-267	4-fluorocinamilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo
LXXIII-268	4-bromocinamilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo
LXXIII-269	4-trifluorometilcinamilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo
LXXIII-270	4-trifluorometoxicinamilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo
LXXIII-271	4-pentafluoroetoxicinamilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo
LXXIII-272	4-metoxicinamilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo
LXXIII-273	4-etoxicinamilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo
LXXIII-274	4-cianocinamilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo
LXXIII-275	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo
LXXIII-276	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo
LXXIII-277	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo
LXXIII-278	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo
LXXIII-279	3,5-dicloro-cinamilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ⁸	R ¹
LXXIII-280	5-fenil-penta-2,4-dienilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo
LXXIII-281	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo
LXXIII-282	3-naftalen-2-il-alilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo
LXXIII-283	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo
LXXIII-284	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo
LXXIII-285	3-piridin-4-il-alilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo
LXXIII-286	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo
LXXIII-287	Cinamilo	metoxipropilamino
LXXIII-288	4-clorocinamilo	metoxipropilamino
LXXIII-289	4-fluorocinamilo	metoxipropilamino
LXXIII-290	4-bromocinamilo	metoxipropilamino
LXXIII-291	4-trifluorometilcinamilo	metoxipropilamino
LXXIII-292	4-trifluorometoxicinamilo	metoxipropilamino
LXXIII-293	4-pentafluoroetoxicinamilo	metoxipropilamino
LXXIII-294	4-metoxicinamilo	metoxipropilamino
LXXIII-295	4-etoxicinamilo	metoxipropilamino
LXXIII-296	4-cianocinamilo	metoxipropilamino
LXXIII-297	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	metoxipropilamino
LXXIII-298	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	metoxipropilamino
LXXIII-299	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	metoxipropilamino
LXXIII-300	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	metoxipropilamino
LXXIII-301	3,5-dicloro-cinamilo	metoxipropilamino
LXXIII-302	5-fenil-penta-2,4-dienilo	metoxipropilamino
LXXIII-303	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	metoxipropilamino
LXXIII-304	3-naftalen-2-il-alilo	metoxipropilamino
LXXIII-305	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	metoxipropilamino
LXXIII-306	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	metoxipropilamino
LXXIII-307	3-piridin-4-il-alilo	metoxipropilamino
LXXIII-308	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	metoxipropilamino
LXXIII-309	Cinamilo	2-cloro-tiazol-5-ilo
LXXIII-310	4-clorocinamilo	2-cloro-tiazol-5-ilo
LXXIII-311	4-fluorocinamilo	2-cloro-tiazol-5-ilo
LXXIII-312	4-bromocinamilo	2-cloro-tiazol-5-ilo
LXXIII-313	4-trifluorometilcinamilo	2-cloro-tiazol-5-ilo

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ⁸	R ¹
LXXIII-314	4-trifluorometoxicinamilo	2-cloro-tiazol-5-ilo
LXXIII-315	4-pentafluoroetoxicinamilo	2-cloro-tiazol-5-ilo
LXXIII-316	4-metoxicinamilo	2-cloro-tiazol-5-ilo
LXXIII-317	4-etoxicinamilo	2-cloro-tiazol-5-ilo
LXXIII-318	4-cianocinamilo	2-cloro-tiazol-5-ilo
LXXIII-319	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	2-cloro-tiazol-5-ilo
LXXIII-320	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	2-cloro-tiazol-5-ilo
LXXIII-321	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	2-cloro-tiazol-5-ilo
LXXIII-322	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	2-cloro-tiazol-5-ilo
LXXIII-323	3,5-dicloro-cinamilo	2-cloro-tiazol-5-ilo
LXXIII-324	5-fenil-penta-2,4-dienilo	2-cloro-tiazol-5-ilo
LXXIII-325	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	2-cloro-tiazol-5-ilo
LXXIII-326	3-naftalen-2-il-alilo	2-cloro-tiazol-5-ilo
LXXIII-327	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	2-cloro-tiazol-5-ilo
LXXIII-328	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	2-cloro-tiazol-5-ilo
LXXIII-329	3-piridin-4-il-alilo	2-cloro-tiazol-5-ilo
LXXIII-330	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	2-cloro-tiazol-5-ilo
LXXIII-331	Cinamilo	<i>i</i> -propilamino
LXXIII-332	4-clorocinamilo	<i>i</i> -propilamino
LXXIII-333	4-fluorocinamilo	<i>i</i> -propilamino
LXXIII-334	4-bromocinamilo	<i>i</i> -propilamino
LXXIII-335	4-trifluorometilcinamilo	<i>i</i> -propilamino
LXXIII-336	4-trifluorometoxicinamilo	<i>i</i> -propilamino
LXXIII-337	4-pentafluoroetoxicinamilo	<i>i</i> -propilamino
LXXIII-338	4-metoxicinamilo	<i>i</i> -propilamino
LXXIII-339	4-etoxicinamilo	<i>i</i> -propilamino
LXXIII-340	4-cianocinamilo	<i>i</i> -propilamino
LXXIII-341	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	<i>i</i> -propilamino
LXXIII-342	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	<i>i</i> -propilamino
LXXIII-343	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	<i>i</i> -propilamino
LXXIII-344	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	<i>i</i> -propilamino
LXXIII-345	3,5-dicloro-cinamilo	<i>i</i> -propilamino
LXXIII-346	5-fenil-penta-2,4-dienilo	<i>i</i> -propilamino
LXXIII-347	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	<i>i</i> -propilamino

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ⁸	R ¹
LXXIII-348	3-naftalen-2-il-alilo	<i>i</i> -propilamino
LXXIII-349	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	<i>i</i> -propilamino
LXXIII-350	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	<i>i</i> -propilamino
LXXIII-351	3-piridin-4-il-alilo	<i>i</i> -propilamino
LXXIII-352	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	<i>i</i> -propilamino
LXXIII-353	Cinamilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-354	4-clorocinamilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-355	4-fluorocinamilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-356	4-bromocinamilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-357	4-trifluorometilcinamilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-358	4-trifluorometoxicinamilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-359	4-pentafluoroetoxicinamilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-360	4-metoxicinamilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-361	4-etoxicinamilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-362	4-cianocinamilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-363	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-364	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-365	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-366	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-367	3,5-dicloro-cinamilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-368	5-fenil-penta-2,4-dienilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-369	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-370	3-naftalen-2-il-alilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-371	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-372	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-373	3-piridin-4-il-alilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-374	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	1,3-dioxolan-2-il-etilamino
LXXIII-375	Cinamilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino
LXXIII-376	4-clorocinamilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino
LXXIII-377	4-fluorocinamilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino
LXXIII-378	4-bromocinamilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino
LXXIII-379	4-trifluorometilcinamilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino
LXXIII-380	4-trifluorometoxicinamilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino
LXXIII-381	4-pentafluoroetoxicinamilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino

Compuesto n ^o	R ⁸	R ¹
LXXIII-382	4-metoxicinamilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino
LXXIII-383	4-etoxicinamilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino
LXXIII-384	4-cianocinamilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino
LXXIII-385	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino
LXXIII-386	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino
LXXIII-387	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino
LXXIII-388	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino
LXXIII-389	3,5-dicloro-cinamilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino
LXXIII-390	5-fenil-penta-2,4-dienilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino
LXXIII-391	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino
LXXIII-392	3-naftalen-2-il-alilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino
LXXIII-393	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino
LXXIII-394	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino
LXXIII-395	3-piridin-4-il-alilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino
LXXIII-396	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	2-cloro-pirid-4-il-metilamino
LXXIII-397	Cinamilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino
LXXIII-398	4-clorocinamilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino
LXXIII-399	4-fluorocinamilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino
LXXIII-400	4-bromocinamilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino
LXXIII-401	4-trifluorometilcinamilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino
LXXIII-402	4-trifluorometoxicinamilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino
LXXIII-403	4-pentafluoroetoxicinamilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino
LXXIII-404	4-metoxicinamilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino
LXXIII-405	4-etoxicinamilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino
LXXIII-406	4-cianocinamilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino
LXXIII-407	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino
LXXIII-408	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino
LXXIII-409	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino
LXXIII-410	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino
LXXIII-411	3,5-dicloro-cinamilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino
LXXIII-412	5-fenil-penta-2,4-dienilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino
LXXIII-413	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino
LXXIII-414	3-naftalen-2-il-alilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino
LXXIII-415	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino

ES 2 408 856 T3

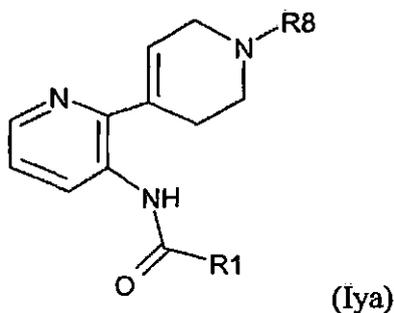
Compuesto n ^o	R ⁸	R ¹
LXXIII-416	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino
LXXIII-417	3-piridin-4-il-alilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino
LXXIII-418	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	2-trifluorometil-pirid-5-il-metilamino
LXXIII-419	Cinamilo	metilamino
LXXIII-420	4-clorocinamilo	metilamino
LXXIII-421	4-fluorocinamilo	metilamino
LXXIII-422	4-bromocinamilo	metilamino
LXXIII-423	4-trifluorometilcinamilo	metilamino
LXXIII-424	4-trifluorometoxicinamilo	metilamino
LXXIII-425	4-pentafluoroetoxicinamilo	metilamino
LXXIII-426	4-metoxicinamilo	metilamino
LXXIII-427	4-etoxicinamilo	metilamino
LXXIII-428	4-cianocinamilo	metilamino
LXXIII-429	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	metilamino
LXXIII-430	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	metilamino
LXXIII-431	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	metilamino
LXXIII-432	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	metilamino
LXXIII-433	3,5-dicloro-cinamilo	metilamino
LXXIII-434	5-fenil-penta-2,4-dienilo	metilamino
LXXIII-435	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	metilamino
LXXIII-436	3-naftalen-2-il-alilo	metilamino
LXXIII-437	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	metilamino
LXXIII-438	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	metilamino
LXXIII-439	3-piridin-4-il-alilo	metilamino
LXXIII-440	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	metilamino
LXXIII-441	Cinamilo	etilamino
LXXIII-442	4-clorocinamilo	etilamino
LXXIII-443	4-fluorocinamilo	etilamino
LXXIII-444	4-bromocinamilo	etilamino
LXXIII-445	4-trifluorometilcinamilo	etilamino
LXXIII-446	4-trifluorometoxicinamilo	etilamino
LXXIII-447	4-pentafluoroetoxicinamilo	etilamino
LXXIII-448	4-metoxicinamilo	etilamino
LXXIII-449	4-etoxicinamilo	etilamino

ES 2 408 856 T3

Compuesto n ^o	R ⁸	R ¹
LXXIII-450	4-cianocinamilo	etilamino
LXXIII-451	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	etilamino
LXXIII-452	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	etilamino
LXXIII-453	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	etilamino
LXXIII-454	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	etilamino
LXXIII-455	3,5-dicloro-cinamilo	etilamino
LXXIII-456	5-fenil-penta-2,4-dienilo	etilamino
LXXIII-457	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	etilamino
LXXIII-458	3-naftalen-2-il-alilo	etilamino
LXXIII-459	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	etilamino
LXXIII-460	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	etilamino
LXXIII-461	3-piridin-4-il-alilo	etilamino
LXXIII-462	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	etilamino
LXXIII-463	Cinamilo	2-cloro-pirid-4-il-amino
LXXIII-464	4-clorocinamilo	2-cloro-pirid-4-il-amino
LXXIII-465	4-fluorocinamilo	2-cloro-pirid-4-il-amino
LXXIII-466	4-bromocinamilo	2-cloro-pirid-4-il-amino
LXXIII-467	4-trifluorometilcinamilo	2-cloro-pirid-4-il-amino
LXXIII-468	4-trifluorometoxicinamilo	2-cloro-pirid-4-il-amino
LXXIII-469	4-pentafluoroetoxicinamilo	2-cloro-pirid-4-il-amino
LXXIII-470	4-metoxicinamilo	2-cloro-pirid-4-il-amino
LXXIII-471	4-etoxicinamilo	2-cloro-pirid-4-il-amino
LXXIII-472	4-cianocinamilo	2-cloro-pirid-4-il-amino
LXXIII-473	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	2-cloro-pirid-4-il-amino
LXXIII-474	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	2-cloro-pirid-4-il-amino
LXXIII-475	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	2-cloro-pirid-4-il-amino
LXXIII-476	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	2-cloro-pirid-4-il-amino
LXXIII-477	3,5-dicloro-cinamilo	2-cloro-pirid-4-il-amino
LXXIII-478	5-fenil-penta-2,4-dienilo	2-cloro-pirid-4-il-amino
LXXIII-479	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	2-cloro-pirid-4-il-amino
LXXIII-480	3-naftalen-2-il-alilo	2-cloro-pirid-4-il-amino
LXXIII-481	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	2-cloro-pirid-4-il-amino
LXXIII-482	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	2-cloro-pirid-4-il-amino
LXXIII-483	3-piridin-4-il-alilo	2-cloro-pirid-4-il-amino

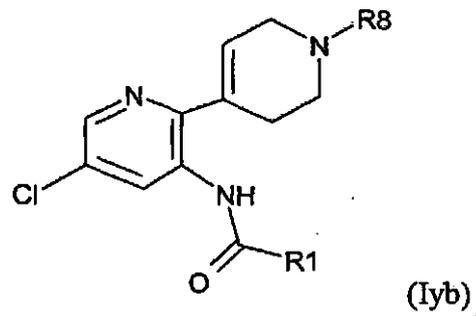
Compuesto n ^o	R ⁸	R ¹
LXXIII-484	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	2-cloro-pirid-4-il-amino
LXXIII-485	Cinamilo	metoxietilamino
LXXIII-486	4-clorocinamilo	metoxietilamino
LXXIII-487	4-fluorocinamilo	metoxietilamino
LXXIII-488	4-bromocinamilo	metoxietilamino
LXXIII-489	4-trifluorometilcinamilo	metoxietilamino
LXXIII-490	4-trifluorometoxicinamilo	metoxietilamino
LXXIII-491	4-pentafluoroetoxicinamilo	metoxietilamino
LXXIII-492	4-metoxicinamilo	metoxietilamino
LXXIII-493	4-etoxicinamilo	metoxietilamino
LXXIII-494	4-cianocinamilo	metoxietilamino
LXXIII-495	3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo	metoxietilamino
LXXIII-496	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	metoxietilamino
LXXIII-497	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo	metoxietilamino
LXXIII-498	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	metoxietilamino
LXXIII-499	3,5-dicloro-cinamilo	metoxietilamino
LXXIII-500	5-fenil-penta-2,4-dienilo	metoxietilamino
LXXIII-501	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	metoxietilamino
LXXIII-502	3-naftalen-2-il-alilo	metoxietilamino
LXXIII-503	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo	metoxietilamino
LXXIII-504	3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo	metoxietilamino
LXXIII-505	3-piridin-4-il-alilo	metoxietilamino
LXXIII-506	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-alilo	metoxietilamino

La tabla LXXIV proporciona 506 compuestos de fórmula Iya



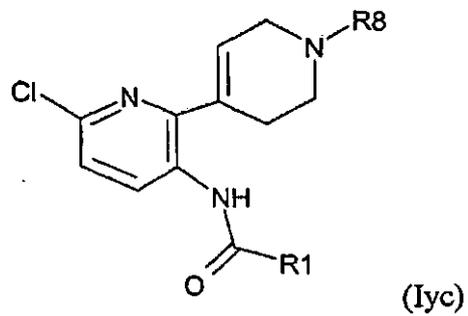
en la que los valores de R⁸ y R¹ se dan en la tabla 73.

5 La tabla LXXV proporciona 506 compuestos de fórmula Iyb



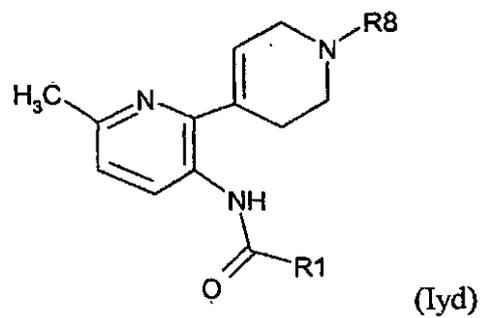
en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

La tabla LXXVI proporciona 506 compuestos de fórmula Iyc



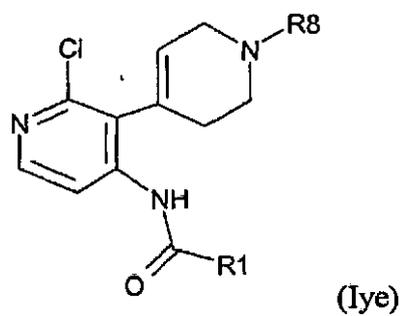
5 en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

La tabla LXXVII proporciona 506 compuestos de fórmula Iyd



en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

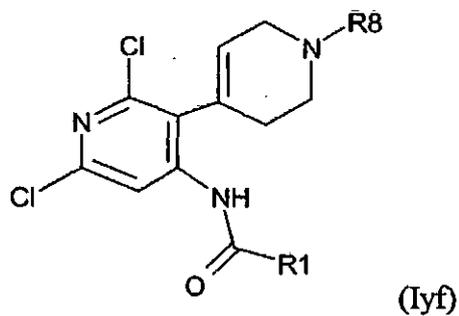
La tabla LXXVIII proporciona 506 compuestos de fórmula Iye



10

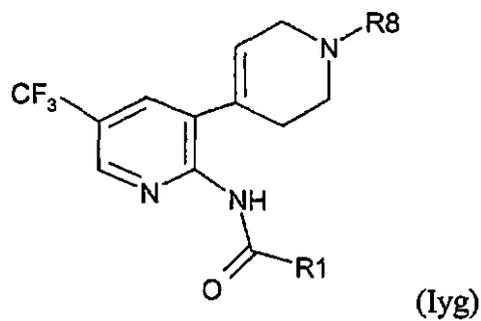
en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

La tabla LXXIX proporciona 506 compuestos de fórmula Iyf



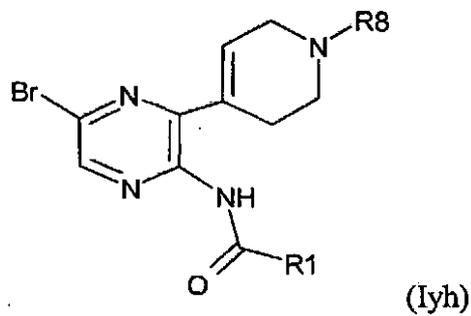
en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

La tabla LXXX proporciona 506 compuestos de fórmula Iyg



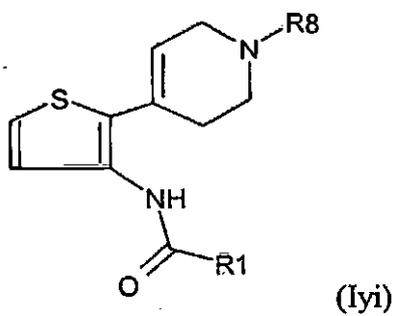
5 en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

La tabla LXXXI proporciona 506 compuestos de fórmula Iyh



en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

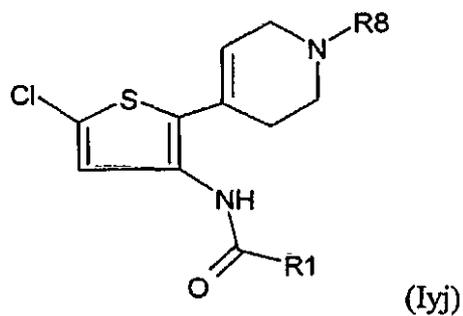
La tabla LXXXII proporciona 506 compuestos de fórmula Iyi



10

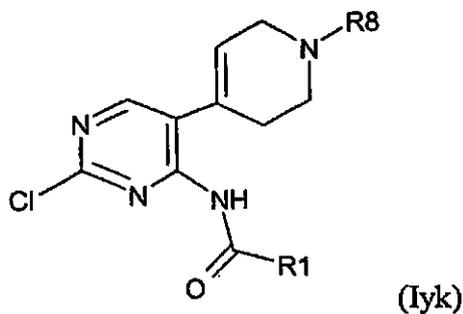
en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

La tabla LXXXIII proporciona 506 compuestos de fórmula Iyj



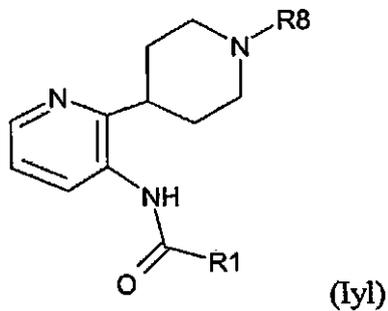
en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

La tabla LXXXIV proporciona 506 compuestos de fórmula Iyk



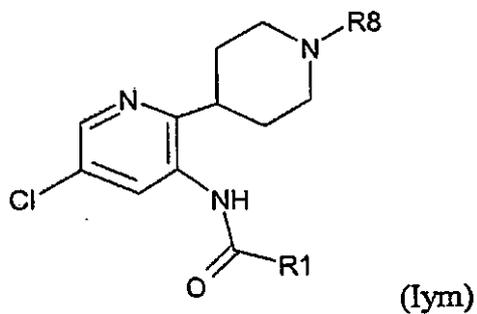
5 en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

La tabla LXXXV proporciona 506 compuestos de fórmula Iyl



en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

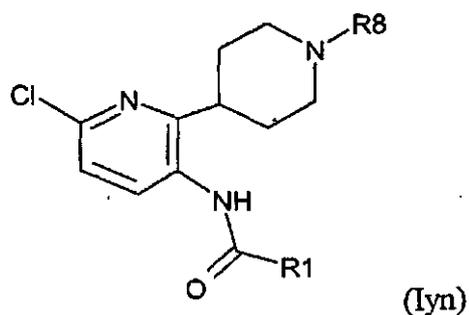
La tabla LXXXVI proporciona 506 compuestos de fórmula Iym



10

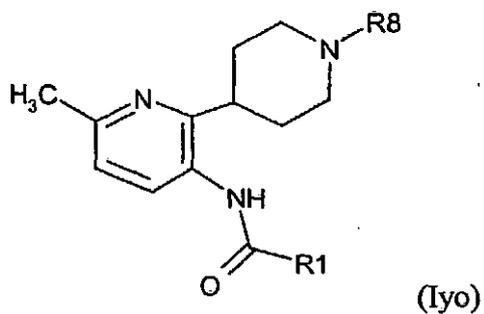
en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

