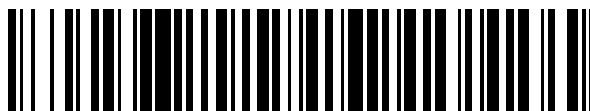


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 427 153**

51 Int. Cl.:

C07D 417/04	(2006.01) A01N 3/00	(2006.01)
C07D 417/14	(2006.01) C07D 401/06	(2006.01)
C07D 413/04	(2006.01) C07D 277/56	(2006.01)
C07D 413/14	(2006.01) C07D 417/12	(2006.01)
C07D 401/04	(2006.01) C07D 263/34	(2006.01)
C07D 401/14	(2006.01)	
C07D 403/04	(2006.01)	
C07D 403/14	(2006.01)	
C07D 403/06	(2006.01)	
A01N 43/72	(2006.01)	

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **26.07.2006** **E 06800387 (0)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **26.06.2013** **EP 1948649**

54 Título: **Carboxamidas fungicidas**

30 Prioridad:

26.07.2005 US 702579 P

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

29.10.2013

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

**BISAHA, JOHN JOSEPH;
KOVACS, PATRICK RYAN;
LETT, RENEE MARIE;
LONG, JEFFREY KEITH;
PASTERIS, ROBERT JAMES;
FINKELSTEIN, BRUCE LAWRENCE;
SMITH, BRENTON TODD y
KLYASHCHITSKY, BORIS ABRAMOVICH**

74 Agente/Representante:

DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto

ES 2 427 153 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

Carboxamidas fungicidas

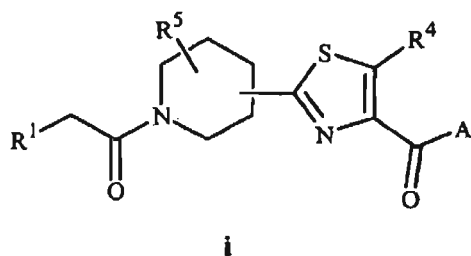
Campo de la invención

5 La presente invención se refiere a ciertas carboxamidas, sus N-óxidos, sales apropiadas para uso agrícola y composiciones, y procedimientos de su uso como fungicidas.

Antecedentes de la invención

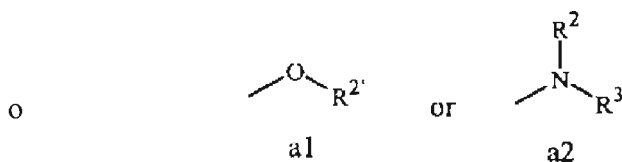
El control de enfermedades vegetales provocadas por patógenos vegetales micóticos es extremadamente importante en el logro de la alta eficiencia del cultivo. El daño de enfermedades vegetales a cultivos de plantas ornamentales, vegetales, de campo, cereales, y frutas puede provocar significativa reducción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

La Publicación de Patente Mundial WO 05/003128 divulga derivados de tiazolilpiperidina de Fórmula I como inhibidores de MTP (Proteína de Transferencia de Triglicéridos Microsomales).



15 en la que

A es un radical seleccionado de los radicales a1 y a2 más abajo

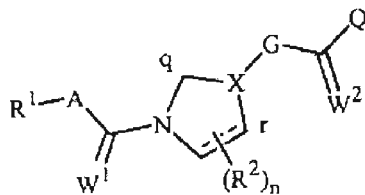


y R^1, R^2, R^2, R^3, R^4 y R^5 son tal como se define en la divulgación.

20 La Publicación de Patente Mundial WO 04/058751 divulga derivados de piperidinil-tiazol carboxamida para alterar el tono vascular. El documento WO 02/059086 divulga diversas carboxamidas para su uso como fungicidas.