La tabla LXXXVII proporciona 506 compuestos de fórmula Iyn



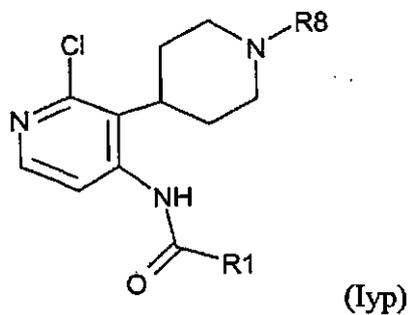
en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

La tabla LXXXVIII proporciona 506 compuestos de fórmula Iyo



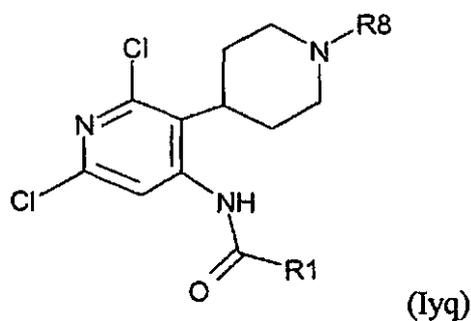
5 en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

La tabla LXXXIX proporciona 506 compuestos de fórmula Iyp



en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

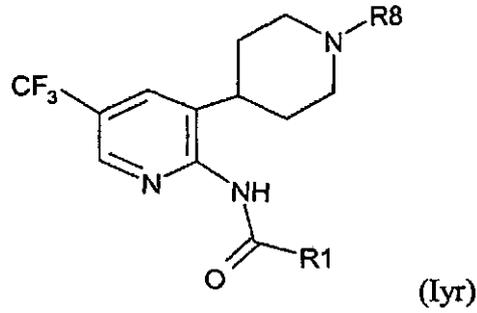
La tabla XC proporciona 506 compuestos de fórmula Iyq



10

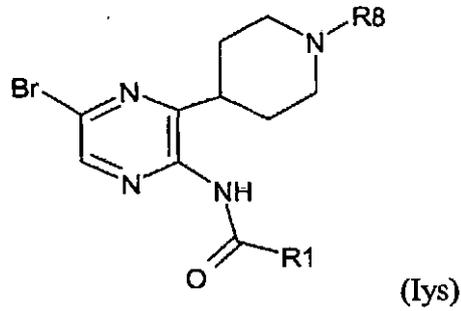
en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

La tabla XCI proporciona 506 compuestos de fórmula Iyr



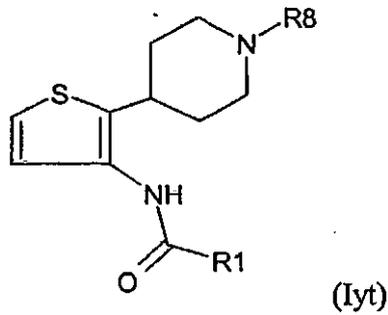
en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

La tabla XCII proporciona 506 compuestos de fórmula lys



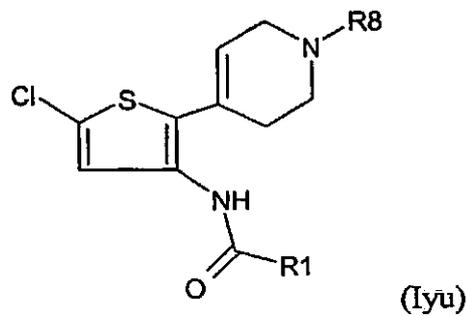
5 en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

La tabla XCIII proporciona 506 compuestos de fórmula lyt



en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

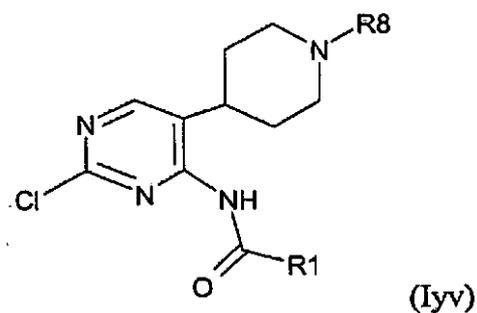
La tabla XCIV proporciona 506 compuestos de fórmula lyu



10

en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

La tabla XCV proporciona 506 compuestos de fórmula lyv



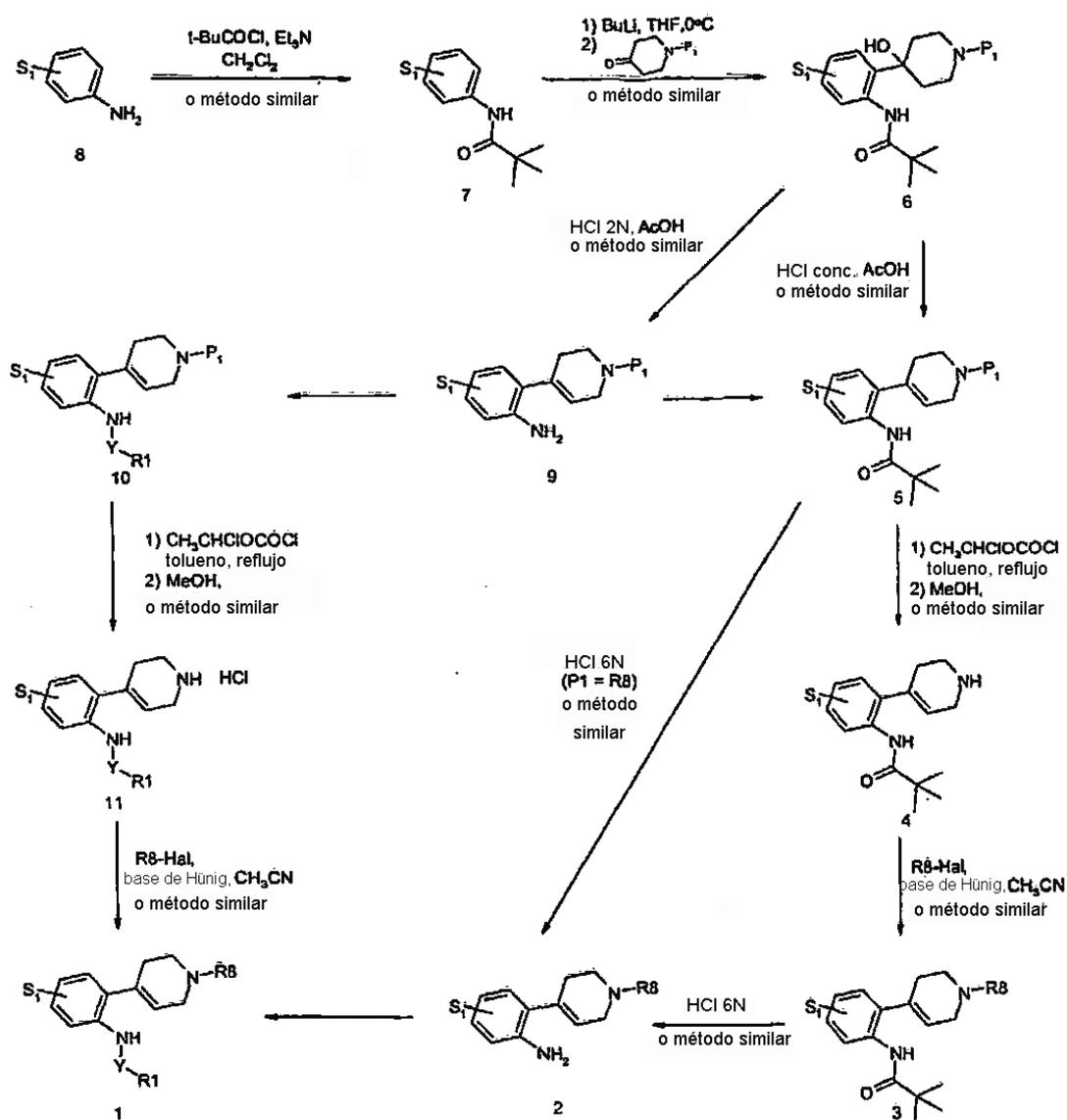
en la que los valores de R^8 y R^1 se dan en la tabla 73.

Los compuestos de la invención se pueden obtener mediante una variedad de métodos.

Por ejemplo, los compuestos tetrahidropiridílicos de la fórmula general 1 se pueden preparar según las reacciones del Esquema 1.

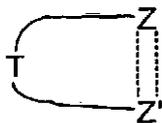
5

Esquema 1



P_1 es R^8 o es un grupo protector adecuado, por ejemplo un grupo tal como BOC, bencilo o alquilo, y S_1 es el grupo $(R^4)_n$.

La ruta sintética en el Esquema 1 también se puede usar para la preparación de algunos compuestos de fórmula 1 en la que el anillo



es un anillo aromático de 5 ó 6 miembros en lugar del grupo fenilo.

- 5 De este modo, un compuesto de fórmula 1 se puede obtener a partir de un compuesto de fórmula 2 mediante reacción con una especie electrófila adecuada. Los compuestos de fórmula 1 en la que Y es un grupo carbonilo se pueden formar mediante la reacción de compuestos de fórmula 2 con un derivado de ácido carboxílico de fórmula $R^1-C(O)-Z'$, en la que Z' es cloruro, hidroxilo, alcoxi o aciloxi, a una temperatura entre $0^\circ C$ y $150^\circ C$, opcionalmente en un disolvente orgánico tal como diclorometano, cloroformo o 1,2-dicloroetano, opcionalmente en presencia de una base de amina terciaria tal como trietilamina o diisopropilamina, y opcionalmente en presencia de un agente de acoplamiento tal como diciclohexilcarbodiimida. Los compuestos de fórmula 1 en la que Y es un grupo carbonilo y R^1 es un sustituyente amino de fórmula R^1-NH- se pueden formar mediante la reacción de compuestos de fórmula 2 con un isocianato de fórmula $R^1-N=C=O$ en condiciones similares. Los compuestos de fórmula 1 en la que Y es un grupo de fórmula $S(O)_m$ se pueden formar a partir de compuestos de fórmula 2 mediante tratamiento con compuestos de fórmula $R^1-S(O)_m-Cl$ en condiciones similares. Los compuestos de fórmula 1 en la que Y es un grupo tiocarbonilo y R^1 es un sustituyente amino de fórmula R^1-NH- se pueden formar mediante la reacción de compuestos de fórmula 2 con un isotiocianato de fórmula $R^1-N=C=S$ en condiciones similares.

- 15 Como alternativa, los compuestos de fórmula 1 en la que Y es un grupo tiocarbonilo y R^1 es un sustituyente de carbono se pueden formar mediante tratamiento de compuestos de fórmula 1 en la que Y es un grupo carbonilo y R^1 es un sustituyente de carbono con un agente tionante adecuado tal como el reactivo de Lawesson.

- 20 En los procedimientos anteriores, los derivados de ácido de la fórmula $R^1-C(O)-Z'$, isocianatos de fórmula $R^1-N=C=O$, isotiocianatos de fórmula $R^1-N=C=S$ y electrófilos de azufre de fórmula $R^1-S(O)_m-Cl$ son compuestos conocidos o se pueden formar a partir de compuestos conocidos mediante métodos conocidos por una persona experta en la técnica.

- 25 Los compuestos de fórmula 2 se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula 3 mediante escisión del enlace amídico, según métodos conocidos por una persona experta en la técnica.

- Como alternativa, los compuestos de fórmula 2 se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula 5 en los que $P1$ es R^8 mediante escisión del enlace amídico, según métodos conocidos por una persona experta en la técnica.

- 30 Los compuestos de fórmula 3 se pueden obtener a partir de compuestos de fórmula 4 mediante reacción con un agente alquilante de la fórmula R^8-L , en la que L es cloruro, bromuro, yoduro o un sulfonato (por ejemplo mesilato o tosilato) o un grupo saliente similar, a una temperatura entre la temperatura ambiente y $100^\circ C$, típicamente $65^\circ C$, en un disolvente orgánico tal como diclorometano, cloroformo o 1,2-dicloroetano, en presencia de una base de amina terciaria tal como trietilamina o diisopropilamina, y opcionalmente catalizada por sales de haluro tales como yoduro de sodio, yoduro de potasio o yoduro de tetrabutilamonio. Como alternativa, un compuesto de fórmula 4 se puede hacer reaccionar con un aldehído de la fórmula R^8-CHO a una temperatura entre la temperatura ambiente y $100^\circ C$ en un disolvente orgánico tal como tetrahidrofurano o etanol, o mezclas de disolventes, en presencia de un agente reductor tal como complejo de borano con piridina, borohidruro de sodio, (triacetoxi)borohidruro de sodio, cianoborohidruro de sodio o similar, para producir un compuesto de fórmula 3 en la que R^8 es CH_2-R .

- 35 Los compuestos de fórmula 4 se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula 5 en la que $P1$ es bencilo o alquilo mediante reacción de desalquilación, según métodos conocidos por una persona experta en la técnica. Los compuestos de fórmula 4 se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula 5 en la que $P1$ es BOC mediante tratamiento con un ácido tal como CF_3COOH , según métodos conocidos por una persona experta en la técnica.

- 40 Como alternativa, los compuestos de fórmula 4 se pueden formar mediante la reacción de compuestos de fórmula 6 en la que $P1$ es BOC mediante tratamiento con HCl o H_2SO_4 en $AcOH$ a una temperatura entre $0^\circ C$ y $150^\circ C$, opcionalmente en un disolvente orgánico inerte.

- 45 Los compuestos de fórmula 5 se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula 6 en la que $P1$ es bencilo o alquilo mediante una reacción de eliminación de H_2O , según métodos conocidos por una persona experta en la técnica. Lo más favorable es el tratamiento de un compuesto de fórmula 6 con HCl o H_2SO_4 conc. en $AcOH$ a una temperatura entre $0^\circ C$ y $150^\circ C$.

- 50 Como alternativa, los compuestos de fórmula 5 se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula 6 mediante tratamiento con $SOCl_2$, según métodos conocidos por una persona experta en la técnica.

Como alternativa, los compuestos de fórmula 5 se pueden formar mediante la reacción de compuestos de fórmula 9 con un derivado de ácido carboxílico de fórmula t-Bu-C(O)-Z", en la que Z" es cloruro, hidroxilo, alcoxi o aciloxi, a una temperatura entre 0°C y 150°C, opcionalmente en un disolvente orgánico inerte.

5 Los compuestos de fórmula 6 se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula 7 mediante tratamiento de compuestos litiados de fórmula 7 con una piperidinona, a una temperatura entre -100°C y 0°C, opcionalmente en un disolvente orgánico inerte, según métodos conocidos por una persona experta en la técnica.

Los compuestos de fórmula 7 y fórmula 8 son conocidos o se pueden obtener a partir de compuestos conocidos mediante métodos conocidos.

10 Como alternativa, los compuestos de fórmula 1 se pueden formar mediante alquilación de compuestos de fórmula 11 como se describe anteriormente para compuestos de fórmula 3.

Los compuestos de fórmula 11 se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula 10 en la que P1 es bencilo o alquilo mediante una reacción de desalquilación, según métodos conocidos por una persona experta en la técnica.

Los compuestos de fórmula 10 se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula 9 mediante métodos descritos anteriormente para la conversión de compuestos de fórmula 2 a compuestos de fórmula 1.

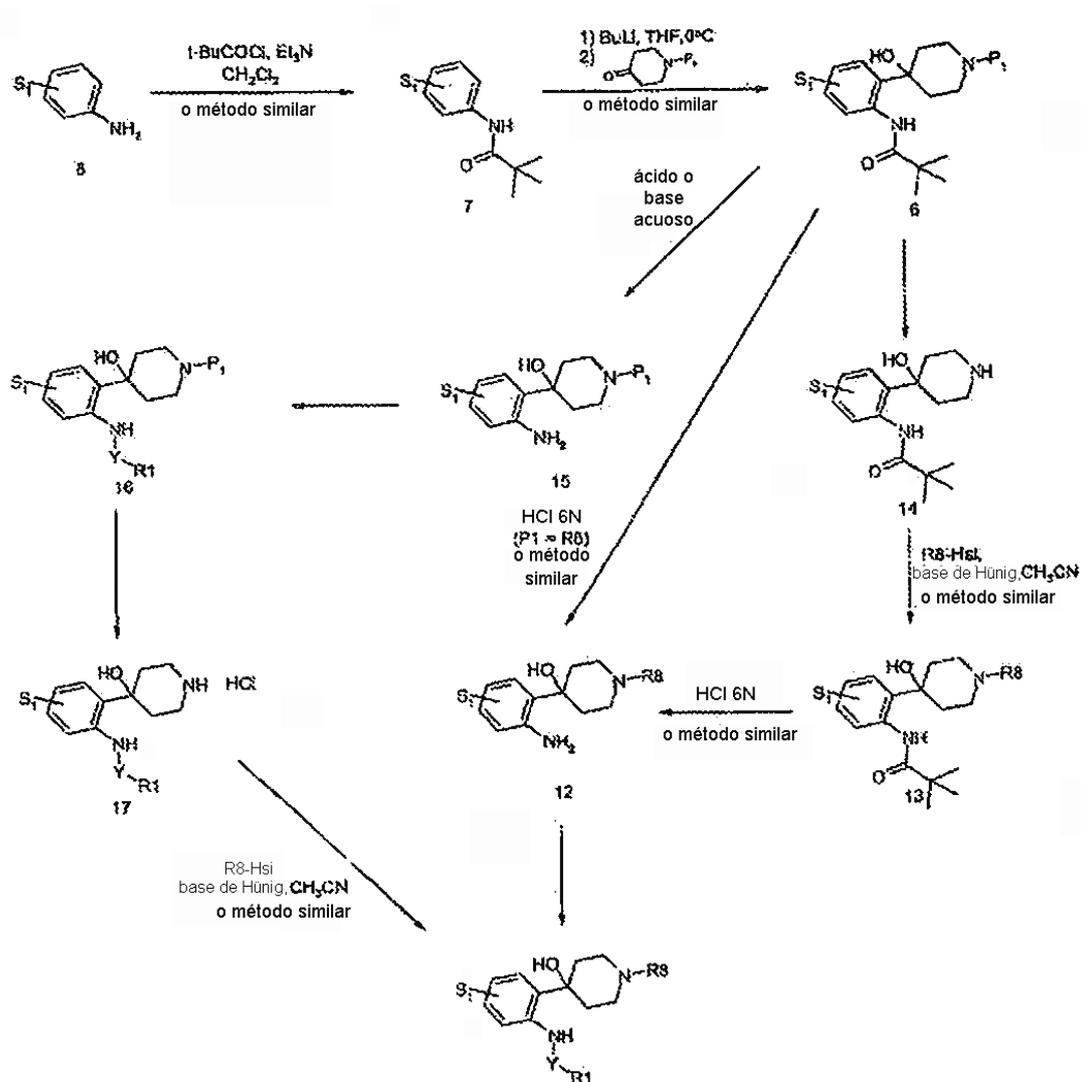
15 Los compuestos de fórmula 9 se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula 6 mediante una reacción de eliminación de H₂O, según métodos conocidos por una persona experta en la técnica. Lo más favorable es el tratamiento de un compuesto de fórmula 6 con HCl o H₂SO₄ acuoso en AcOH a una temperatura entre 0°C y 150°C, o con una base en H₂O y un disolvente apropiado.

20 Ciertos compuestos de fórmula 2, fórmula 3, fórmula 4, fórmula 5, fórmula 6, fórmula 9, fórmula 10 y fórmula 11 son nuevos.

Los compuestos 4-hidroxipiperidinílicos de la fórmula general 1 se pueden preparar según las reacciones del Esquema 2 usando metodologías sintéticas conocidas por una persona experta en la técnica y como se describe anteriormente.

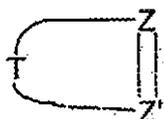
Esquema 2 a continuación

Esquema 2



P1 es R8, o es un grupo protector adecuado, por ejemplo un grupo tal como BOC, bencilo o alquilo, y S₁ es el grupo (R⁴)_n.

5 La ruta sintética mostrada en el Esquema 2 también se puede usar para la preparación de algunos compuestos de fórmula I en la que el anillo

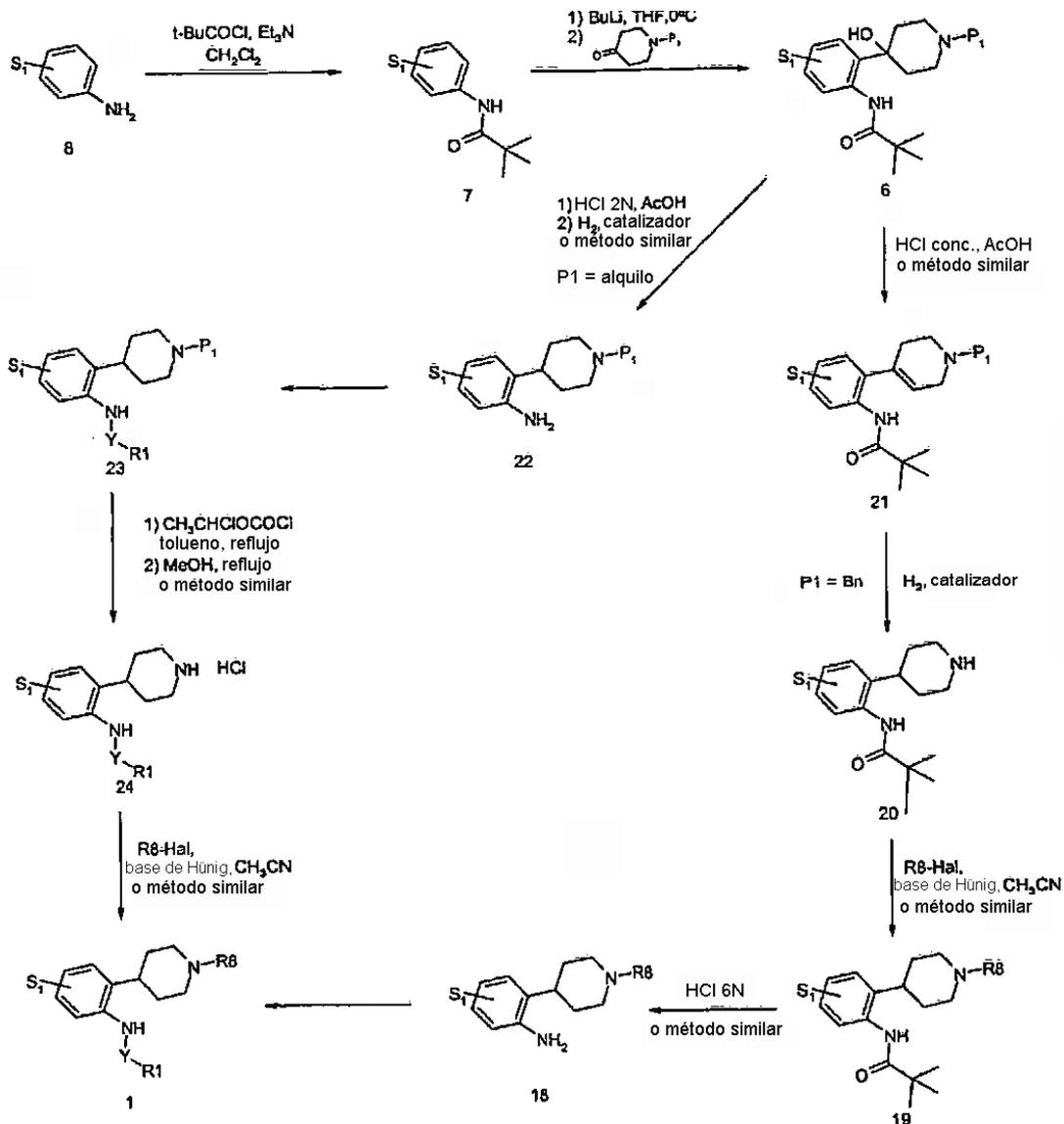


es un anillo heteroaromático de 5 ó 6 miembros en lugar del grupo fenilo.

Ciertos compuestos de fórmula 12, fórmula 13, fórmula 14, fórmula 15, fórmula 16, y fórmula 17 son nuevos.

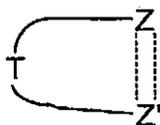
10 Los compuestos piperidínicos de la fórmula general 1 se pueden preparar según las reacciones del Esquema 3 usando metodologías sintéticas conocidas por una persona experta en la técnica y como se describe anteriormente.

Esquema 3



P1 es R8, o es un grupo protector adecuado, por ejemplo un grupo tal como BOC, bencilo o alquilo, y S₁ es el grupo (R⁴)_n.

5 La ruta sintética mostrada en el Esquema 3 también se puede usar para la preparación de algunos compuestos de fórmula I en la que el anillo



es un anillo heteroaromático de 5 ó 6 miembros en lugar del grupo fenilo.

Ciertos compuestos de fórmula 18, fórmula 19, fórmula 20, fórmula 21, fórmula 22, fórmula 23 y fórmula 24 son nuevos.

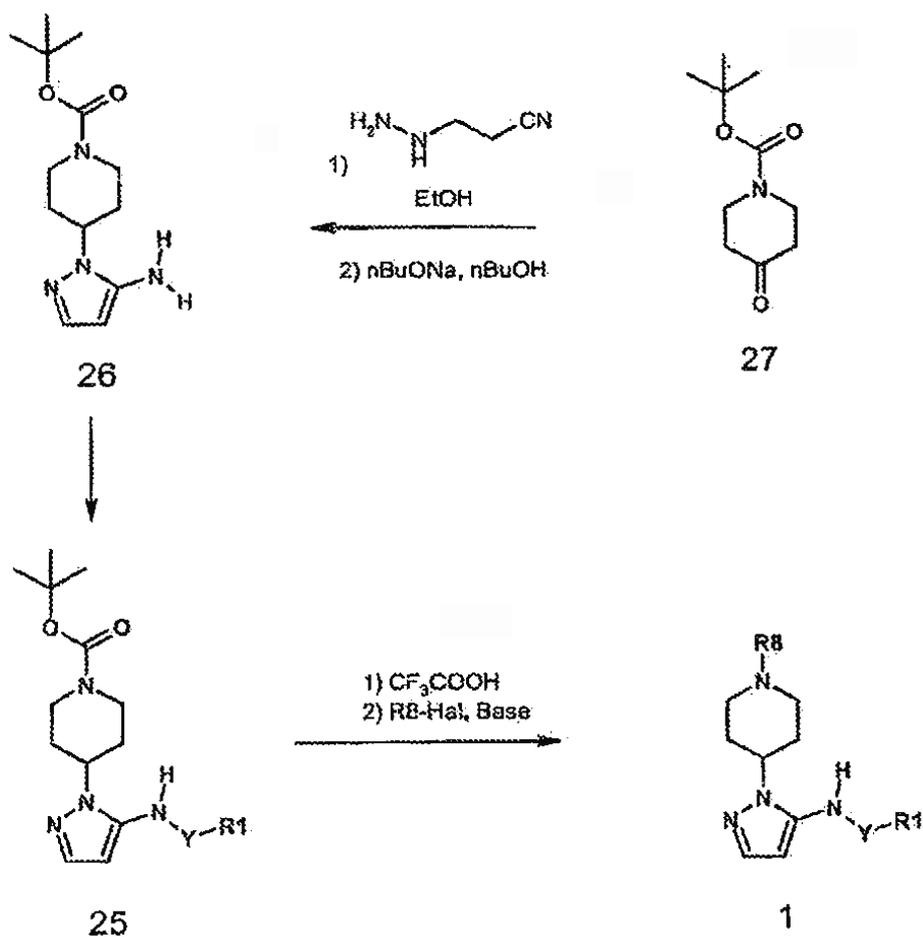
10 Los compuestos en los que el anillo



es un anillo heteroaromático de 5 ó 6 miembros en lugar del grupo fenilo se pueden preparar mediante rutas sintéticas mostradas en el Esquema 1-3, o mediante muchas otras rutas y métodos conocidos por una persona experta en la técnica. Por ejemplo, los derivados de 2H-pirazol-3-ilo se pueden preparar como se muestra en el Esquema 4.

5

Esquema 4

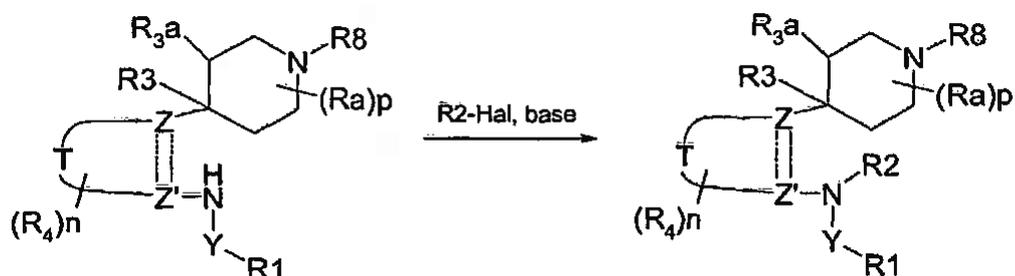


Ciertos compuestos de fórmula 25 son nuevos.

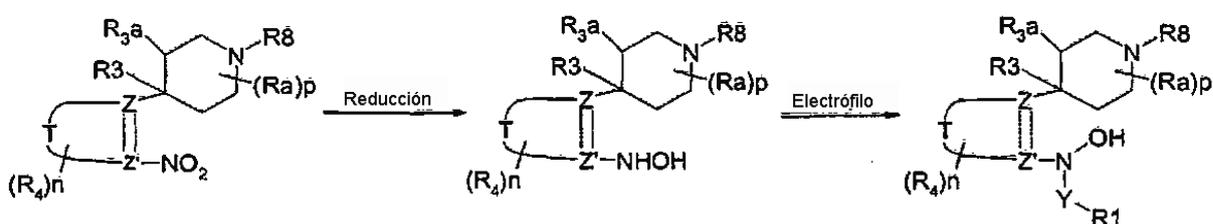
La persona experta reconocerá fácilmente que es posible convertir un compuesto de fórmula 1, en la que R2 es H o un intermedio de los Esquemas 1-4, en otros compuestos de fórmula I o sus intermedios. Los ejemplos de tales transformaciones se dan en los Esquemas 5, 6 y 7, en los que los grupos R tienen los significados como se definen para un compuesto de fórmula I anterior.

10

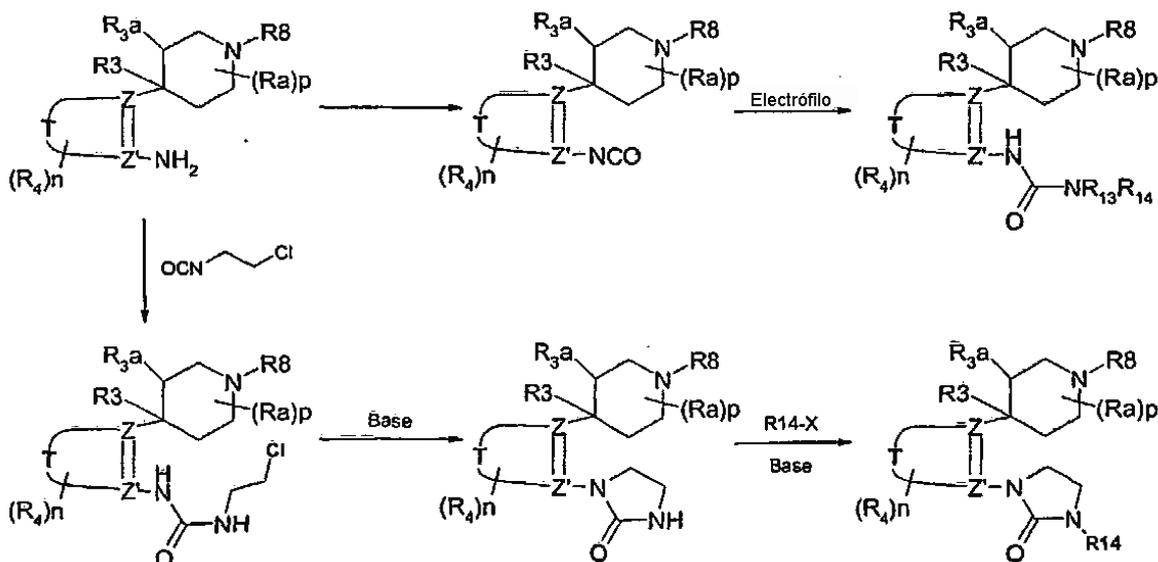
Esquema 5



Esquema 6



Esquema 7



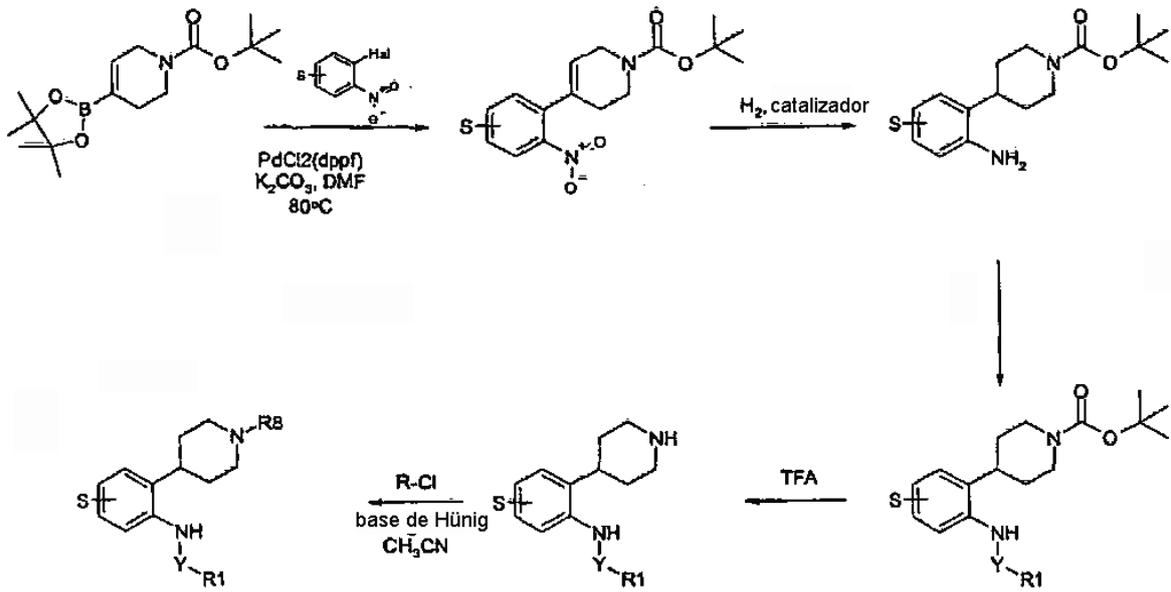
5

Como alternativa, los derivados piperidinil-anilina de la fórmula general 1 se pueden preparar según las reacciones de los Esquemas 8-13, en los que S es el grupo $(R^4)_n$, usando metodologías sintéticas conocidas por una persona experta en la técnica y como se describe anteriormente.

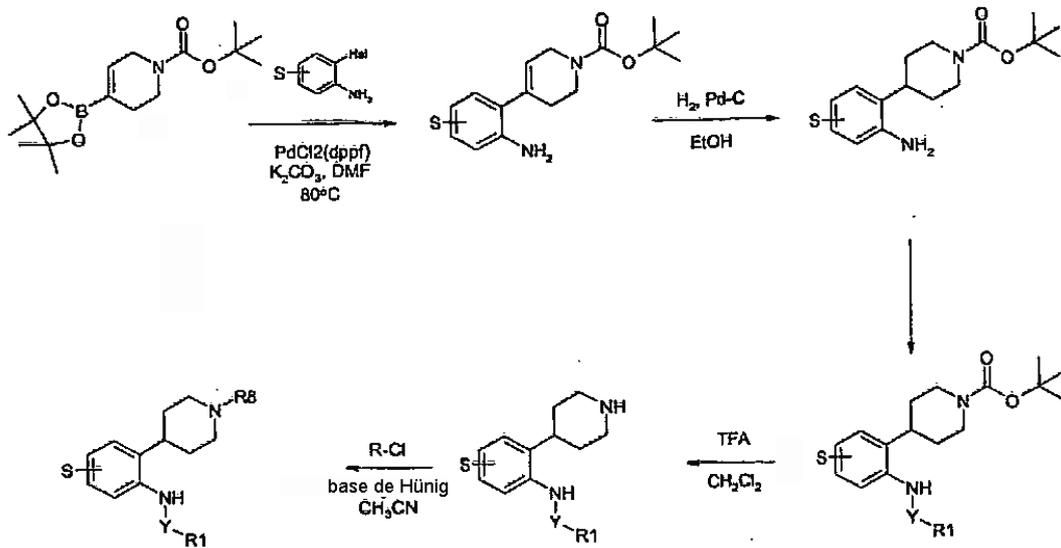
10

Una etapa clave en estas rutas sintéticas es una reacción de acoplamiento de Suzuki para preparar derivados de tetrahidropiridin-4-il-anilina. Igualmente se pueden aplicar otras reacciones de acoplamiento cruzado, tales como los acoplamientos de Stille y Negishi. Los reactivos de boronato se pueden preparar como se describe en la bibliografía; por ejemplo P.R Eastwood, THL 41, 3705 (2000). Los ejemplos de reacciones de acoplamiento se dan en los Ejemplos 21-23, que describen la síntesis de los compuestos en las Tablas EJ23.1-EJ23.11.

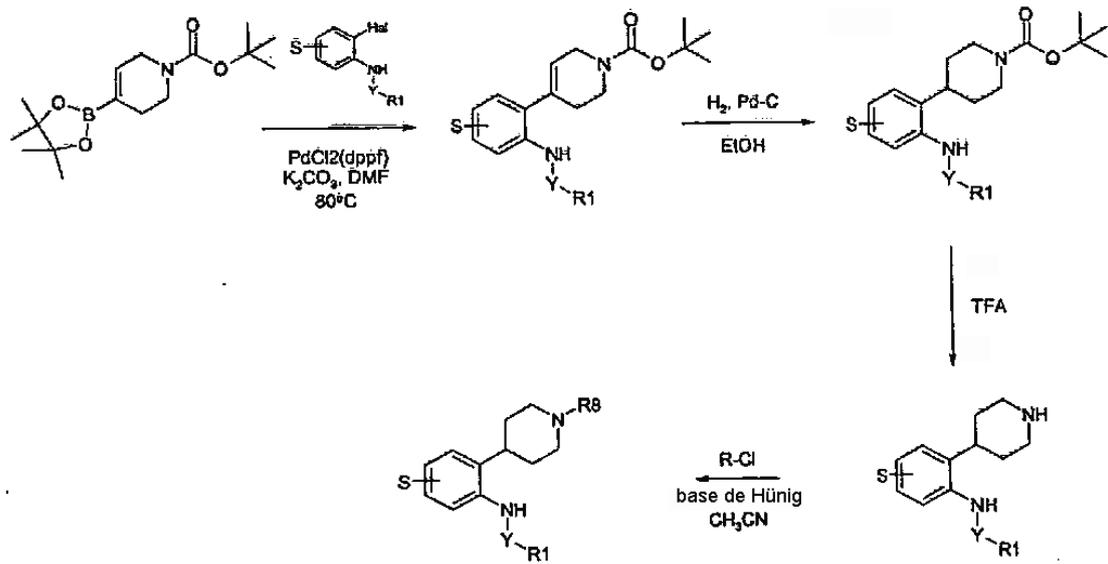
Esquema 8:



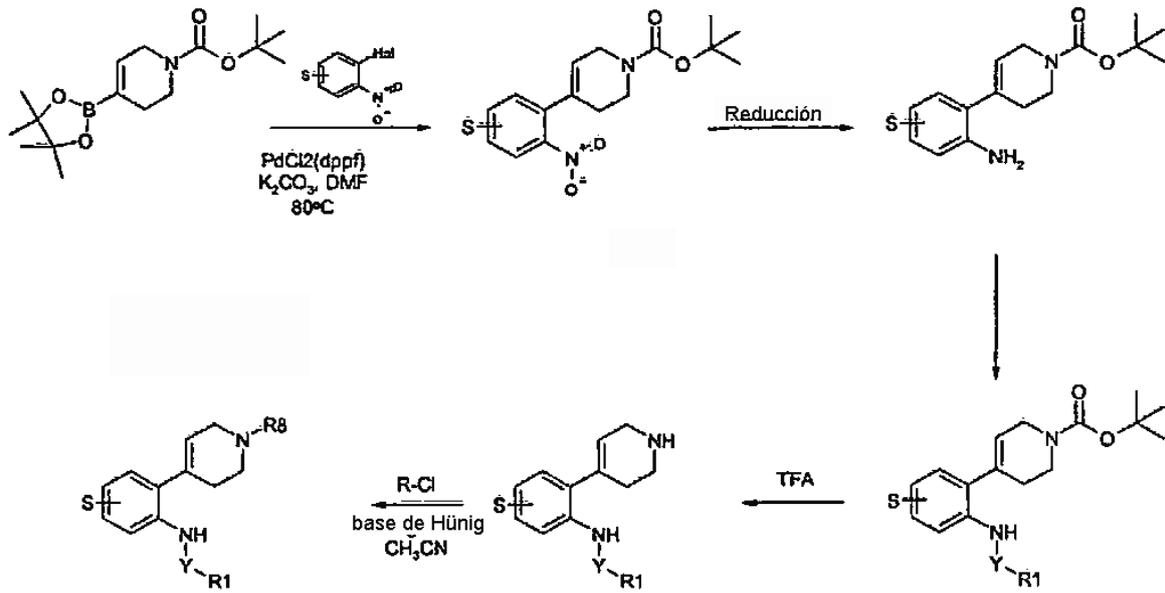
Esquema 9:



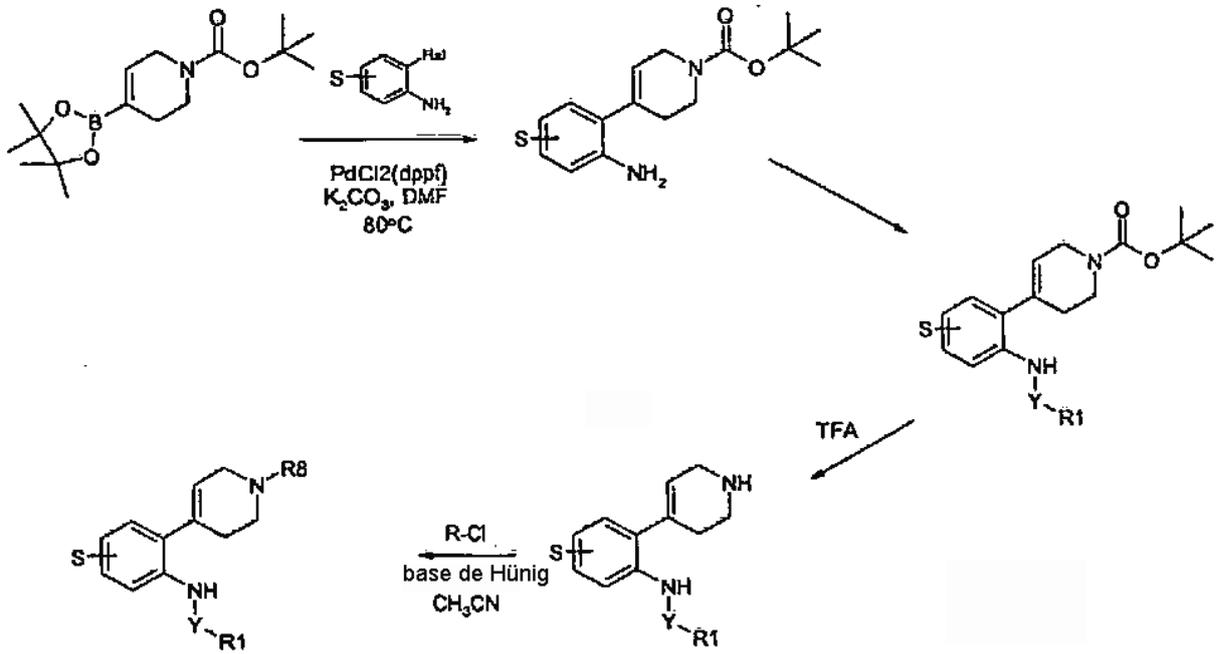
Esquema 10:



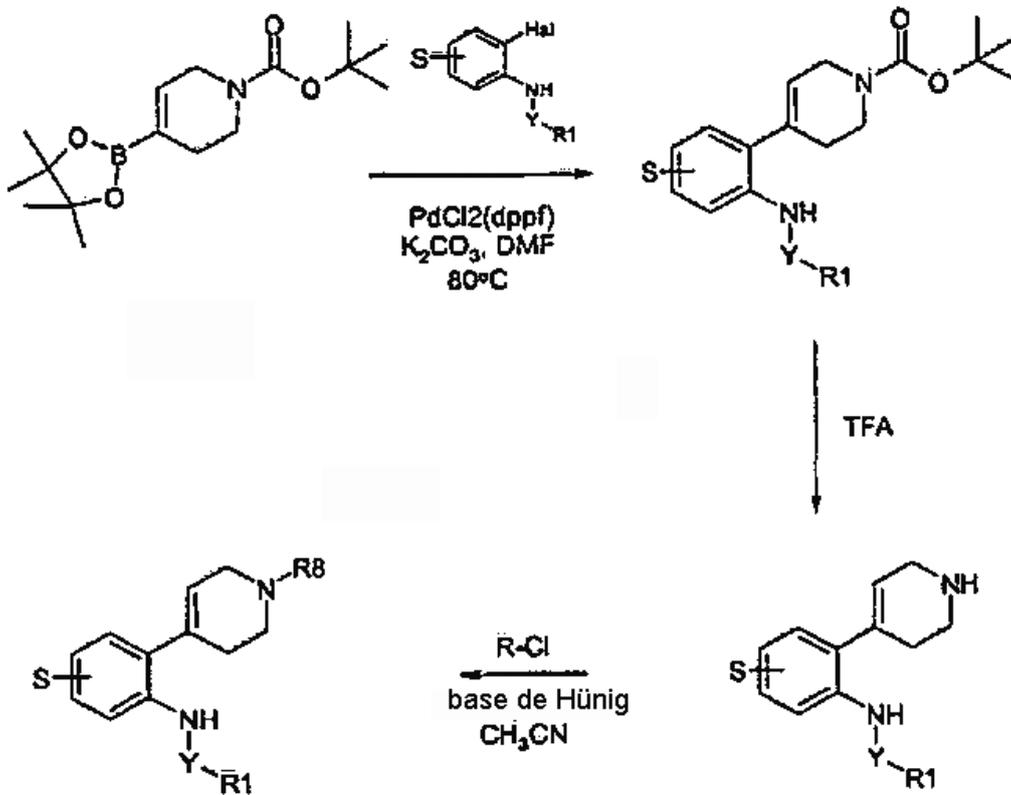
Esquema 11:



Esquema 12:

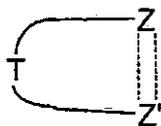


Esquema 13:



En lugar del grupo BOC, se pueden usar otros grupos protectores adecuados.