Compendio de la invención

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



I

En la que

la línea punteada indica que el enlace puede ser un enlace simple o un enlace doble;

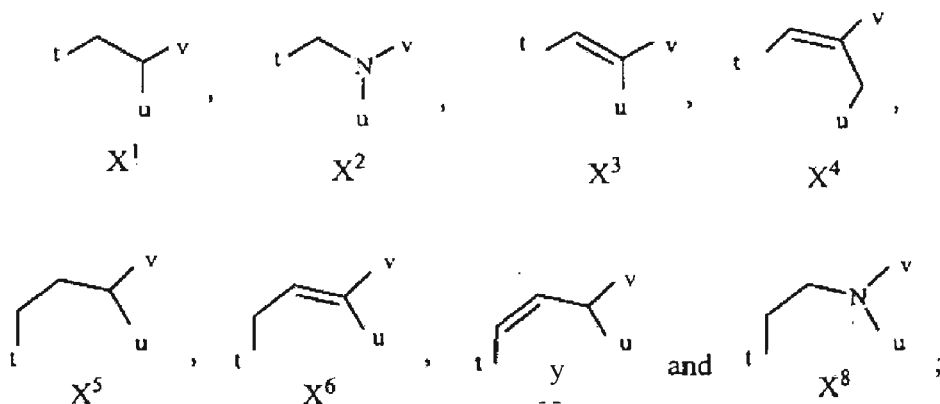
5 R^1 es un fenilo o anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, opcionalmente sustituido con 1 a 2 sustituyentes independientemente seleccionados de R^4 ;

10 cada R^4 es independientemente alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilalquilo C_4-C_{10} , alquilocicloalquilo C_4-C_{10} , alquilocicloalquilalquilo C_5-C_{10} , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , halógeno, hidroxilo, amino, ciano, nitro, alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_8 , cicloalquilamino C_3-C_6 , alcoxialquilo C_2-C_4 , hidroxialquilo C_1-C_4 , alquilcarbonilo C_2-C_4 , alcoxycarbonilo C_2-C_6 , alquilcarbonilo C_2-C_6 , alquilcarboniltio C_2-C_6 , alquilaminocarbonilo C_2-C_6 , dialquilaminocarbonilo C_3-C_8 o trialquilsililo C_3-C_6 ;

A es CH_2 o NH ;

W^1 es O o S;

15 X es un radical seleccionado de



en los que el enlace de X que está identificado con "t" está conectado al átomo de carbono identificado con "q" de Fórmula 1, el enlace que está identificado con "u" está conectado al átomo de carbono identificado con "r" de Fórmula 1, y el enlace que está identificado con "v" está conectado a G;

20 cada R^2 es independientemente alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , halógeno, ciano o hidroxilo; n es 0, 1 o 2; o

dos R^2 se toman juntos como alquilenilo C_1-C_3 o alquilenilo C_2-C_3 para formar un sistema anular bicíclico con puente; o

25 dos R^2 unidos a átomos de carbono anulares adyacentes unidos por un enlace doble se toman juntos como $-CH=CH-CH=CH-$ opcionalmente sustituido con 1-3 sustituyentes seleccionados de alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , halógeno, hidroxilo, amino, ciano y nitro;

G es un anillo heteroaromático de 5 miembros o anillo heterocíclico saturado o parcialmente saturado de 5 miembros,

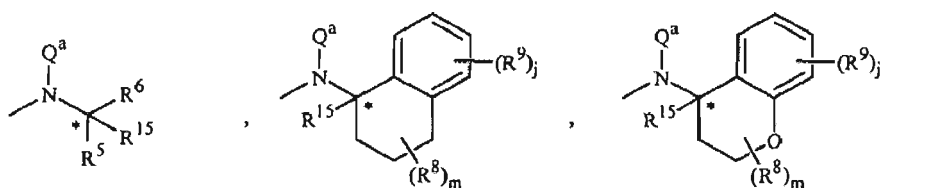
cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados de R^3 en los miembros anulares de carbono y seleccionados de R^{11} en los miembros anulares de nitrógeno;