- 5 Las rutas sintéticas mostradas en los Esquemas 8-13 también se pueden usar para la preparación de compuestos de fórmula I en la que el anillo



es un anillo heteroaromático de 5 ó 6 miembros en lugar del grupo fenilo.

Los compuestos de fórmula (I) se pueden usar para combatir y controlar infestaciones de plagas de insectos, tales como Lepidoptera, Diptera, Hemiptera, Thysanoptera, Orthoptera, Dictyoptera, Coleoptera, Siphonaptera, Hymenoptera e Isoptera, y también otras plagas de invertebrados, por ejemplo plagas de ácaros, nematodos y moluscos. En lo sucesivo, los insectos, ácaros, nematodos y moluscos se denominan aquí colectivamente como plagas. Las plagas que se pueden combatir y controlar mediante el uso de los compuestos de la invención incluyen aquellas plagas asociadas con la agricultura (término el cual incluye el crecimiento de cosechas de productos alimentarios y textiles), la horticultura y la explotación de ganado, los animales de compañía, la silvicultura y el almacenamiento de productos de origen vegetal (tales como fruta, grano y madera); aquellas plagas asociadas con el daño producido a estructuras artificiales y la transmisión de enfermedades humanas y animales; y también las plagas molestas (tales como las moscas).

Los ejemplos de especies de plagas que se pueden controlar mediante los compuestos de fórmula (I) incluyen: *Myzus persicae* (pulgón), *Aphis gossypii* (pulgón), *Aphis fabae* (pulgón), *Lygus* spp. (chinchas), *Dysdercus* spp. (chinchas), *Nilaparvata lugens* (saltahojas), *Nephotettix inciticeps* (saltahojas), *Nezara* spp. (chinchas apestosas), *Euschistus* spp. (chinchas apestosas), *Leptocorisa* spp. (chinchas apestosas), *Frankliniella occidentalis* (trip), Thrips spp. (trips), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de la patata del Colorado), *Anthonomus grandis* (gorgojo del algodón), *Aonidiella* spp. (cochinillas), *Trialeurodes* spp. (moscas blancas), *Bemisia tabaci* (mosca blanca), *Ostrinia nubilalis* (barrenador del maíz), *Spodoptera littoralis* (gusano de la hoja del algodón), *Heliothis virescens* (cogollero del tabaco), *Helicoverpa armigera* (gusano bellotero del algodón), *Helicoverpa zea* (gusano bellotero del algodón), *Sylepta derogata* (perforador de la hoja del algodón), *Pieris brassicae* (mariposa blanca), *Plutella xylostella* (polilla de la col), *Agrotis* spp. (gusanos cortadores), *Chilo suppressalis* (barrenador del arroz), *Locusta migratoria* (langosta), *Chortiocetes terminifera* (langosta), *Diabrotica* spp. (gusanos de la raíz), *Panonychus ulmi* (ácaros de los frutales), *Panonychus citri* (ácaros de los cítricos), *Tetranychus urticae* (arañuela roja), *Tetranychus cinnabarinus* (araña roja del clavel), *Phyllocoptruta oleivora* (ácaro de los cítricos), *Polyphagotarsonemus latus* (ácaro blanco), *Brevipalpus* spp. (ácaros planos), *Boophilus microplis* (garrapata común del ganado), *Dermacentor variabilis* (garrapata del perro), *Ctenocephalides felis* (piojo del gato), *Liriomyza* spp. (minadores de hojas), *Musca domestica* (mosca doméstica), *Aedes aegypti* (mosquito), *Anopheles* spp. (mosquitos), *Culex* spp. (mosquitos), *Lucilia* spp. (moscas azules de la carne), *Blattella germanica* (cucaracha), *Periplaneta americana* (cucaracha), *Blatta orientalis* (cucaracha), termitas de la familia Mastotermitidae (por ejemplo, *Mastotermes* spp.), las Kalotermitidae (por ejemplo, *Neotermes* spp.), las Rhinotermitidae (por ejemplo, *Coptotermes formosanus*, *Reticulitermes flavipes*, *R. speratu*, *R. virginicus*, *R. hesperus* y *R. santonensis*) y las Termitidae (por ejemplo, *Globitermes sulfureus*), *Solenopsis geminata* (hormiga brava), *Monomorium pharaonis* (hormiga cosechadora), *Damalinea* spp. y *Linognathus* spp. (piojos mordedores y chupadores), *Meloidogyne* spp. (nematodos inductores de agallas), *Globodera* spp. y *Heterodera* spp. (nematodos del quiste), *Pratylenchus* spp. (nematodos de las lesiones), *Rhodypholus* spp. (nematodos barrenadores del plátano), *Tylenchulus* spp. (nematodos de los cítricos), *Haemonchus contortus* (lombriz grande del cuajo), *Caenorhabditis elegans* (nematodo dorado del vinagre), *Trichostrongylus* spp. (nematodos gastrointestinales) y *Deroceras reticulatum* (babosa).

Por lo tanto, la invención proporciona un método para combatir y controlar insectos o ácaros, que comprende aplicar una cantidad insecticida o acaricida eficaz de un compuesto de fórmula (I), o una composición que contiene un compuesto de fórmula (I), a una plaga, a un emplazamiento de una plaga, o a una planta susceptible al ataque por una plaga. Los compuestos de fórmula (I) se usan preferiblemente frente a insectos o ácaros.

El término "planta", como se usa aquí, incluye plántulas, arbustos y árboles.

A fin de aplicar un compuesto de fórmula (I) como un insecticida, acaricida, a una plaga, al emplazamiento de una plaga, o a una planta susceptible de ser atacada por una plaga, un compuesto de fórmula (I) se formula habitualmente en una composición que incluye, además del compuesto de fórmula (I), un diluyente o vehículo inerte adecuado y, opcionalmente, un agente tensioactivo (SFA). Los SFAs son compuestos químicos capaces de modificar las propiedades de una interfaz (por ejemplo, las interfaces líquido/sólido, líquido/aire o líquido/líquido) reduciendo la tensión interfacial y conduciendo de ese modo a cambios en otras propiedades (por ejemplo dispersión, emulsión y humectación). Se prefiere que todas las composiciones (tanto las formulaciones sólidas como las líquidas) comprendan, en peso, 0,0001 a 95%, más preferentemente 1 a 85%, por ejemplo 5 a 60%, de un compuesto de fórmula (I). La composición se usa generalmente para el control de plagas, de manera que se aplique un compuesto de fórmula (I) a una dosis de 0,1 g a 10 kg por hectárea, preferentemente de 1 g a 6 kg por hectárea, más preferentemente de 1 g a 1 kg por hectárea.

Cuando se usa en un tratamiento de semillas, un compuesto de fórmula (I) se usa a una dosis de 0,0001 g a 10 g (por ejemplo de 0,001 g ó 0,05 g), preferiblemente de 0,005 g a 10 g, más preferiblemente de 0,005 g a 4 g, por kilogramo de semilla.

5 En otro aspecto, la presente invención proporciona una composición insecticida o acaricida, que comprende una cantidad insecticidamente, acaricidamente, nematocidamente o molusquicidamente eficaz de un compuesto de fórmula (I) y un vehículo o diluyente adecuado para él. La composición es preferiblemente una composición insecticida o acaricida.

10 En todavía otro aspecto, la invención proporciona un método para combatir y controlar plagas en un emplazamiento, que comprende tratar las plagas o el emplazamiento de las plagas con una cantidad insecticida o acaricidamente eficaz de una composición que comprende un compuesto de fórmula (I). Los compuestos de fórmula (I) se usan preferiblemente frente a insectos o ácaros.

15 Las composiciones se pueden elegir entre una serie de tipos de formulación, que incluyen polvos espolvoreables (DP), polvos solubles (SP), gránulos solubles en agua (SG), gránulos dispersables en agua (WG), polvos humectables (WP), gránulos (GR) (de liberación lenta o rápida), concentrados solubles (SL), líquidos miscibles con aceite (OL), líquidos de volumen ultra bajo (UL), concentrados emulsionables (EC), concentrados dispersables (DC), emulsiones (tanto de aceite en agua (EW) como de agua en aceite (EO)), microemulsiones (ME), concentrados en suspensión (SC), aerosoles, formulaciones para nebulización/humo, suspensiones en cápsula (CS) y formulaciones para tratamiento de semillas. El tipo de formulación elegido en cualquier caso dependerá del fin particular previsto y de las propiedades físicas, químicas y biológicas del compuesto de fórmula (I).

20 Los polvos espolvoreables (DP) se pueden preparar mezclando un compuesto de fórmula (I) con uno o más diluyentes sólidos (por ejemplo arcillas naturales, caolín, pirofilita, bentonita, alúmina, montmorillonita, kieselguhr, tiza, tierras de diatomeas, fosfatos de calcio, carbonatos de calcio y magnesio, azufre, cal, harinas, talco y otros vehículos sólidos orgánicos e inorgánicos) y moliendo mecánicamente la mezcla hasta un polvo fino.

25 Los polvos solubles (SP) se pueden preparar mezclando un compuesto de fórmula (I) con una o más sales inorgánicas solubles en agua (tal como bicarbonato de sodio, carbonato de sodio o sulfato de magnesio) o uno o más sólidos orgánicos solubles en agua (tal como un polisacárido) y, opcionalmente, uno o más agentes humectantes, uno o más agentes dispersantes, o una mezcla de dichos agentes, para mejorar la dispersabilidad/solubilidad en agua. Después, la mezcla se muele hasta un polvo fino. Composiciones similares también se pueden granular para formar gránulos solubles en agua (SG).

30 Los polvos humectables (WP) se pueden preparar mezclando un compuesto de fórmula (I) con uno o más diluyentes o vehículos sólidos, uno o más agentes humectantes y, preferiblemente, uno o más agentes dispersantes y, opcionalmente, uno o más agentes de suspensión para facilitar la dispersión en líquidos. Después, la mezcla se muele hasta un polvo fino. Composiciones similares también se pueden granular para formar gránulos dispersables en agua (WG).

35 Los gránulos (GR) se pueden formar granulando una mezcla de un compuesto de fórmula (I) y uno o más diluyentes o vehículos sólidos en polvo, o a partir de gránulos blanco preformados absorbiendo un compuesto de fórmula (I) (o una disolución del mismo, en un agente adecuado) en un material granular poroso (tal como piedra pómez, arcillas de atapulgita, tierra de batán, kieselguhr, tierras de diatomeas, o mazorcas de maíz molidas) o adsorbiendo un compuesto de fórmula (I) (o una disolución del mismo, en un agente adecuado) en un material de núcleo duro (tal como arenas, silicatos, carbonatos, sulfatos o fosfatos minerales) y secando si fuera necesario. Los agentes que se usan habitualmente para ayudar en la absorción o adsorción incluyen disolventes (tales como disolventes de petróleo alifáticos y aromáticos, alcoholes, éteres, cetonas y ésteres) y agentes adherentes (tales como acetatos de polivinilo, alcoholes polivinílicos, dextrinas, azúcares y aceites vegetales). También se pueden incluir en los gránulos uno o más aditivos (por ejemplo un agente emulsionante, un agente humectante o un agente dispersante).

45 Los concentrados dispersables (DC) se pueden preparar disolviendo un compuesto de fórmula (I) en agua o en un disolvente orgánico, tal como una cetona, un alcohol o un éter de glicol. Estas disoluciones pueden contener un tensioactivo (por ejemplo para mejorar la dilución en agua o para evitar la cristalización en un tanque de aspersión).

50 Los concentrados emulsionables (EC) o las emulsiones de aceite en agua (EW) se pueden preparar disolviendo un compuesto de fórmula (I) en un disolvente orgánico (que contenga opcionalmente uno o más agentes humectantes, uno o más agentes emulsionantes, o una mezcla de dichos agentes). Los disolventes orgánicos adecuados para uso en los EC incluyen hidrocarburos aromáticos (tales como alquilbencenos o alquilnaftalenos, ejemplificados por SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 y SOLVESSO 200; SOLVESSO es una marca registrada), cetonas (tales como ciclohexanona o metilciclohexanona) y alcoholes (tales como alcohol bencílico, alcohol furfurílico o butanol), N-alquilpirrolidonas (tales como N-metilpirrolidona o N-octilpirrolidona), dimetilamidas de ácidos grasos (tales como dimetilamida de un ácido graso de C₈-C₁₀) e hidrocarburos clorados. Un producto de EC se puede emulsionar espontáneamente al añadirlo a agua, para producir una emulsión con estabilidad suficiente para permitir la aplicación por aspersión mediante un equipo adecuado. La preparación de una EW implica obtener un compuesto de fórmula (I), ya sea líquido (si no es líquido a temperatura ambiente, se puede fundir a una temperatura razonable,

típicamente por debajo de 70°C) o en disolución (disolviéndolo en un disolvente apropiado), y después emulsionando el líquido o disolución resultante en agua que contiene uno o más SFAs, a cizallamiento elevado, para producir una emulsión. Los disolventes adecuados para uso en las EW incluyen aceites vegetales, hidrocarburos clorados (tales como clorobencenos), disolventes aromáticos (tales como alquilbencenos o alquilnaftalenos) y otros disolventes orgánicos adecuados que tengan baja solubilidad en agua.

Las microemulsiones (ME) se pueden preparar mezclando agua con una mezcla de uno o más disolventes con uno o más SFAs, para producir espontáneamente una formulación líquida isotrópica termodinámicamente estable. Un compuesto de fórmula (I) está presente inicialmente en agua o en la mezcla de disolvente/SFA. Los disolventes adecuados para uso en las ME incluyen los descritos aquí anteriormente para uso en los EC o en las EW. Una ME puede ser un sistema de aceite en agua o de agua en aceite (el hecho de que el sistema esté presente se puede determinar por medidas de conductividad), y puede ser adecuada para mezclar en la misma formulación plaguicidas solubles en agua y solubles en aceite. Una ME es adecuada para la dilución en agua, quedando como una microemulsión o formando una emulsión de aceite en agua convencional.

Los concentrados en suspensión (SC) pueden comprender suspensiones acuosas o no acuosas de partículas sólidas insolubles finamente divididas de un compuesto de fórmula (I). Los SC se pueden preparar moliendo con perlas o bolas el compuesto sólido de fórmula (I) en un medio adecuado, opcionalmente con uno o más agentes dispersantes, para producir una suspensión de partículas finas del compuesto. Se puede incluir uno o más agentes humectantes en la composición, y se puede incluir un agente de suspensión para reducir la velocidad a la cual sedimentan las partículas. Alternativamente, un compuesto de fórmula (I) se puede moler en seco y luego añadir a agua, que contiene los agentes descritos aquí anteriormente, para producir el producto final deseado.

Las formulaciones en aerosol comprenden un compuesto de fórmula (I) y un propelente adecuado (por ejemplo *n*-butano). Un compuesto de fórmula (I) también se puede disolver o dispersar en un medio adecuado (por ejemplo agua o un líquido miscible con agua, tal como *n*-propanol) para proporcionar composiciones para uso en bombas de aspersión no presurizadas, accionadas a mano.

Un compuesto de fórmula (I) se puede mezclar en estado seco con una mezcla pirotécnica para formar una composición adecuada para generar, en un espacio cerrado, un humo que contenga el compuesto.

Las suspensiones en cápsulas (CS) se pueden preparar de manera similar a la preparación de las formulaciones de EW, pero con una etapa de polimerización adicional, de modo que se obtenga una dispersión acuosa de gotitas de aceite, en la cual cada gotita de aceite está encapsulada por una cubierta polimérica y contiene un compuesto de fórmula (I) y, opcionalmente, un vehículo o diluyente para él. La cubierta polimérica se puede producir mediante una reacción de policondensación interfacial o mediante un procedimiento de coacervación. Las composiciones pueden proporcionar liberación controlada del compuesto de fórmula (I), y se pueden usar para el tratamiento de semillas. Un compuesto de fórmula (I) también se puede formular en una matriz polimérica biodegradable para proporcionar una liberación controlada, lenta, del compuesto.

Una composición puede incluir uno o más aditivos para mejorar el comportamiento biológico de la composición (por ejemplo mejorando la humectación, retención o distribución sobre superficies; la resistencia a la lluvia en superficies tratadas; o la absorción o movilidad de un compuesto de fórmula (I)). Tales aditivos incluyen agentes tensioactivos, aditivos para aspersión a base de aceites, por ejemplo ciertos aceites minerales o aceites vegetales naturales (como aceite de soja y de colza), y mezclas de éstos con otros coadyuvantes biomejoradores (ingredientes que pueden ayudar o modificar la acción de un compuesto de fórmula (I)).

Un compuesto de fórmula (I) también se puede formular para uso como un tratamiento de semillas, por ejemplo como una composición en polvo, que incluye un polvo para tratamiento de semillas en seco (DS), un polvo soluble en agua (SS) o un polvo dispersable en agua para tratamiento en suspensión (WS), o como una composición líquida, que incluye un concentrado fluible (FS), una disolución (LS) o una suspensión en cápsula (CS). La preparación de composiciones DS, SS, WS, FS y LS es muy similar, respectivamente, a la de las composiciones DP, SP, WP, SC y DC descritas antes. Las composiciones para tratar semillas pueden incluir un agente que favorezca la adhesión de la composición a la semilla (por ejemplo un aceite mineral o una barrera formadora de película).

Los agentes humectantes, agentes dispersantes y agentes emulsionantes pueden ser tensioactivos (SFAs) del tipo catiónico, aniónico, anfótero o no iónico.

SFAs adecuados del tipo catiónico incluyen compuestos de amonio cuaternario (por ejemplo bromuro de cetiltrimetilamonio), imidazolinas y sales de aminas.

SFAs aniónicos adecuados incluyen sales de ácidos grasos con metales alcalinos, sales de monoésteres alifáticos de ácido sulfúrico (por ejemplo laurilsulfato de sodio), sales de compuestos aromáticos sulfonados (por ejemplo dodecilsulfonato de sodio, dodecilsulfonato de calcio, butilnaftalenosulfonato y mezclas de diisopropil- y triisopropilnaftalenosulfonatos de sodio), éter sulfatos, alcohol éter sulfatos (por ejemplo lauret-3-sulfato de sodio), éter carboxilatos (por ejemplo lauret-3-carboxilato de sodio), ésteres de fosfato (productos obtenidos de la reacción entre uno o más alcoholes grasos y ácido fosfórico (predominantemente monoésteres) o pentóxido de fósforo (predominantemente diésteres), por ejemplo la reacción entre alcohol laurílico y ácido tetrafosfórico; de forma

adicional, estos productos se pueden etoxilar), sulfosuccinamatos, parafina- u olefinsulfonatos, tauratos y lignosulfonatos.

SFAs adecuados del tipo anfotérico incluyen betaínas, propionatos y glicinatos.

5 SFAs adecuados del tipo no iónico incluyen productos de condensación de óxidos de alquileo, tales como óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno, o mezclas de estos, con alcoholes grasos (tales como alcohol oleílico o alcohol cetílico) o con alquilfenoles (tales como octilfenol, nonilfenol u octilcresol); ésteres parciales derivados de ácidos grasos de cadena larga o anhídridos de hexitol; productos de condensación de dichos ésteres parciales con óxido de etileno; polímeros de bloques (que comprenden óxido de etileno y óxido de propileno); alcanolamidas; ésteres simples (por ejemplo, ésteres de ácidos grasos con polietilenglicol); óxidos de amina (por ejemplo, óxido de laurildimetilamina); y lecitinas.

10 Los agentes de suspensión adecuados incluyen coloides hidrofílicos (tales como polisacáridos, polivinilpirrolidona o carboximetilcelulosa de sodio) y arcillas hinchables (tales como bentonita o atapulgita).

15 Un compuesto de fórmula (I) se puede aplicar por cualquiera de los medios conocidos de aplicación de compuestos plaguicidas. Por ejemplo, se puede aplicar, formulado o sin formular, a las plagas o al emplazamiento de las plagas (tal como el hábitat de las plagas, o una planta en crecimiento susceptible a la infestación por las plagas) o a cualquier parte de la planta, incluyendo el follaje, tallos, ramas o raíces, a las semillas antes de plantarlas, o a otro medio en el cual se hacen crecer las plantas o en el que se plantarán (tal como el suelo que rodea las raíces, el suelo en general, el agua de los arrozales o los sistemas de cultivos hidropónicos), directamente o se puede pulverizar, aplicar en polvo, aplicar mediante inmersión, aplicar como una formulación en crema o pasta, aplicar como un vapor, o aplicar mediante distribución o incorporación de una composición (tal como una composición granular o una composición envasada en una bolsa soluble en agua) en el suelo o en un entorno acuoso.

20 Un compuesto de fórmula (I) también se puede inyectar en las plantas o se puede pulverizar sobre la vegetación usando técnicas electrodinámicas de pulverización u otros métodos de volumen bajo, o se puede aplicar mediante sistemas de irrigación terrestres o aéreos.

25 Las composiciones para uso como preparaciones acuosas (disoluciones o dispersiones acuosas) se suministran generalmente en forma de un concentrado que contiene una proporción elevada del ingrediente activo, añadiéndose el concentrado al agua antes del uso. A menudo es necesario que estos concentrados, los cuales pueden incluir DC, SC, EC, EW, ME, SG, SP, WP, WG y CS, soporten periodos prolongados de almacenamiento, y que sea posible, después de dicho almacenamiento, añadirlos al agua para formar preparaciones acuosas que permanezcan homogéneas durante un tiempo suficiente como para permitir que sean aplicadas con un equipo convencional de pulverización. Tales preparaciones acuosas pueden contener cantidades variables de un compuesto de fórmula (I) (por ejemplo 0,0001 a 10% en peso) dependiendo del fin para el que se vayan a usar.

30 Un compuesto de fórmula (I) se puede usar en mezclas con fertilizantes (por ejemplo fertilizantes que contengan nitrógeno, potasio o fósforo). Los tipos de formulaciones adecuadas incluyen gránulos de fertilizante. Las mezclas contienen de forma adecuada hasta 25% en peso del compuesto de fórmula (I).

35 La invención proporciona por lo tanto una composición fertilizante que comprende un fertilizante y un compuesto de fórmula (I).

40 Las composiciones de esta invención pueden contener otros compuestos con actividad biológica, por ejemplo micronutrientes o compuestos con actividad fungicida o que poseen actividad reguladora del crecimiento de las plantas, actividad herbicida, insecticida, nematocida o acaricida.

45 El compuesto de fórmula (I) puede ser el único ingrediente activo de la composición, o se puede mezclar con uno o más ingredientes activos adicionales, tales como un plaguicida, un fungicida, un agente sinérgico, un herbicida o un regulador del crecimiento de las plantas, cuando sea apropiado. Un ingrediente activo adicional puede: proporcionar una composición que tenga un espectro de actividad más amplio o una mayor persistencia en el lugar; provocar un efecto sinérgico en la actividad o complementar la actividad (por ejemplo aumentando la velocidad de actuación o evitando la repulsión) del compuesto de fórmula (I); o ayudar a superar o prevenir el desarrollo de resistencia a componentes individuales. El ingrediente activo adicional particular dependerá de la utilidad pretendida de la composición. Ejemplos de plaguicidas adecuados incluyen los siguientes:

50 a) Piretroides, tales como permetrina, cipermetrina, fenvalerato, esfenvalerato, deltametrina, cihalotrina (en particular lambda-cihalotrina), bifentrina, fenpropatrina, ciflutrina, teflutrina, piretroides inocuos para los peces (por ejemplo, etofenprox), piretrina natural, tetrametrina, s-bioaletrina, fenflutrina, praletrina o carboxilato de 5-bencil-3-furilmetil-(E)-(1R,3S)-2,2-dimetil-3-(2-oxotiolan-3-ilidenometil)ciclopropano;

55 b) Organofosfatos, tales como profenofos, sulprofos, acefato, trietil paration, azinfos metilo, demetón-s-metilo, heptenofos, tiometon, fenamifos, monocrotofos, profenofos, triazofos, metamidofos, dimetoato, fosfamidon, malation, clorpirifos, fosalona, terbufos, fensulfotión, fonofos, forato, foxim, pirimifos-metilo, pirimifos-etilo, fenitrotion, fostiazato o diazinon;

- c) Carbamatos (incluyendo arilcarbamatos), tales como pirimicarb, triazamato, cloetocarb, carbofurán, furatiocarb, etiofencarb, aldicarb, tiofurox, carbosulfán, bendiocarb, fenobucarb, propoxur, metomilo u oxamilo;
- d) Benzoilureas, tales como diflubenzurón, triflumurón, hexaflumurón, flufenoxurón o clorfluazurón;
- e) Compuestos orgánicos de estaño, tales como cihexatina, óxido de fenbutatina o azociclotina;
- 5 f) Pirazoles, tales como tebufenpirad y fenpiroximato;
- g) Macrólidos, tales como avermectinas o milbemicinas, por ejemplo abamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, milbemicina, espinosad o azadiractina;
- h) Hormonas o feromonas;
- i) Compuestos organoclorados, tales como endosulfano, hexacloruro de benceno, DDT, clordano o dieldrina;
- 10 j) Amidinas, tales como clordimeform o amitraz;
- k) Agentes fumigantes, tales como cloropicrina, dicloropropano, bromuro de metilo o metam;
- l) Compuestos de cloronicotilo, tales como imidacloprid, tiacloprid, acetamiprid, nitenpiram, o tiametoxam;
- m) Diacilhidrazinas, tales como tebufenozida, cromafenozida o metoxifenozida;
- n) Éteres difenólicos, tales como diofenolano o piriproxifeno;
- 15 o) Indoxacarb;
- p) Clorfenapir; o
- q) Pimetrozina.

Además de las clases químicas principales de plaguicidas enumeradas anteriormente, en la composición se pueden emplear otros plaguicidas que tengan dianas particulares, si es apropiado para la utilidad pretendida de la composición. Por ejemplo, se pueden emplear insecticidas selectivos para cosechas particulares, por ejemplo insecticidas específicos contra los perforadores del tallo (tales como cartap) o insecticidas específicos contra las chicharritas (tales como buprofezina) para uso en el arroz. Como alternativa, también se pueden incluir, en las composiciones, insecticidas o acaricidas específicos para especies de insectos/etapas particulares (por ejemplo ovolarvicidas acaricidas, tales como clofentezina, flubenzimina, hexitiazox o tetradifón; motilicidas acaricidas, tales como dicofol o propargita; acaricidas, tales como bromopropilato o clorobencilato; o reguladores del crecimiento, tales como hidrametilnón, ciromazina, metopreno, clorfluazurón o diflubenzurón).

Los ejemplos de compuestos fungicidas que se pueden incluir en la composición de la invención son (*E*)-*N*-metil-2-[2-(2,5-dimetilfenoximetil)fenil]-2-metoxi-iminoacetamida (SSF-129), 4-bromo-2-ciano-*N,N*-dimetil-6-trifluorometilbencimidazol-1-sulfonamida, α -[*N*-(3-cloro-2,6-xilil)-2-metoxiacetamido]- γ -butirolactona, 4-cloro-2-ciano-*N,N*-dimetil-5-p-tolilimidazol-1-sulfonamida (IKF-916, ciamidasulfamida), 3-5-dicloro-*N*-(3-cloro-1-etil-1-metil-2-oxopropil)-4-metilbenzamida (RH-7281, zoxamida), *N*-alil-4,5,-dimetil-2-trimetilsililtiofen-3-carboxamida (MON65500), *N*-(1-ciano-1,2-dimetilpropil)-2-(2,4-diclorofenoxi)propionamida (AC382042), *N*-(2-metoxi-5-piridil)-ciclopropanocarboxamida, acibenzolar (CGA245704), alanicarb, aldimorf, anilazina, azaconazol, azoxistrobina, benalaxilo, benomilo, biloxazol, bitertanol, blasticidina S, bromuconazol, bupirimato, captafol, captán, carbendazim, carbendazim clorhidrato, carboxina, carpropamida, carvona, CGA41396, CGA41397, quinometionato, clorotalonilo, clorozolinato, clozilacón, compuestos que contienen cobre, tales como oxiclورو de cobre, oxiquinolato de cobre, sulfato de cobre, talato de cobre y mezcla de Bordeaux, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinilo, debacarb, 1,1'-dióxido de disulfuro de di-2-piridilo, diclofluanida, diclomezina, diclorano, dietofencarb, difenoconazol, difenzoquat, diflumetorim, tiofosfato de *O,O*-di-*iso*-propil-*S*-bencilo, dimefluzol, dimetconazol, dimetomorph, dimetirimol, diniconazol, dinocap, ditanón, cloruro de dodecildimetilamonio, dodemorph, dodina, doguadina, edifenfós, epoxiconazol, etirimol, (*Z*)-*N*-bencil-*N*-([metil(metil-tioetilidenaminooxicarbonil)amino]tio)- β -alaninato de etilo, etridiazol, famoxadona, fenamidona (RPA407213), fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamida (KBR2738), fenciclonilo, fenpropidina, fenpropimorph, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonilo, flumetover, fluoroimida, fluquinconazol, flusilazol, flutolanilo, flutriafol, folpet, fuberidazol, furalaxilo, furametpir, guazatina, hexaconazol, hidroxixoxazol, himexazol, imazalilo, imibenconazol, iminocadina, triacetato de iminocadina, ipconazol, iprobenfós, iprodiona, iprovalicarb (SZX0722), isopropanil butil carbamato, isoprotiolano, kasugamicina, kresoxim-metilo, LY186054, LY211795, LY248908, mancozeb, maneb, mefenoxam, mepanipirim, mepronilo, metalaxilo, metconazol, metiram, metiram-zinc, metominostrobina, miclobutanilo, neoasozina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropilo, nuarimol, ofurace, compuestos de organomercurio, oxadixilo, oxasulfurón, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxina, pefurazoato, penconazol, pencicuron, óxido de fenazina, fosetilo-Al, ácidos de fósforo, ftalida, picoxiestrobina (ZA1963), polioxina D, poliram, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propiconazol, propineb, ácido propiónico, pirazofós, pirifenox, pirimetanilo, piroquión, piroxifur, pirrolnitrina, compuestos de amonio cuaternario, quinometionato, quinoxifeno, quintozeno, sipconazol (F-

155), pentaclorofenato de sodio, espiroxamina, estreptomina, azufre, tebuconazol, teclotalam, tecnazeno, tetraconazol, tiabendazol, tifulzamida, 2-(tiocianometiltio)benzotiazol, tiofanato-metilo, tiram, timibenconazol, tolclofós-metilo, tolifluanida, triadimefón, triadimenol, triazbutilo, triazóxido, triciclazol, tridemorph, trifloxiestrobina (CGA279202), triforina, triflumizol, triticonazol, validamicina A, vapam, vinclozolina, zineb y ziram.

5 Los compuestos de fórmula (I) se pueden mezclar con el suelo, turba, u otro medio de enraizamiento para la protección de plantas frente a enfermedades fúngicas portadas por semillas, portadas por el suelo o foliares.

Los ejemplos de agentes sinérgicos adecuados para uso en las composiciones incluyen butóxido de piperonilo, sesamex, safroxano y dodecilimidazol.

10 Los herbicidas y reguladores del crecimiento vegetal adecuados para la inclusión en las composiciones dependerán de la diana pretendida y del efecto requerido.

Un ejemplos de herbecido selectivo para arroz que se puede incluir es propanilo. Un ejemplo de un regulador del crecimiento vegetal para uso en algodón es PIX™.

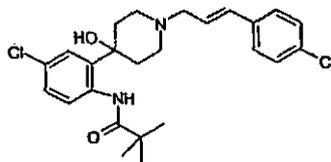
15 Algunas mezclas pueden comprender ingredientes activos que tienen propiedades físicas, químicas o biológicas significativamente diferentes, de modo que no se presten fácilmente al mismo tipo de formulación convencional. En estas circunstancias, pueden prepararse otros tipos de formulaciones. Por ejemplo, si un ingrediente activo es un sólido insoluble en agua y el otro es un líquido insoluble en agua, puede ser posible, no obstante, dispersar cada ingrediente activo en la misma fase acuosa continua dispersando el ingrediente activo sólido como una suspensión (usando una preparación análoga a aquella de un SC) pero dispersando el ingrediente activo líquido como una emulsión (usando una preparación análoga a aquella de una EW). La composición resultante es una formulación en suspoemulsión (SE).

20 La invención se ilustra mediante los siguientes Ejemplos:

Los datos de espectros de masas se obtuvieron para compuestos seleccionados de los siguientes ejemplos usando LCMS: LC5: 254 nm - gradiente 10% de A hasta 100% de B; A=H₂O+0,01% de HCOOH, B=CH₃CN/CH₃OH+0,01% de HCOOH; electriopulverización positiva 150-1000 m/z.

25 EJEMPLO 1

Este Ejemplo ilustra la preparación de N-(4-cloro-2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-4-hidroxi-piperidin-4-il}-fenil)-2,2-dimetil-propionamida



Etapa A: Preparación de N-(4-cloro-fenil)-2,2-dimetil-propionamida

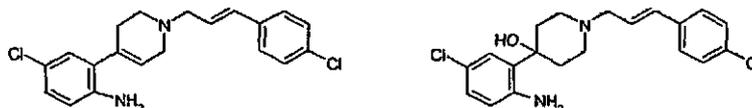
30 A una disolución de 4-cloroanilina (25,51 g) y trietilamina (69,73 ml) en cloroformo (350 ml) se añadió cloruro de 2,2-dimetil-propionilo (25,32 g) durante un período de 30 minutos. La disolución resultante se agitó a r.t. durante 1 hora, después se añadió agua, y la mezcla se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron a vacío para proporcionar 35,8 g de producto. P.f. 149-150°C; Tiempo de retención HPLC 2,83 min.; MS (ES+) 212 (M+H⁺).

35 Etapa B: Preparación de N-(4-cloro-2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-4-hidroxi-piperidin-4-il}-fenil)-2,2-dimetil-propionamida

40 Una disolución de n-butil-litio en hexano (47,0 ml de una disolución 1,6 M) se añadió gota a gota a una disolución de N-(4-cloro-fenil)-2,2-dimetil-propionamida (6,35 g) en THF seco (100 ml) a -5°C bajo una atmósfera de N₂ durante 15 min. La disolución resultante se agitó a 0°C durante 2 horas, y después se añadió gota a gota una disolución de 1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-ona (7,49 g) en THF (15 ml) a la disolución anterior del dianión a 0°C durante un período de 1 hora. La mezcla de reacción se agitó durante 2 horas a 0°C, y después toda la noche a r.t. La disolución se vertió entonces en agua con hielo, se volvió ácida con HCl conc., y se extrajo con acetato de etilo. La capa acuosa se volvió básica, y se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua, se secaron sobre sulfato de sodio, y se concentraron a vacío. El residuo se sometió a cromatografía en gel de sílice (hexano:acetato de etilo:trietilamina 49:49:2) para proporcionar el producto del título (6,2 g). P.f. 177-179°C; Tiempo de retención HPLC 2,19 min.; MS (ES+) 461 (M+H⁺).

EJEMPLO 2

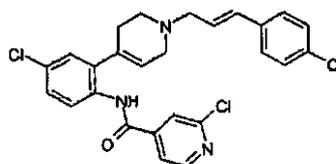
Este Ejemplo ilustra la preparación de 4-cloro-2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il}-fenilamina y 4-(2-amino-5-cloro-fenil)-1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-ol.



5 Una suspensión de N-(4-cloro-2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-4-hidroxi-piperidin-4-il}-fenil)-2,2-dimetil-propionamida (1,00 g) en H₂SO₄ 3N (7,5 ml) y DMSO (3 ml) se calentó a temperatura de reflujo durante 48 horas. Después, se añadió agua, y la mezcla se extrajo tres veces con CH₂Cl₂, las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, y se concentraron a vacío. El residuo se sometió a cromatografía en gel de sílice (CH₂Cl₂:MeOH 95:5) para proporcionar 4-cloro-2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il}-fenilamina (0,205 g; aceite viscoso; Tiempo de retención HPLC 2,15 min.; MS (ES+) 359 (M+H⁺) y 4-(2-amino-5-cloro-fenil)-1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-ol (0,182 g; P.f. 168-170°C; Tiempo de retención HPLC 1,95 min.; MS (ES+) 377 (M+H⁺)).

EJEMPLO 3

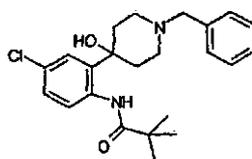
Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-(4-cloro-2-{1-[(E)-3-(4-clorofenil)-alil]-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il}-fenil)-isonicotinamida



15 A una disolución de 4-cloro-2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il}-fenilamina (60 mg) y trietilamina (0,059 ml) en CH₂Cl₂ (10 ml) se añadió cloruro de 2-cloro-isonicotinoilo (1,5 equivalentes; como una disolución 0,2 M en CH₂Cl₂) durante un período de 10 minutos. La disolución resultante se agitó a r.t. durante 2 horas, se vertió en una disolución acuosa saturada de NaHCO₃, y la mezcla se extrajo tres veces con CH₂Cl₂. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron a vacío. El residuo se sometió a cromatografía en gel de sílice (hexano:acetato de etilo:trietilamina 25:73:2) para proporcionar el producto del título (28 mg). Aceite viscoso; Tiempo de retención HPLC 2,28 min.; MS (ES+) 500, 498 (M+H⁺).

EJEMPLO 4

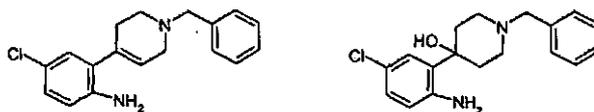
Este Ejemplo ilustra la preparación de N-[2-(1-bencil-4-hidroxi-piperidin-4-il)-4-cloro-fenil]-2,2-dimetil-propionamida



25 Una disolución de n-butil-litio en hexano (22,6 ml de una disolución que contiene n-butil-litio al 15%) se añadió gota a gota a una disolución de N-(4-cloro-fenil)-2,2-dimetil-propionamida (3,00 g) en THF seco (80 ml) a -5°C bajo una atmósfera de N₂ durante 15 min. La disolución resultante se agitó a 0°C durante 2 horas, y después se añadió gota a gota una disolución de 1-bencil-piperidin-4-ona (2,67) en THF (4,5 ml) a la disolución anterior del dianión a 0°C durante un período de 1 hora. La mezcla de reacción se agitó durante 2 horas a 0°C, y después toda la noche a r.t. La disolución se vertió entonces en agua con hielo, se volvió ácida con HCl conc., y se extrajo con acetato de etilo. La capa acuosa se volvió básica, y se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua, se secaron sobre sulfato de sodio, y se concentraron a vacío. El residuo se recrystalizó en acetato de etilo/THF para proporcionar el producto del título (2,6 g). P.f. 252-255°C.

EJEMPLO 5

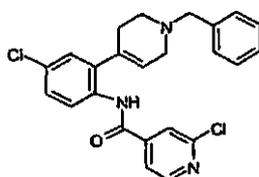
35 Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-(1-bencil-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il)-4-cloro-fenilamina y 4-(2-amino-5-cloro-fenil)-1-bencil-piperidin-4-ol.



Una suspensión de N-[2-(1-bencil-4-hidroxi-piperidin-4-il)-4-cloro-fenil]-2,2-dimetil-propionamida (6,00 g) en n-BuOH (50 ml) y HCl 6N (120 ml) se calentó a temperatura de reflujo durante 5 días. La disolución se vertió entonces en agua con hielo, se volvió ácida con HCl conc., y se extrajo con acetato de etilo. La capa acuosa se volvió básica, y se extrajo tres veces con CH₂Cl₂, se secó sobre sulfato de sodio, y se concentró a vacío. El residuo se sometió a cromatografía en gel de sílice (hexano:acetato de etilo:trietilamina 49:49:2) para proporcionar 2-(1-bencil-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il)-4-cloro-fenilamina (2,11 g; aceite viscoso; Tiempo de retención HPLC 1,81 min.; MS (ES+) 299 (M+H⁺)) y 4-(2-amino-5-cloro-fenil)-1-bencil-piperidin-4-ol (2,11 g; aceite viscoso; Tiempo de retención HPLC 1,58 min.; MS (ES+) 317 (M+H⁺)).

EJEMPLO 6

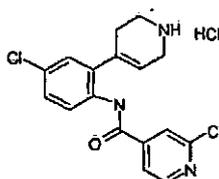
Este Ejemplo ilustra la preparación de N-[2-(1-bencil-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il)-4-cloro-fenil]-2-cloro-isonicotinamida.



A una disolución de 2-(1-bencil-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il)-4-cloro-fenilamina (500 mg) y trietilamina (0,350 ml) en CHCl₃ (25 ml) se añadió cloruro de 2-cloro-isonicotinoilo (1,2 equivalentes; como una disolución 1,0 M en CH₂Cl₂) durante un período de 10 minutos. La disolución resultante se agitó a r.t toda la noche, se vertió en disolución acuosa saturada de NaHCO₃, y la mezcla se extrajo tres veces con CH₂Cl₂. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, y se concentraron a vacío. El residuo se sometió a cromatografía en gel de sílice (hexano:acetato de etilo:trietilamina 49:49:2) para proporcionar el producto del título (595 mg). Sólido blanco; Tiempo de retención HPLC 1,89 min.; MS (ES+) 440, 438 (M+H⁺).

EJEMPLO 7

Este Ejemplo ilustra la preparación de hidrocloreto de 2-cloro-N-[4-cloro-2-(1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il)-fenil]-isonicotinamida.



Etapa A: Preparación de éster 1-cloro-etílico del ácido 4-{5-cloro-2-[(2-cloro-piridin-4-carbonil)-amino]fenil}-3,6-dihidro-2H-piridin-1-carboxílico

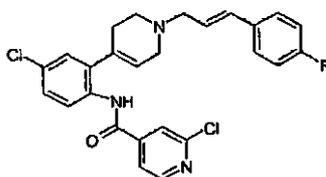
Se añadió cloroformiato de 1-cloroetilo (2,64 ml) a una suspensión de N-[2-(1-bencil-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il)-4-cloro-fenil]-2-cloro-isonicotinamida (530 mg) en tolueno (30 ml). Después de 15 min. la disolución se calentó a reflujo durante 16 horas, después se vertió en una disolución acuosa saturada de NaHCO₃, y la mezcla se extrajo tres veces con CH₂Cl₂. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, y se concentraron a vacío para proporcionar el producto bruto del título (550 mg).

Etapa B: Preparación de hidrocloreto de 2-cloro-N-[4-cloro-2-(1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il)-fenil]-isonicotinamida.

Se disolvió éster 1-cloro-etílico del ácido 4-{5-cloro-2-[(2-cloro-piridin-4-carbonil)-amino]fenil}-3,6-dihidro-2H-piridin-1-carboxílico bruto (550 mg) en metanol (25 ml), y se calentó a reflujo durante 16 horas. La evaporación proporcionó el producto bruto del título (465 mg). Tiempo de retención HPLC 1,48 min.; MS (ES+) 350, 348 (M+H⁺).

EJEMPLO 8

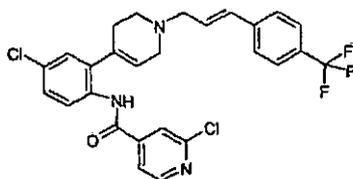
Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-(4-cloro-2-{1-[(E)-3-(4-fluorofenil)-alil]-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il}-fenil)-isonicotinamida



5 Se disolvió hidrocloreto de 4-{5-cloro-2-[(2-cloro-piridin-4-carbonil)-amino]-fenil}-1-metil-1,2,3,6-tetrahidro-piridinio bruto (69 mg; producto obtenido en el Ejemplo 7) en acetonitrilo (5 ml), y se trató con K_2CO_3 (87 mg). Después se añadió una disolución de 1-((E)-3-cloro-propenil)-4-fluorobenceno en acetonitrilo (1,0 ml). Tras agitar durante 3 horas a r.t. y 16 horas a 50°C, y calentar a reflujo durante 16 horas, la mezcla se filtró y se concentró a vacío. El residuo se sometió a cromatografía en gel de sílice (hexano:acetato de etilo:triethylamina 74:24:2) para proporcionar el producto del título (51 mg). Aceite viscoso; Tiempo de retención HPLC 2,02 min.; MS (ES+) 484, 482 (M+H⁺).

10 EJEMPLO 9

Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-(4-cloro-2-{1-[(E)-3-(4-trifluorometil-fenil)-alil]-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il}-fenil)-isonicotinamida

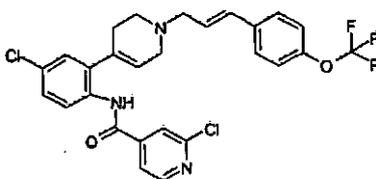


15 Se disolvió hidrocloreto de 4-{5-cloro-2-[(2-cloro-piridin-4-carbonil)-amino]-fenil}-1-metil-1,2,3,6-tetrahidro-piridinio bruto (69 mg; producto obtenido en el Ejemplo 7) en acetonitrilo (5 ml), y se trató con base de Hunig (0,068 ml). Después se añadió una disolución de 1-((E)-3-cloro-propenil)-4-trifluorometil-benceno (53 mg) en $CHCl_3$ (1,0 ml). Tras agitar durante 3 horas a r.t. y 16 horas a 50°C, y calentar a reflujo durante 16 horas, la mezcla se filtró y se concentró a vacío. El residuo se sometió a cromatografía en gel de sílice (hexano:acetato de etilo:triethylamina 74:24:2) para proporcionar el producto del título (23 mg). Aceite viscoso; Tiempo de retención HPLC 2,02 min.; MS (ES+) 534, 532 (M+H⁺).

20

EJEMPLO 10

Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-(4-cloro-2-{1-[(E)-3-(4-trifluorometoxi-fenil)-alil]-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il}-fenil)-isonicotinamida

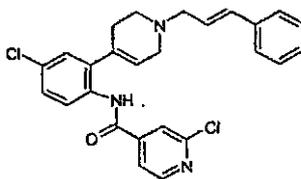


25 Se disolvió hidrocloreto de 4-{5-cloro-2-[(2-cloro-piridin-4-carbonil)-amino]-fenil}-1-metil-1,2,3,6-tetrahidro-piridinio bruto (69 mg; producto obtenido en el Ejemplo 7) en acetonitrilo (5 ml) y se trató con base de Hunig (0,068 ml). Después se añadió una disolución de 1-((E)-3-cloro-propenil)-4-trifluorometoxi-benceno (56 mg) en $CHCl_3$ (1,0 ml). Tras agitar durante 3 horas a r.t. y 16 horas a 50°C, y calentar a reflujo durante 16 horas, la mezcla se filtró y se concentró a vacío. El residuo se sometió a cromatografía en gel de sílice (hexano:acetato de etilo:triethylamina 74:24:2) para proporcionar el producto del título (46 mg). Aceite viscoso; Tiempo de retención HPLC 2,33 min.; MS (ES+) 550, 548 (M+H⁺).

30

EJEMPLO 11

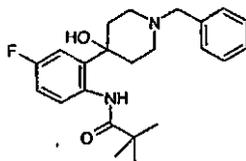
Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-(4-cloro-2-{1-((E)-3-fenil-alil)-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il}-fenil)-isonicotinamida



Se disolvió hidrocloreto de 4-{5-cloro-2-[(2-cloro-piridin-4-carbonil)-amino]-fenil}-1-metil-1,2,3,6-tetrahidropiridinio bruto (69 mg; producto obtenido en el Ejemplo 7) en acetonitrilo (5 ml), y se trató con base de Hunig (0,068 ml). Después se añadió una disolución de ((E)-3-cloro-propenil)-benceno (32 mg) en CHCl_3 (1,0 ml). Tras agitar durante 3 horas a r.t. y 16 horas a 50°C , y calentar a reflujo durante 16 horas, la mezcla se filtró y se concentró a vacío. El residuo se sometió a cromatografía en gel de sílice (hexano:acetato de etilo:triethylamina 74:24:2) para proporcionar el producto del título (36 mg). Aceite viscoso; Tiempo de retención HPLC 2,01 min.; MS (ES+) 466, 464 ($\text{M}+\text{H}^+$).

EJEMPLO 12

Este Ejemplo ilustra la preparación de N-[2-(1-bencil-4-hidroxi-piperidin-4-il)-4-fluoro-fenil]-2,2-dimetil-propionamida



Etapas A: Preparación de N-(4-fluoro-fenil)-2,2-dimetil-propionamida

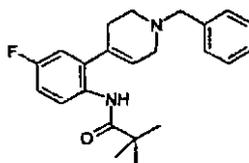
A una disolución de 4-fluoroanilina (50,0 g) y triethylamina (157 ml) en CH_2Cl_2 (700 ml) se añadió cloruro de 2,2-dimetil-propionilo (58,0 ml) durante un período de 30 minutos. La disolución resultante se agitó a r.t. durante 2 horas, después se añadió agua, y la mezcla se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, y se concentraron a vacío para proporcionar 86,0 g del compuesto del título. P.f. $124-125^\circ\text{C}$; Tiempo de retención HPLC 2,57 min.; MS (ES+) 196 ($\text{M}+\text{H}^+$).

Etapas B: Preparación de N-[2-(1-(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-4-hidroxi-piperidin-4-il)-fenil]-2,2-dimetil-propionamida

Una disolución de n-butil-litio en hexano (80,0 ml de una disolución 1,6 M) se añadió gota a gota a una disolución de N-(4-fluoro-fenil)-2,2-dimetil-propionamida (10,0 g) en THF seco (200 ml) a -5°C bajo una atmósfera de N_2 durante 15 min. La disolución resultante se agitó a 0°C durante 2 horas, y después se añadió gota a gota una disolución de 1-bencil-piperidin-4-ona (9,20 ml) en THF (20 ml) a la disolución anterior del dianión a 0°C durante un período de 1 hora. La mezcla de reacción se agitó durante 2 horas a 0°C , y después toda la noche a r.t. La disolución se vertió entonces en agua con hielo, se volvió ácida con HCl conc., y se extrajo con acetato de etilo. La capa acuosa se volvió básica, y se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua, se secaron sobre sulfato de sodio, y se concentraron a vacío. El residuo se sometió a cromatografía en gel de sílice (hexano:acetato de etilo:triethylamina 49:49:2) para proporcionar el producto del título (8,3 g). P.f. $172-173^\circ\text{C}$; Tiempo de retención HPLC 1,47 min.; MS (ES+) 385 ($\text{M}+\text{H}^+$).

EJEMPLO 13

Este Ejemplo ilustra la preparación de N-[2-(1-bencil-1,2,3,6-tetrahidropiridin-4-il)-4-fluoro-fenil]-2,2-dimetil-propionamida

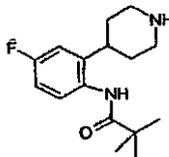


Una disolución de N-(4-fluoro-2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-4-hidroxi-piperidin-4-il}-fenil)-2,2-dimetil-propionamida (4,00 g) en HCl conc. (2,4 ml) y AcOH conc. (30 ml) se calentó a temperatura de reflujo durante 24 horas. Después, se añadió agua, y la mezcla se extrajo tres veces con CH_2Cl_2 , las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, y se concentraron a vacío. El residuo se disolvió en CH_2Cl_2 (30 ml) y se trató con triethylamina (2,8 ml) y cloruro de 2,2-dimetil-propionilo (0,61 ml). La disolución resultante se agitó a r.t. durante 2 horas, después se añadió agua, y la mezcla se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, y se concentraron a vacío. El residuo se sometió a cromatografía en gel de sílice

(hexano:acetato de etilo:triethylamina 79:19:2) para proporcionar el producto del título (3,1 g). Aceite viscoso; Tiempo de retención HPLC 2,00 min.; MS (ES+) 367 (M+H⁺).

EJEMPLO 14

Este Ejemplo ilustra la preparación de N-(4-fluoro-2-piperidin-4-il-fenil)-2,2-dimetil-propionamida



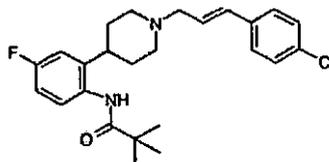
5

Una suspensión de N-[2-(1-bencil-1,2,3,6-tetrahidropiridin-4-il)-4-fluorofenil]-2,2-dimetilpropionamida (500 mg) y 10% de Pd-C (50 mg) en EtOH (50 ml) se agitó en una atmósfera de H₂ durante 16 horas. Después, la mezcla se filtró, y la disolución resultante se concentró *a vacío* para proporcionar el compuesto del título (380 mg). Aceite viscoso; Tiempo de retención HPLC 1,61 min.; MS (ES+) 279 (M+H⁺).

10

EJEMPLO 15

Este Ejemplo ilustra la preparación de N-(2-{1-[(E)-3-(4-clorofenil)alil]-piperidin-4-il}-4-fluorofenil)-2,2-dimetilpropionamida



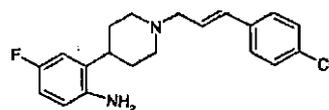
15

Se disolvió N-(4-fluoro-2-piperidin-4-il-fenil)-2,2-dimetil-propionamida (380 mg) en CHCl₃ (20 ml), y se trató con trietilamina (0,260 mg). Después, se añadió una disolución de 1-((E)-3-cloro-propenil)-4-cloro-benceno (255 mg). Tras agitar durante 16 horas a r.t., la mezcla se filtró y se concentró *a vacío*. El residuo se sometió a cromatografía en gel de sílice (hexano:acetato de etilo:triethylamina 74:24:2) para proporcionar el producto del título (380 mg). P.f. 174-176°C; Tiempo de retención HPLC 2,37 min.; MS (ES+) 4,29 (M+H⁺).

EJEMPLO 16

20

Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-il}-4-fluoro-fenilamina



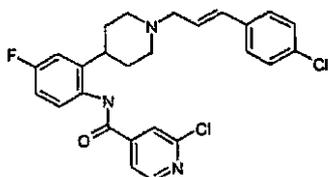
25

Una disolución de N-(2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-il}-4-fluoro-fenil)-2,2-dimetil-propionamida (315 mg) en HCl 6N (25 ml) y AcOH conc. (25 ml) se calentó a temperatura de reflujo durante 20 horas. Después, la disolución se volvió básica (pH = 12) mediante adición de NaOH sólido, y se extrajo tres veces con CH₂Cl₂. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron *a vacío*. El residuo se sometió a cromatografía en gel de sílice (hexano:acetato de etilo:triethylamina 79:19:2) para proporcionar el producto del título (201 mg). P.f. 93-94°C; Tiempo de retención HPLC 2,18 min.; MS (ES+) 345 (M+H⁺).

EJEMPLO 17

30

Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-(2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-il}-4-fluoro-fenil)-isonicotinamida

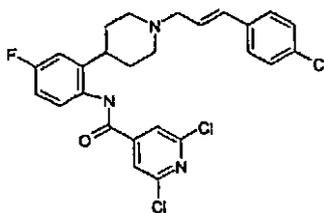


A una disolución de 2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-il}-4-fluoro-fenilamina (40 mg) y trietilamina (0,025 ml) en CHCl_3 (10 ml) se añadió cloruro de 2-cloro-isonicotinoilo (1,2 equivalentes; como una disolución 1,0 M en CH_2Cl_2) durante un período de 10 minutos. La disolución resultante se agitó a r.t. toda la noche, se vertió en disolución acuosa saturada de NaHCO_3 , y la mezcla se extrajo tres veces con CH_2Cl_2 . Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, y se concentraron a *vacío*. El residuo se sometió a cromatografía en gel de sílice (acetato de etilo:metanol 9:1) para proporcionar el producto del título (43 mg). Sólido blanco; Tiempo de retención HPLC 2,36 min.; MS (ES+) 486, 484 ($\text{M}+\text{H}^+$).

Según este método, los siguientes compuestos se han preparado partiendo de 2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-il}-4-fluoro-fenilamina:

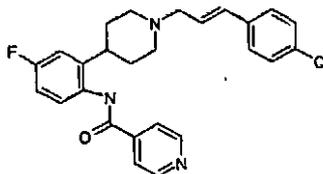
- 2,6-Dicloro-N-(2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-il}-4-fluorofenil)-isonicotinamida

Sólido blanco; Tiempo de retención HPLC 2,67 min.; MS (ES+) 520, 518 ($\text{M}+\text{H}^+$).



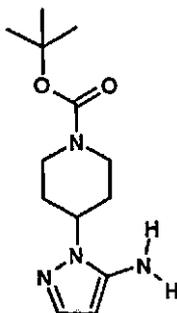
- N-(2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-il}-4-fluoro-fenil)-isonicotinamida

Sólido blanco; Tiempo de retención HPLC 2,07 min.; MS (ES+) 450 ($\text{M}+\text{H}^+$).



EJEMPLO 18

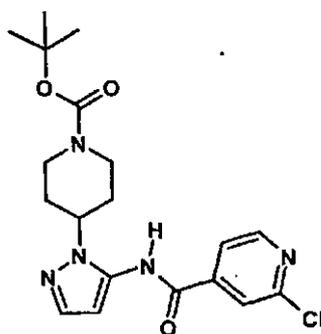
Este Ejemplo ilustra la preparación de éster terc-butílico del ácido 4-(5-amino-pirazol-1-il)-piperidin-1-carboxílico



Una disolución de 2-cianoetil hidrazina (5,1 g) en etanol absoluto (20 ml) se añadió gota a gota a una disolución de N-BOC-piperidona (12 g) en etanol absoluto a temperatura ambiente. La disolución resultante se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora, después el disolvente se eliminó a *vacío*. El aceite resultante se añadió entonces a una disolución de butóxido de sodio (preparada a partir de 2,8 g de sodio y 60 ml de n-butanol), y la mezcla de reacción se puso a reflujo durante 3 horas, se enfrió hasta la temperatura ambiente, se lavó con cloruro de amonio acuoso saturado, después con agua, y el disolvente se eliminó a *vacío*. La precipitación en hexano proporcionó el compuesto del título (11,5 g) como un polvo amarillo. P.f. 145-147°C; RMN ^1H (400 MHz, CDCl_3) 1,5 (s, 9H), 1,9 (m, 2H), 2,1 (m, 2H), 2,9 (m, 2H), 3,5 (m, 2H), 4,0 (m, 1H), 4,2 (m, 2H), 5,5 (s, 1H), 7,3 (s, 1H).

EJEMPLO 19

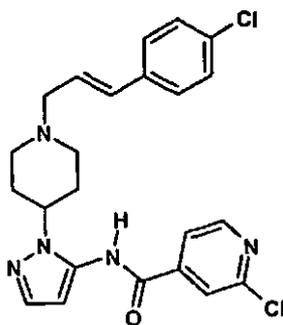
Este Ejemplo ilustra la preparación de éster terc-butílico del ácido 4-{5-[(2-cloro-piridin-4-carbonil)-amino]-pirazol-1-il}-piperidin-1-carboxílico



Se añadió trietilamina (2,8 ml) a una disolución agitada del compuesto obtenido en el Ejemplo 18 (2,66 g) en diclorometano (100 ml); la disolución se enfrió hasta 0°C, y se añadió cloruro de 2-cloroisonicotinoilo (preparado a partir de 2,05 g de ácido 2-cloroisonicotínico y 1,46 ml de cloruro de oxalilo en 50 ml de diclorometano). La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas, se vertió en agua, se extrajo dos veces con diclorometano; las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, y se concentraron a *vacío*. El residuo se precipitó en acetato de etilo/hexano para proporcionar el compuesto del título como un polvo amarillo pálido (3,4 g). P.f. 209-210°C; RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) 1,5 (s, 9H), 1,9 (m, 2H), 2,1 (m, 2H), 2,9 (m, 2H), 3,5 (m, 2H), 4,0 (m, 1H), 4,2 (m, 2H), 6,1 (s, 1H), 7,5 (s, 1H), 7,6 (m, 1H), 7,7 (s, 1H), 8,2 (sm, 1H), 8,5 (d, J = 6 Hz, 1H).

EJEMPLO 20

Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-(2-{1-[3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-il}-2H-pirazol-3-il)-isonicotinamida



Una disolución del compuesto obtenido en el Ejemplo 19 (2,7 g) en diclorometano (150 ml) se trató con ácido trifluoroacético (3,8 ml) durante 6 horas a temperatura ambiente, y el disolvente se eliminó a *vacío*. El residuo se disolvió en acetonitrilo (100 ml), se añadieron N,N-diisopropiletilamina (9 ml) y cloruro de 4-clorocinamilo (1,9 g). La disolución resultante se agitó durante 24 horas a temperatura ambiente, el disolvente se eliminó a *vacío*, y el residuo se sometió a cromatografía en gel de sílice (acetato de etilo:metanol 95:5) para proporcionar un producto identificado como 2-{1-[3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-il}-2H-pirazol-3-ilamina. Este producto se volvió a acilar usando 1,05 g de cloruro de 2-cloroisonicotinoilo, 0,7 ml de trietilamina en 50 ml de diclorometano según el método descrito en la Etapa B. La cromatografía en gel de sílice del residuo (acetato de etilo:metanol 95:5) proporcionó finalmente el producto del título (370 mg). P.f. 69-70°C. RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) 1,9-2,4 (m, 6H), 3,0 (d, J = 11,6 Hz, 2H), 3,1 (d, J = 6,4 Hz, 2H), 3,9 (m, 1H), 6,2 (m, 2H), 6,5 (d, J = 16,0 Hz, 1H), 7,3 (m, 4H), 7,5 (s, 1H), 7,6 (s, 1H), 7,7 (br s, 1H), 8,6 (d, J = 4,8 Hz, 1H). Tiempo de retención HPLC 2,32 min.; MS (ES⁺) 456/458 (M+H⁺).

La invención se ilustra adicionalmente mediante los siguientes Ejemplos, aplicando reacciones de acoplamiento cruzado.

EJEMPLO 21

Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-{1'-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-1',2',3',4',5',6'-hexahidro-[2,4']bipiridinil-3-il}-isonicotinamida.



5 Etapa A: Se disolvió 1-(t-butoxicarbonil)-4-tributylestannil-1,2,3,6-tetrahidropiridina (2,12 g, preparada en 2 etapas a partir de 1-(t-butoxicarbonil)-piperidin-4-ona según el documento WO 0123381) en tolueno (45 ml) en un matraz seco inundado de nitrógeno. Se añadieron 2-cloro-3-nitropiridina (712 mg) y tetraquis(trifenilfosfina)paladio (130 mg), y la disolución se calentó a 110°C durante 16 horas. La mezcla de reacción se enfrió hasta la temperatura ambiente, el disolvente se eliminó a *vacío*, y el residuo se repartió entre acetato de etilo (100 ml) y NaOH 2N (100 ml). Después de 30 min. agitando a temperatura ambiente, la capa orgánica se separó, se lavó con NaOH 2N, después con agua, se secó sobre sulfato de sodio, y se concentró a *vacío*. El residuo se sometió a cromatografía en gel de sílice (acetato de etilo:ciclohexano 3:7) para proporcionar éster terc-butílico del ácido 3-nitro-3',6'-dihidro-2'H-[2,4']bipiridinil-1'-carboxílico (1,1 g) como cristales amarillos claros. P.f. 104-105°C; RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) 1,4 (s, 9H), 2,5 (m, 2H), 3,6 (m, 2H), 4,0 (m, 2H), 5,9 (m, 1H), 7,3 (dd, J = 4,8, 8,4 Hz, 1H), 8,0 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 8,7 (d, J = 4,8 Hz, 1H); MS (ES+) 206 (MH+ -BOC), 248 (MH+ -isopreno).

15 Etapa B: Se añadió monohidrato de hidrazina (0,4 ml) a una suspensión de níquel Raney (suspensión al 50% en agua, 200 mg) y el producto obtenido en la Etapa A (240 mg) en etanol (10 ml). Después de 4 horas agitando, la mezcla de reacción se filtró sobre Hyflo, y el disolvente se eliminó a *vacío*. El residuo se disolvió en acetato de etilo, se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró a *vacío* para proporcionar éster terc-butílico del ácido 3-amino-3',6'-dihidro-2'H-[2,4']bipiridinil-1'-carboxílico (200 mg) como cristales blancos. P.f. 104-105°C; RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) 1,4 (s, 9H), 2,5 (m, 2H), 3,6 (m, 2H), 3,7 (brs, 2H), 4,0 (m, 2H), 5,9 (m, 1H), 6,9 (m, 2H), 8,0 (m, 1H); MS (ES+) 176 (MH+ -BOC), 220 (MH+ -isopreno), 276 (MH⁺).

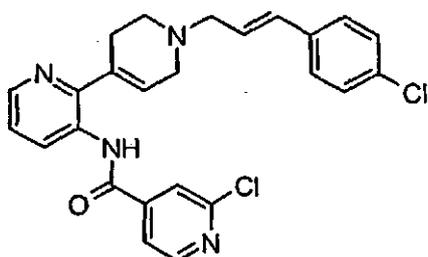
20 Etapa C: El producto obtenido en la Etapa B (815 mg) se redujo mediante hidrogenación por transferencia usando 10% de Pd/C (200 mg) y formiato de amonio (935 mg) en etanol (40 ml) a 60°C durante 45 min. Tras filtrar sobre Hyflo, el disolvente se eliminó a *vacío*. El residuo se repartió entre acetato de etilo y agua, la capa orgánica se separó, se lavó con agua, se secó sobre sulfato de sodio, y se concentró a *vacío* para dar éster terc-butílico del ácido 3-amino-3',4',5',6'-dihidro-2'H-[2,4']bipiridinil-1'-carboxílico (785 mg) como un aceite. RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) 1,4 (s, 9H), 1,6 (m, 4H), 2,7 (m, 3H), 3,5 (brs, 2H), 4,0 (m, 2H), 6,9 (m, 2H), 8,0 (m, 1H); MS (ES+) 178 (MH+ -BOC), 222 (MH+ -isopreno), 278 (MH⁺).

30 Etapa D: se añadió bicarbonato de sodio (714 mg) a una disolución agitada del compuesto obtenido en la Etapa C (785 mg) en diclorometano (30 ml); la disolución se trató entonces con cloruro de 2-cloro-isonicotinoilo (500 mg), y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora, se vertió en agua, se extrajo dos veces con diclorometano, las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron a *vacío* para proporcionar éster terc-butílico del ácido 3-[(2-cloro-piridin-4-carbonil)-amino]-3',4',5',6'-tetrahidro-2'H-[2,4']bipiridinil-1'-carboxílico (1,2 g).

35 Etapa E: Una disolución del compuesto obtenido en la Etapa D (834 mg) en diclorometano (40 ml) se trató con ácido trifluoroacético (4 ml) durante 5 horas a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se concentró a *vacío*, y después se secó a alto vacío durante 1 hora. El residuo se disolvió en acetonitrilo (40 ml), y se añadieron diisopropiletilamina (1,8 ml) y cloruro de 4-clorocinamilo (380 mg). La disolución se agitó 20 horas a temperatura ambiente, el disolvente se eliminó a *vacío*, y el residuo se sometió a cromatografía en gel de sílice (acetato de etilo:metanol 95:5) para proporcionar el producto del título (409 mg) como un sólido amarillo. P.f. 78-80°C; RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) 1,9 (m, 2H), 2,2 (m, 4H), 2,8 (m, 1H), 3,2 (d, J = 9 Hz, 2H), 3,3 (m, 2H), 6,2 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6,5 (d, J = 18 Hz, 1H), 7,1-7,3 (m, 5H), 7,6 (d, J = 4,4 Hz, 1H), 7,7 (s, 1H), 7,9 (m, 1H, NH), 8,0 (d, J = 7,6 Hz, 1H), 8,6 (d, J = 3,6 Hz, 1H), 8,7 (d, J = 5,5 Hz, 1H); Tiempo de retención HPLC 1,53 min.; MS (ES+) 467/469 (M+H⁺).

EJEMPLO 22

Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-{1'-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-1',2',3',6'-hexahidro-[2,4']bipiridinil-3-il}-isonicotinamida.



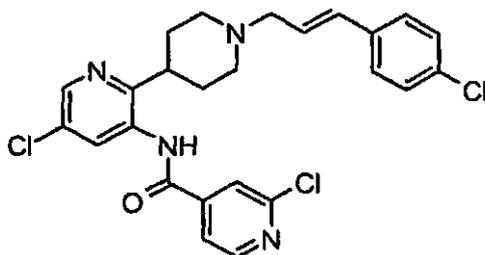
5 Se trató éster terc-butílico del ácido 3-amino-3',6'-dihidro-2'H-[2,4']bipiridinil-1'-carboxílico (Ejemplo 1, Etapa B, 205 mg) como se describe en el Ejemplo 1, etapas D y E, para proporcionar el producto del título (182 mg) como un sólido amarillo. P.f. 75-77°C; RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) 1,8 (m, 2H), 2,7 (m, 2H), 2,8 (m, 2H), 3,2 (m, 2H), 3,3 (m, 2H), 6,0 (s, 1H), 6,2 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6,5 (d, J = 18 Hz, 1H), 7,1-7,3 (m, 6H), 7,6 (m, 1H), 7,7 (s, 1H), 7,7 (s, 1H), 8,3 (d, J = 3,6 Hz, 1H), 8,5 (d, J = 5,5 Hz, 1H), 8,8 (m, 1H, NH); Tiempo de retención HPLC 1,51 min.; MS (ES+) 465/467 (M+H⁺).

Los siguientes compuestos se prepararon según procedimientos análogos a aquellos descritos en el Ejemplo 22:

Nombre de compuesto	Estructura	P.f. (°C)	MH ⁺	Tiempo de retención (min.)
2-cloro-N-{1'-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-1',2',3',6'-hexahidro-[2,4']bipiridinil-3-il}-isonicotinamida			499/501/503	1,64

10 EJEMPLO 23

Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-{5-cloro-1'-[(E)-3-(4-clorofenil)-alil]-1',2',3',4',5',6'-hexahidro-[2,4']bipiridinil-3-il}-isonicotinamida.



15 Una mezcla de trimetilclorosilano y 1,2-dibromoetano (7:5 v/v, 0,125 ml) se añadió gota a gota (manteniendo la T°C por debajo de 50°C) a una suspensión de polvo de cinc (422 mg) en dimetilacetamida (3 ml). La mezcla se agitó 20 min. a temperatura ambiente, después se añadió gota a gota durante 5 min. (ligeramente exotérmica) una disolución de 1-(t-butoxicarbonil)-4-yodo-piperidina (1,62 g, preparada en 2 etapas a partir de 1-(t-butoxicarbonil)-piperidin-4-ona según J. Org. Chem. 2004, 5120) en dimetilacetamida (3 ml). La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 30 min., después se canuló en una mezcla de 2,5-dicloro-3-aminopiridina (603 mg), yoduro de cobre(I) (42 mg) y PdCl₂(dppf) (91 mg) en dimetilacetamida (5 ml). La mezcla resultante se agitó a 80°C durante 3
20 horas, se enfrió hasta la temperatura ambiente, se vertió en agua, se extrajo con acetato de etilo, se secó sobre sulfato de sodio, y se concentró a vacío. El residuo se sometió a cromatografía en gel de sílice (acetato de etilo:ciclohexano 3:7) para proporcionar éster terc-butílico del ácido 3-amino-5-cloro-3',6'-dihidro-2'H-[2,4']bipiridinil-1'-carboxílico (535 mg) como un sólido amarillo. RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) 1,4 (s, 9H), 1,8 (m, 4H), 2,6 (m, 1H), 2,8 (m, 2H), 3,7 (br s, 2H), 4,2 (m, 2H), 6,9 (s, 1H), 7,9 (s, 1H).

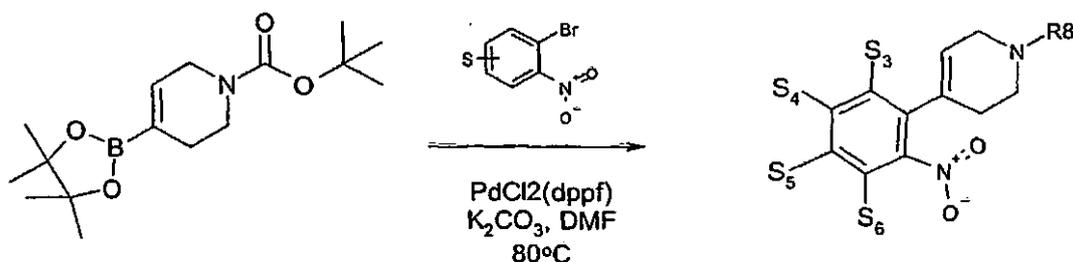
25 El producto así obtenido (448 mg) se trató como se describe en el Ejemplo 1, Etapas D y E, para proporcionar el producto del título (455 mg) como un sólido blanco. P.f. 63-67°C; RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃) 1,9 (m, 2H), 2,2 (m, 4H), 2,7 (m, 1H), 3,2 (m, 2H), 3,3 (m, 2H), 6,2 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6,5 (d, J = 18 Hz, 1H), 7,1-7,3 (m, 4H), 7,7 (d, J

= 5,2 Hz, 1H), 7,8 (s, 1H), 7,9 (m, 1H, NH), 8,3 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,4 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,6 (d, J = 4,8 Hz, 1H), 8,7 (d, J = 5,5 Hz, 1H); Tiempo de retención HPLC 1,53 min.; MS (ES+) 501/503/505 (M+H⁺).

Los siguientes compuestos se prepararon según procedimientos análogos a aquellos descritos en el Ejemplo 23:

Nombre de compuesto	Estructura	P.f. (°C)	MH ⁺	Tiempo de retención (min.)
2-cloro-N-{4-cloro-1'-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-1',2',3',4',5',6'-hexahidro-[2,4']bipiridinil-3-il}-isonicotinamida		80-85	499/501/503	1,55
N-(5-bromo-3-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-il}-pirazin-2-il)-2-cloro-isonicotinamida			548/550	1,33

- 5 Los siguientes compuestos (Tablas EX23.1 - EX23.11) se prepararon aplicando reacciones de acoplamiento cruzado de Suzuki como se describe en los Esquemas 8-13. Se aplicaron condiciones de reacción descritas en la bibliografía [P.R Eastwood, THL 41, 3705 (2000), por ejemplo] o como se describe en lo anterior.



10

Tabla EX23.1

Compuesto n°	R ⁸	S ₃	S ₄	S ₅	S ₆	P.f. (°C)	MH ⁺ -BOC	Tiempo de retención (min.)
EX23-1-2	BOC	H	H	F	H		323/322	2,22
EX23-1-3	BOC	H	H	CF ₃	H		373/372	2,30
EX23-1-4	BOC	H	H	OCH ₃	H		235/234	2,23
EX23-1-5	BOC	CH ₃	H	H	H		219/220	2,19
EX23-1-6	BOC	H	H	H	CH ₃	100-102	219/220	2,22
EX23-1-7	BOC	H	H	COOCH ₃	H		263/264	2,08

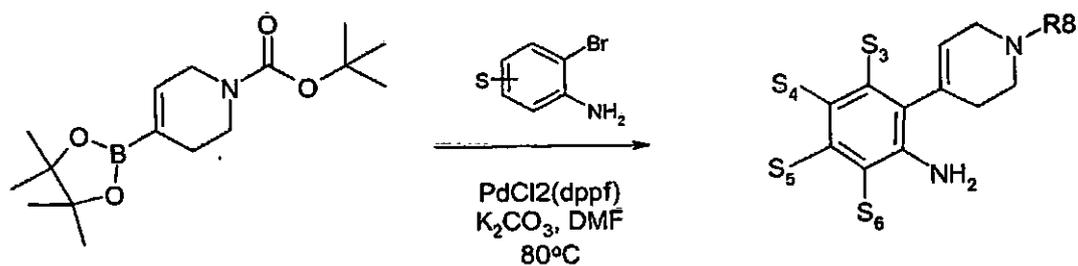
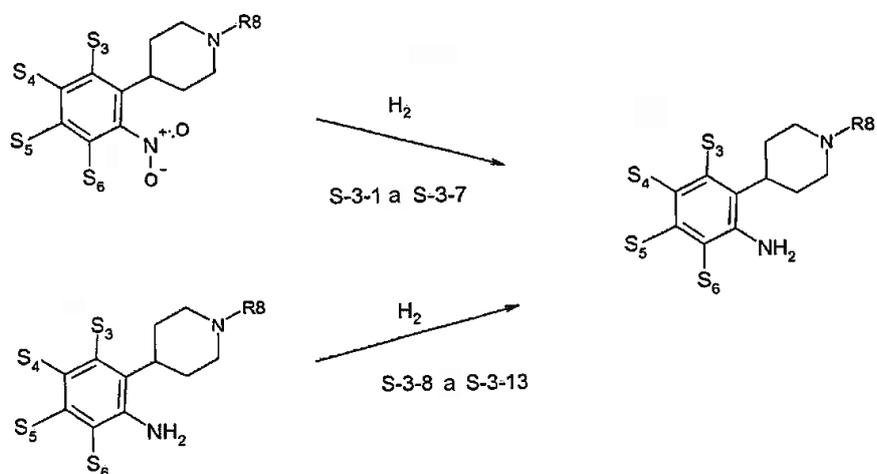


Tabla EX23.2

Compuesto nº	R ⁸	S ₃	S ₄	S ₅	S ₆	P.f. (°C)	MH ⁺ -BOC	Tiempo de retención (min)
EX23-2-1	BOC	H	H	H	F	100-102	19/3194	2,15
EX23-2-2	BOC	H	F	H	F		211/210	2,12
EX23-2-3	BOC	H	i-Pr	H	H		217/216	2,11
EX23-2-4	BOC	H	F	F	F		229/230	2,21
EX23-2-5	BOC	H	OCF ₃	H	H		259/260	2,22
EX23-2-6	BOC	H	F	H	H		193/194	2,02



5

Tabla EX23.3

Compuesto nº	R ⁸	S ₃	S ₄	S ₅	S ₆	P.f. (°C)	MH ⁺ -BOC	Tiempo de retención (min.)
EX23-3-1	BOC	H	H	CH ₃	H		191/192	1,90
EX23-3-2	BOC	H	H	F	H		195/196	2,05
EX23-3-3	BOC	H	H	CF ₃	H		245/246	2,22
EX23-3-4	BOC	H	H	OCH ₃	H		207/208	1,92

Compuesto nº	R ⁸	S ₃	S ₄	S ₅	S ₆	P.f. (°C)	MH ⁺ -BOC	Tiempo de retención (min.)
EX23-3-5	BOC	CH ₃	H	H	H		191/192	1,87
EX23-3-6	BOC	H	H	H	CH ₃		191/192	2,06
EX23-3-7	BOC	H	H	COOCH ₃	H		235/236	2,00
EX23-3-8	BOC	H	H	H	F	123-126	195/196	2,12
EX23-3-9	BOC	H	F	H	F		213/214	2,10
EX23-3-10	BOC	H	i-Pr	H	H		219/220	2,00
EX23-3-11	BOC	H	F	F	F		231/232	2,16
EX23-3-12	BOC	H	OCF ₃	H	H		261/262	2,18
EX23-3-13	BOC	H	F	H	H		195/196	1,87

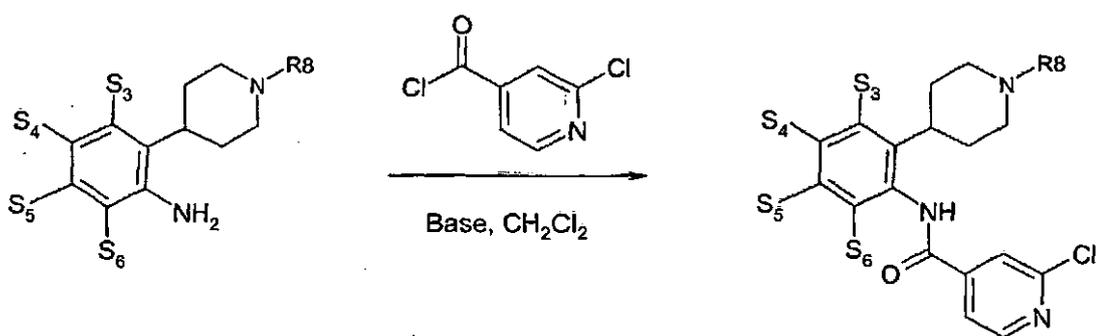


Tabla EX23.4

Compuesto nº	R ⁸	S ₃	S ₄	S ₅	S ₆	P.f. (°C)	MH ⁺ -BOC	Tiempo de retención (min.)
EX23-4-1	BOC	H	H	CH ₃	H	amorfo	330/332/333	2,14
EX23-4-2	BOC	H	H	F	H	amorfo	334/336/337	2,11
EX23-4-3	BOC	H	H	CF ₃	H	amorfo	384/386/387	2,22
EX23-4-4	BOC	H	H	OCH ₃	H	amorfo	346/348/349	2,07
EX23-4-5	BOC	CH ₃	H	H	H	amorfo	330/332/333	2,04
EX23-4-6	BOC	H	H	H	CH ₃		330/332/333	2,06
EX23-4-7	BOC	H	H	COOCH ₃	H	amorfo	374/376/377	2,05
EX23-4-8	BOC	H	H	H	F	amorfo	334/336/337	2,02
EX23-4-9	BOC	H	F	H	F	amorfo	352/354/355	2,08
EX23-4-10	BOC	H	i-Pr	H	H	amorfo	358/360/361	2,25
EX23-4-11	BOC	H	F	F	F	amorfo	370/372/372	2,25
EX23-4-12	BOC	H	OCF ₃	H	H	227-230	400/402/403	2,22

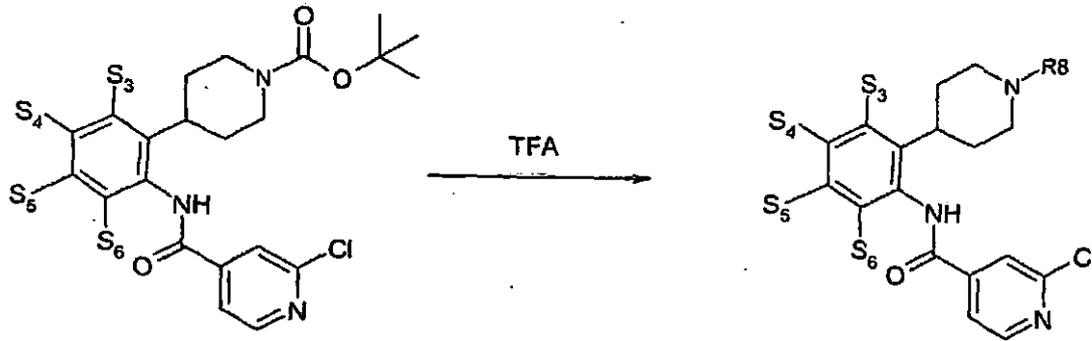


Tabla EX23.5

Compuesto n° .	R ⁸	S ₃	S ₄	S ₅	S ₆	P.f. (°C)	MH ⁺	Tiempo de retención (min)
EX23-5-1	H	H	H	CH ₃	H	amorfo	330/332/333	1,17
EX23-5-2	H	H	H	F	H	amorfo	334/336/337	1,18
EX23-5-3	H	H	H	CF ₃	H	amorfo	384/386/387	1,35
EX23-5-4	H	H	H	OCH ₃	H	amorfo	346/348/349	1,17
EX23-5-5	H	CH ₃	H	H	H	amorfo	330/332/333	1,12
EX23-5-6	H	H	H	H	CH ₃	amorfo	330/332/333	1,15
EX23-5-7	H	H	H	COOCH ₃	H	amorfo	374/376/377	1,13
EX23-5-8	H	H	H	H	F	amorfo	334/336/337	1,14
EX23-5-9	H	H	F	H	F	amorfo	352/354/355	1,22
EX23-5-10	H	H	i-Pr	H	H	amorfo	358/360/361	1,37
EX23-5-11	H	H	F	F	F	amorfo	370/372/372	1,28
EX23-5-12	H	H	OCF ₃	H	H	amorfo	400/402/403	1,30

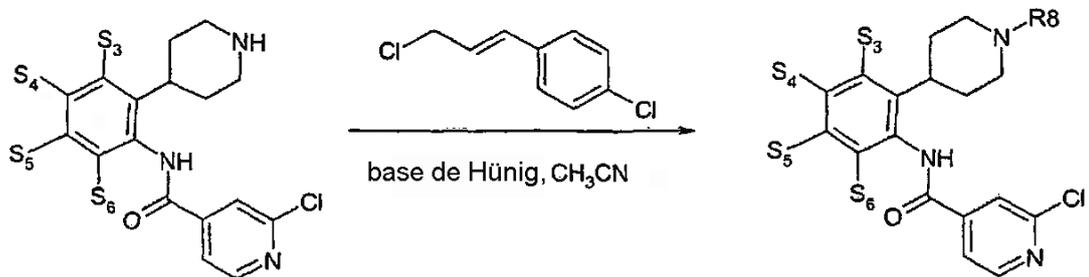


Tabla EX23.6

Compuesto n°	R ⁸	S ₃	S ₄	S ₅	S ₆	P.f. (°C)	MH ⁺	Tiempo de retención (min.)
EX23-6-1	4-clorocinamilo	H	H	CH ₃	H	203-206	480/482/483	1,51
EX23-6-2	4-clorocinamilo	H	H	F	H		484/486/487	1,49

Compuesto n°	R ^b	S ₃	S ₄	S ₅	S ₆	P.f. (°C)	MH ⁺	Tiempo de retención (min.)
EX23-6-3	4-clorocinamilo	H	H	CF ₃	H		534/536/537	1,59
EX23-6-4	4-clorocinamilo	H	H	OCH ₃	H		496/498/499	1,47
EX23-6-5	4-clorocinamilo	CH ₃	H	H	H	amorfo	480/482/483	1,49
EX23-6-6	4-clorocinamilo	H	H	H	CH ₃	90-93	480/482/483	1,54
EX23-6-7	4-clorocinamilo	H	H	COOCH ₃	H	92-95	524/526/527	1,52
EX23-6-8	4-clorocinamilo	H	H	H	F		484/486/487	1,44
EX23-6-9	4-clorocinamilo	H	F	H	F	221-223	502/504/505	1,49
EX23-6-10	4-clorocinamilo	H	i-Pr	H	H	amorfo	508/510/511	1,61
EX23-6-11	4-clorocinamilo	H	F	F	F	amorfo	520/522/523	1,53
EX23-6-12	4-clorocinamilo	H	OCF ₃	H	H		550/552/553	1,61
EX23-6-13	4-clorocinamilo	H	F	H	H	165-167	484/486/487	1,49

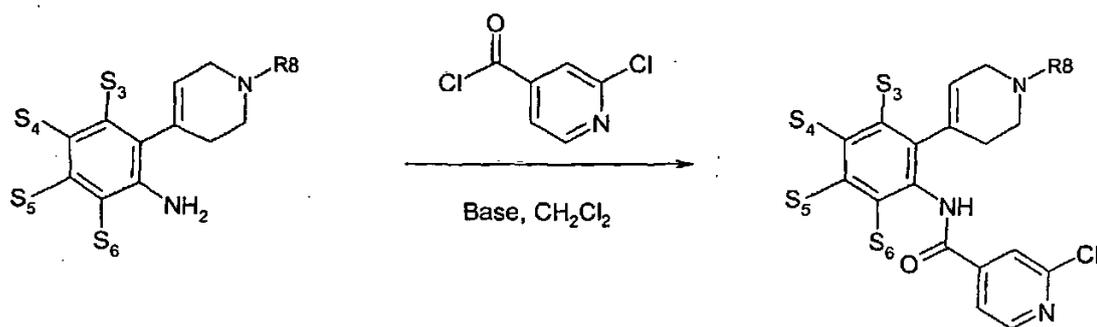


Tabla EX23.7

Compuesto n°	R ^b	S ₃	S ₄	S ₅	S ₆	P.f. (°C)	MH ⁺ -BOC	Tiempo de retención (min.)
EX23-7-1	BOC	H	F	H	F	amorfo	350/352/353	2,07
EX23-7-2	BOC	H	i-Pr	H	H	167-169	356/358/359	2,27
EX23-7-3	BOC	H	F	F	F	169-171	368/370/371	2,13
EX23-7-4	BOC	H	OCF ₃	H	H	amorfo	398/400/401	2,23
EX23-7-5	BOC	H	F	H	H	amorfo	332/334/335	2,12

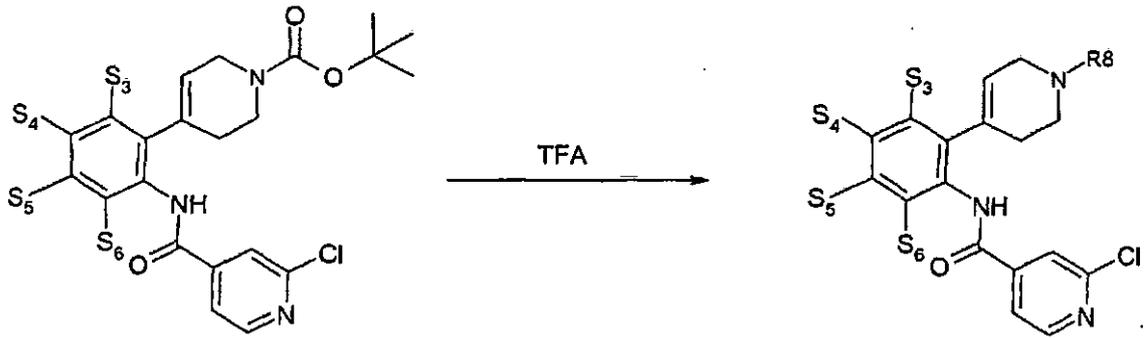


Tabla EX23.8

Compuesto nº	R ⁸	S ₃	S ₄	S ₅	S ₆	P.f. (°C)	MH ⁺	Tiempo de retención (min.)
EX23-8-1	H	H	F	H	F			
EX23-8-2	H	H	i-Pr	H	H	amorfo	356/358/359	1,33
EX23-8-3	H	H	F	F	F			
EX23-8-4	H	H	OCF ₃	H	H	amorfo	398/400/401	1,37
EX23-8-5	H	H	F	H	H	amorfo	332/334/335	1,09

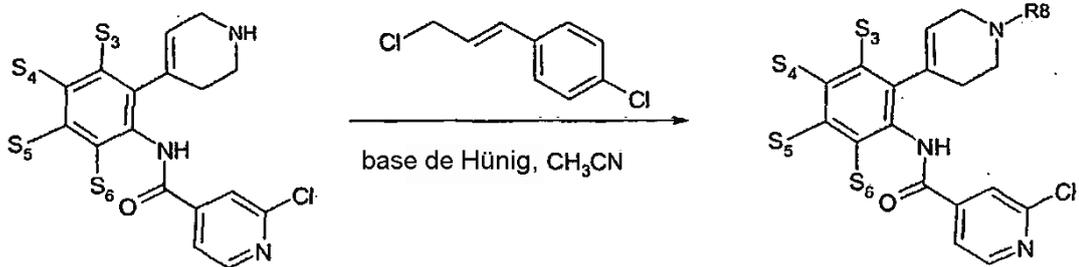


Tabla EX23.9

Compuesto nº	R ⁸	S ₃	S ₄	S ₅	S ₆	P.f. (°C)	MH ⁺	Tiempo de retención (min.)
EX23-9-1	4-clorocinamilo	H	F	H	F			
EX23-9-2	4-clorocinamilo	H	i-Pr	H	H	amorfo	506/508/509	1,67
EX23-9-3	4-clorocinamilo	H	F	F	F			
EX23-9-4	4-clorocinamilo	H	OCF ₃	H	H		548/550/551	1,66
EX23-9-5	4-clorocinamilo	H	F	H	H	amorfo	482/484/485	1,47

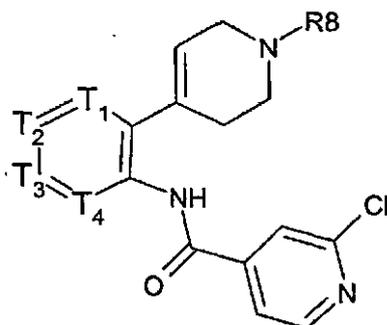


Tabla EX23.10

Compuesto nº	R ⁸	T ₁	T ₂	T ₃	T ₄	P.f. (°C)	MH ⁺	Tiempo de retención (min.)
EX23-10-1	4-clorocinamilo	N	C-Me	CH	CH		420/422	1,27
EX23-10-2	4-bromocinamilo	N	C-Me	CH	CH		525/526	1,29
EX23-10-3	4-clorocinamilo	N	C-Br	CH	N		546/548	1,37
EX23-10-4	4-clorocinamilo	CH	N	C-Cl	N		502/504	1,30
EX23-10-5	4-clorocinamilo	C-Cl	N	CH	CH		501/503	1,54
EX23-10-6	4-clorocinamilo	C-Cl	N	C-Cl	CH		535/537	1,63
EX23-10-7	4-clorocinamilo	CH	C-CF ₃	CH	N		533/535	1,39
EX23-10-8	4-clorocinamilo	N	C-Cl	CH	CH		501/503	1,34
EX23-10-9	4-bromocinamilo	N	C-Cl	CH	CH		545/547	1,36
EX23-10-10	4-clorocinamilo	S	CH	CH	-		470/472	1,38
EX23-10-11	4-clorocinamilo	S	C-Cl	CH	-		506/508	1,43

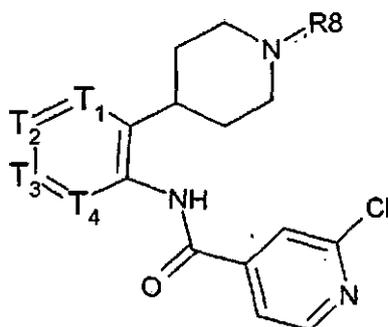


Tabla EX23.11

Compuesto nº	R ⁸	T ₁	T ₂	T ₃	T ₄	P.f. (°C)	MH ⁺	Tiempo de retención (min.)
EX23-11-1	4-clorocinamilo	N	C-Me	CH	CH		481/483	1,33
E23-11-2	4-bromocinamilo	N	C-Me	CH	CH		527/529/530	1,33

Compuesto n°	R ⁸	T ₁	T ₂	T ₃	T ₄	P.f. (°C)	MH ⁺	Tiempo de retención (min.)
EX23-11-3	4-clorocinamilo	CH	CF ₃	CH	N		535/537	1,35
EX23-11-4	4-bromocinamilo	CH	CF ₃	CH	N		581/582.5	1,36

EJEMPLO 24

Este ejemplo ilustra las propiedades plaguicidas/insecticidas de compuestos de fórmula (I). Los ensayos se realizaron como sigue:

5 *Spodoptera littoralis* (oruga de las hojas de algodón egipcio)

Se pusieron discos de hojas de algodón sobre agar en una placa de microtitulación de 24 pocillos y se pulverizaron con disoluciones de ensayo a una tasa de aplicación de 200 ppm. Después del secado, los discos de hojas se infestaron con 5 larvas L₁. Las muestras se comprobaron en cuanto a mortalidad, efecto repelente, comportamiento de alimentación, y regulación del crecimiento 3 días después del tratamiento (DAT). Los compuestos siguientes daban al menos 80% de control de *Spodoptera littoralis*: laaa-3 e laaa-49.

10 *Heliothis virescens* (oruga de los brotes del tabaco):

Se pusieron huevos (0-24 h desde la puesta) en placas de microtitulación de 24 pocillos sobre dieta artificial, y se trataron con disoluciones de ensayo a una tasa de aplicación de 200 ppm por pipeteado. Después de un periodo de incubación de 4 días, las muestras se comprobaron respecto a mortalidad de los huevos, mortalidad de las larvas, y regulación del crecimiento. Los siguientes compuestos dieron al menos 80% de control de *Heliothis virescens*: la-49, la-50, la-53, laaa-3, laaa-26, laaa-49, laaa-52, laab-26 e laac-26.

15 *Plutella xilostella* (polilla de dorso adiamantado):

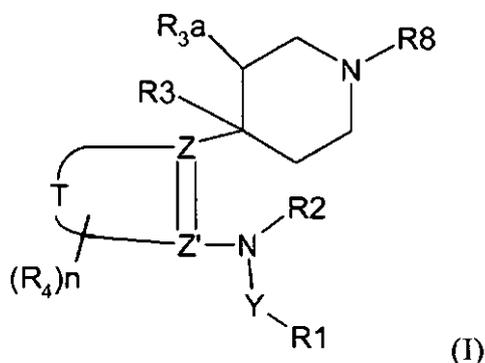
Se trataron placas de microtitulación de 24 pocillos (MTP) que contenían una dieta artificial con disoluciones de ensayo a una tasa de aplicación de 18,2 ppm por pipeteado. Después del secado, se infestaron las MTP con larvas (L2) (10-15 por pocillo). Después de un periodo de incubación de 5 días, las muestras se comprobaron respecto a mortalidad de las larvas, efecto anti-alimentador y regulación del crecimiento. Los siguientes compuestos dieron al menos 80% de control de *Plutella xilostella*: la-49, la-53, laaa-3, laaa-26, laaa-49 e laac-26.

20 *Aedes aegypti* (mosquito de la fiebre amarilla)

Se pusieron 10-15 larvas de *Aedes* (L2) junto con una mezcla de nutrición en placas de microtitulación de 96 pocillos. Se pipetearon en los pocillos las disoluciones de ensayo a una tasa de aplicación de 2 ppm. Dos días más tarde, los insectos se comprobaron respecto a mortalidad e inhibición del crecimiento. Los siguientes compuestos dieron al menos 80% de control de *Aedes aegypti*: la-53, laaa-3, laaa-26, laaa-49, laaa-52, laab-26, laac-26 e laai-26.

REIVINDICACIONES

1. Un método para combatir y controlar insectos o ácaros, que comprende aplicar a una plaga, a un lugar de una plaga, a una planta susceptible al ataque por una plaga, una cantidad insecticida o acaricida eficaz de un compuesto de fórmula I:

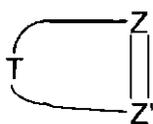


5

en la que

Y es un enlace sencillo, C=O o C=S;

el anillo



10

es un anillo de benceno, piridina, pirimidina, pirazina, piridazina, triazina, pirrol, imidazol, quinolina, isoquinolina, tiofeno, pirazol, oxazol, tiazol, isoxazol, isotiazol, [1,2,3]triazol, [1,2,3]oxadiazol o [1,2,3]tiadiazol;

15

R¹ es hidrógeno, alquilo de C₁₋₆, cianoalquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, cicloalquil C₃₋₇-alquilo de (C₁₋₄), alcoxi de C₁₋₆-alquilo de (C₁₋₆), heteroaril-alquilo de (C₁₋₆) (en el que el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfinilo, alquil C₁₋₆-tio, alcoxi de C₁₋₆-carbonilo, alquil C₁₋₆-carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), aril-alquilo de (C₁₋₆) (en el que el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfinilo, alquil C₁₋₆-tio, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, alquil C₁₋₆-carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema arílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), alquil C₁₋₆-carbonilamino-alquilo (C₁₋₆), arilo (el cual puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfinilo, alquil C₁₋₆-tio, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, alquil C₁₋₆-carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema arílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), heteroarilo (el cual puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfinilo, alquil C₁₋₆-tio, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, alquil C₁₋₆-carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, fenoxi (en el que el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroariloxi (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆), heterocicliloxi (opcionalmente sustituido con halo, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆), ciano, alqueno de C₂₋₆, alquino de C₂₋₆, cicloalquilo de C₃₋₆, cicloalqueno de C₅₋₇, heterociclilo (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆), alquil C₁₋₆-tio, haloalquil C₁₋₆-tio o NR¹³R¹⁴, en el que R¹³ y R¹⁴ son independientemente hidrógeno, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆-alquilo de (C₁₋₆), fenilo (el cual puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino o alcoxi de C₁₋₄-carbonilo), fenil-alquilo de (C₁₋₆) (en el que el grupo fenilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo fenílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7

40

miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), heteroaril-alquilo de (C₁₋₆) (en el que el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfinito, alquil C₁₋₆-tio, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, alquil C₁₋₆-carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno) o heteroarilo (el cual puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₄-carbonilo, alquil C₁₋₆-carbonilamino, feniloxicarbonilamino (en el que el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), amino, alquil C₁₋₆-amino o feniloamino (en el que el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino));

R² es hidrógeno, hidroxilo, alquilo de C₁₋₆ o haloalquilo de C₁₋₆;

R³ es hidrógeno, hidroxilo, halógeno, alquilo de C₁₋₆ o haloalquilo de C₁₋₆;

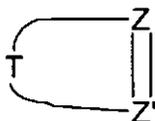
R^{3a} es H, o R³ y R^{3a} forman juntos un enlace;

15 cada R⁴ es independientemente halógeno, ciano, alquilo de C₁₋₈, haloalquilo de C₁₋₈, alcoxi de C₁₋₈, haloalcoxi de C₁₋₈, cianoalquilo, alcoxi de C₁₋₆-alquilo de (C₁₋₆), cicloalquil C₃₋₇-alquilo de (C₁₋₆), cicloalquenil C₅₋₆-alquilo de (C₁₋₆), alquenil C₃₋₆-oxi-alquilo de (C₁₋₆), alquinil C₃₋₆-oxi-alquilo de (C₁₋₆), ariloxi-alquilo de (C₁₋₆), carboxialquilo de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-carbonil-alquilo de (C₁₋₆), alquenil C₂₋₆-carbonil-alquilo de (C₁₋₆), alquinil C₂₋₆-carbonil-alquilo de (C₁₋₆), alcoxi C₁₋₆-carbonilo-alquilo de (C₁₋₆), alquenil C₃₋₆-oxicarbonil-alquilo de (C₁₋₆), alquinil C₃₋₆-oxicarbonil-alquilo de (C₁₋₆), ariloxicarbonil-alquilo de (C₁₋₆), alquil C₁₋₆-tio-alquilo de (C₁₋₆), alquil C₁₋₆-sulfinito-alquilo de (C₁₋₆), alquil C₁₋₆-sulfonilalquilo de (C₁₋₆), aminocarbonil-alquilo de (C₁₋₆), alquil C₁₋₆-aminocarbonil-alquilo de (C₁₋₆), dialquil (C₁₋₆)-aminocarbonil-alquilo de (C₁₋₆), fenil-alquilo de (C₁₋₄) (en el que el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroaril-alquilo de (C₁₋₄) (en el que el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆), heterociclicil-alquilo de (C₁₋₄) (en el que el grupo heterociclico está opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆), alquenilo de C₂₋₆, aminocarbonil-alquenilo de (C₂₋₆), alquil C₁₋₆-aminocarbonil-alquenilo de (C₂₋₆), dialquil (C₁₋₆)-aminocarbonil-alquenilo de (C₂₋₆), fenil-alquenilo de (C₂₋₄), (en el que el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), alquinilo de C₂₋₆, trimetilsilil-alquinilo de (C₂₋₆), aminocarbonil-alquinilo de (C₂₋₆), alquil C₁₋₆-aminocarbonil-alquinilo de (C₂₋₆), dialquil (C₁₋₆)-aminocarbonil-alquinilo de (C₂₋₆), alcoxi C₁₋₆-carbonilo, cicloalquilo de C₃₋₇, halocicloalquilo de C₃₋₇, cianocicloalquilo de C₃₋₇, alquil C₁₋₃-cicloalquilo de (C₃₋₇), alquil C₁₋₃-halocicloalquilo de (C₃₋₇), fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroarilo (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆), heterociclico (en el que el grupo heterociclico está opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆), o 2 grupos R⁴ adyacentes, junto con el átomo de carbono al que están unidos, forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 4, 5, 6 ó 7 miembros que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi de C₁₋₈, haloalcoxi de C₁₋₆, fenoxi (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆), heteroariloxi (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆), alquil C₁₋₈-tio o R¹⁹R²⁰N, en el que R¹⁹ y R²⁰ son, independientemente, hidrógeno, alquilo de C₁₋₈, cicloalquilo de C₃₋₇, alquenilo de C₃₋₆, alquinilo de C₃₋₆, haloalquilo de C₂₋₆, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, o R¹⁹ y R²⁰, junto con el átomo de N al que están unidos, forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados de O, N o S y que puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos grupos alquilo de C₁₋₆; n es 0, 1, 2 ó 3;

R⁸ es alquilo de C₁₋₁₀, haloalquilo de C₁₋₁₀, aril-alquilo de (C₁₋₆) (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroaril-alquilo de (C₁₋₆) (en el que el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), arilcarbonil-alquilo de (C₁₋₆) (en el que el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino, y el grupo alquilo puede estar opcionalmente sustituido con arilo), alquenilo de C₂₋₈, haloalquenilo de C₂₋₈, aril-alquenilo de (C₂₋₆) (en el que el grupo arilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, o dos sustituyentes adyacentes se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros), heteroaril-alquenilo de (C₂₋₆) (en el que el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, o dos sustituyentes adyacentes se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros), alquinilo de C₂₋₆, fenil-alquinilo de (C₂₋₆) (en el que el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), cicloalquilo de C₃₋₇, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, alquil C₁₋₆-carbonilo,

5 haloalquil C₁₋₆-carbonilo o aril-alquenal (C₂₋₆)-carbonilo (en el que el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), o -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_Z-R⁵⁵, en el que z es 1 ó 2, R⁵¹ y R⁵² son cada uno independientemente H, halo o alquilo de C₁₋₂, R⁵³ y R⁵⁴ son cada uno independientemente H, halógeno, alquilo de C₁₋₄ o haloalquilo de C₁₋₄, y R⁵⁵ es arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido, o sales o N-óxidos del mismo, con la condición de que el método no sea para el tratamiento del cuerpo humano o animal mediante terapia.

2. Un método según la reivindicación 1, en el que el anillo



es un anillo de benceno, piridina, pirimidina, pirazina, tiofeno o pirazol.

10 3. Un método según la reivindicación 1 o la reivindicación 2, en el que Y es un enlace sencillo o C=O.

4. Un método según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que R¹ es alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆,
 15 alcoxi de C₁₋₆-alquilo (C₁₋₆), heteroaril-alquilo (C₁₋₃) (en el que el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alcoxi de C₁₋₆-carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno),
 20 fenil-alquilo de (C₁₋₃) (en el que el grupo fenilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo fenílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), fenilo (el cual puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo fenílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), heteroarilo (el cual puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno),
 25 alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alqueno de C₂₋₆, heterociclilo (opcionalmente sustituido con halo, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆), alquil C₁₋₆-tio, haloalquil C₁₋₆-tio o NR¹³R¹⁴, en el que R¹³ y R¹⁴ son independientemente hidrógeno, alquilo de C₁₋₆ o haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆-alquilo (C₁₋₆), alquil C₂₋₆-carbonilo, fenilcarbonilo, (en el que el fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), fenil-alquilo de (C₁₋₃) (en el que el grupo fenilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alcoxi de C₁₋₆-carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo fenílico se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno) o heteroaril-alquilo de (C₁₋₃) (en el que el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-sulfonilo, alquil C₁₋₆-tio, alcoxi de C₁₋₆-carbonilo, alquil C₁₋₆-carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarílico ése pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno).
 30
 35
 40

5. Un método según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que R² es hidrógeno, alquilo de C₁₋₄ o haloalquilo de C₁₋₄.

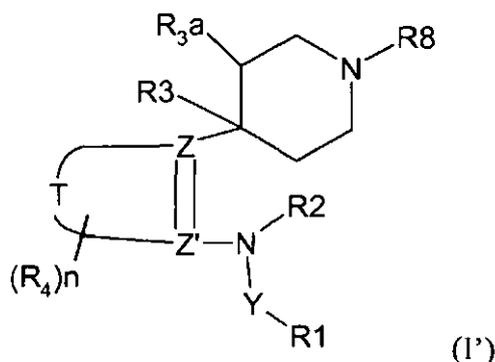
6. Un método según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que cada R⁴ es independientemente halógeno, ciano, alquilo de C₁₋₈, haloalquilo de C₁₋₈, cianoalquilo de C₁₋₈, alcoxi de C₁₋₆-alquilo de (C₁₋₆), alquino de C₂₋₆, trimetilsilil-alquino de (C₂₋₆), alcoxi de C₁₋₆-carbonilo, cicloalquilo de C₃₋₇, alquil C₁₋₃-cicloalquilo de (C₃₋₇), fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heterociclilo (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, alcoxi de C₁₋₆ o haloalcoxi de C₁₋₆), alcoxi de C₁₋₈, haloalcoxi de C₁₋₆, fenoxi (opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroariloxi (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo de C₁₋₃, haloalquilo de C₁₋₃, alcoxi de C₁₋₃ o haloalcoxi de C₁₋₃), di-alquil (C₁₋₈)amino, o 2 grupos R⁴ adyacentes, junto con los átomos de carbono a los que están unidos, forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 4, 5, 6 ó 7 miembros que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno; n es 0, 1, 2 ó 3.
 45
 50

7. Un método según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que R⁸ es fenil-alquilo de (C₁₋₄) (en el que el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi
 55

de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroaril-alquilo de (C₁₋₆) (en el que el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), fenil-alqueno de (C₂₋₆) (en el que el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroaril-alqueno de (C₂₋₆) (en el que el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino) o fenil-alqueno de (C₂₋₆) (en el que el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino, o -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]-z-R⁵⁵, en el que z es 1 ó 2, R⁵¹ y R⁵² son cada uno independientemente H, halo o alquilo de C₁₋₂, R⁵³ y R⁵⁴ son cada uno independientemente H, halógeno, alquilo de C₁₋₄ o haloalquilo de C₁₋₄, y R⁵⁵ es arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido.

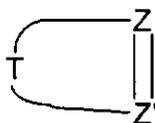
8. Un método según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que R³ es hidrógeno, hidroxilo, halógeno, alquilo de C₁₋₄ o haloalquilo de C₁₋₄.

9. Un compuesto de fórmula I'



15

en la que el anillo



20 y R¹, R², R³, R^{3a}, R⁴, Y y n son como se definen en relación con la fórmula I en la reivindicación 1, y R⁸ es -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]-z-R⁵⁵, en el que z es 1 ó 2, R⁵¹ y R⁵² son cada uno independientemente H o alquilo de C₁₋₂, R⁵³ y R⁵⁴ son cada uno independientemente H, halógeno, alquilo de C₁₋₄ o haloalquilo de C₁₋₄, y R⁵⁵ es fenilo sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino, o heteroarilo sustituido con halógeno, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino, o sales o N-óxidos del mismo.

25 10. Una composición insecticida y acaricida que comprende una cantidad insecticida o acaricida eficaz de un compuesto de fórmula I' como se define en la reivindicación 9.