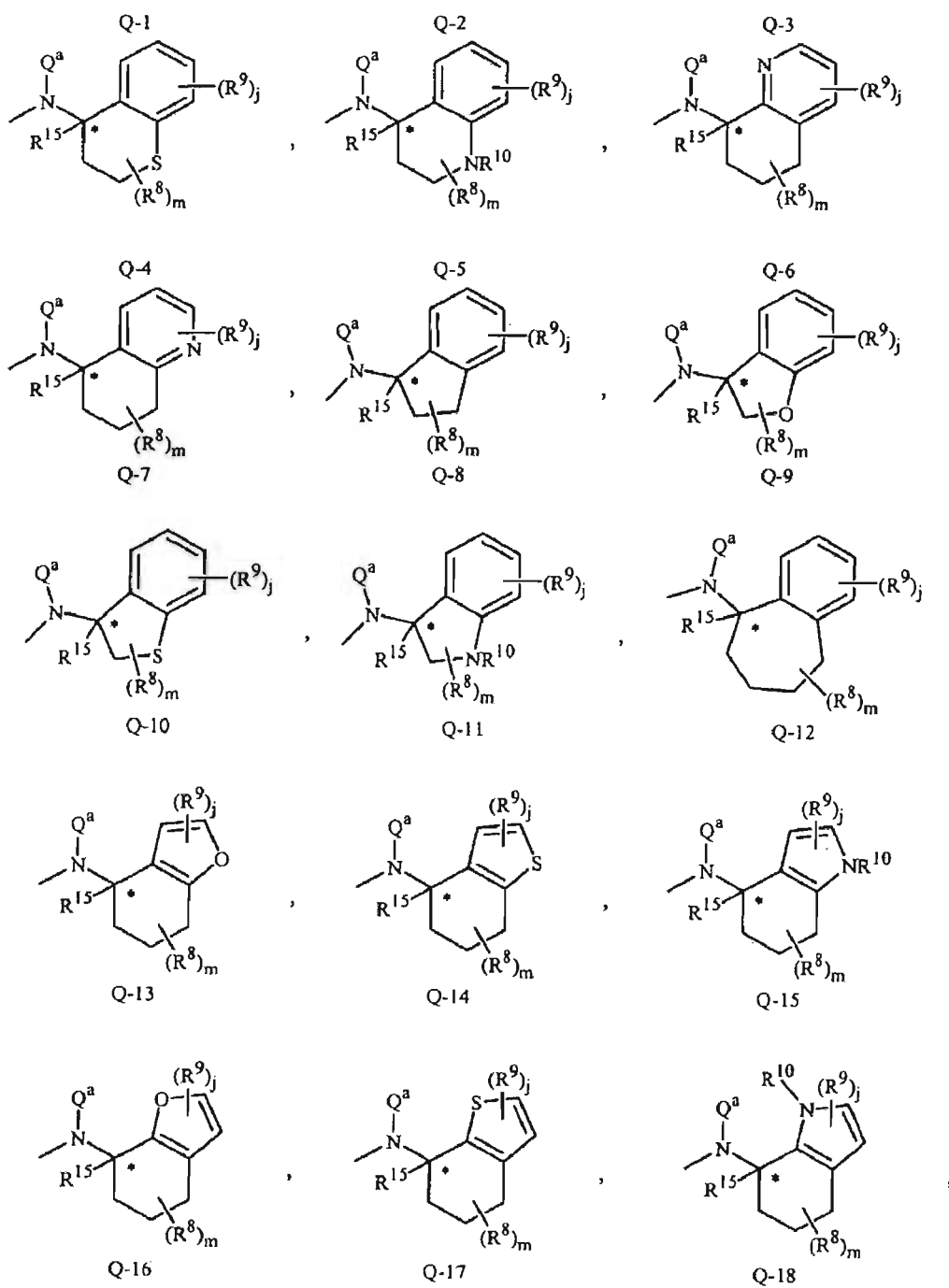
cada R^3 es independientemente alquilo C_1 - C_3 , haloalquilo C_1 - C_3 o halógeno;

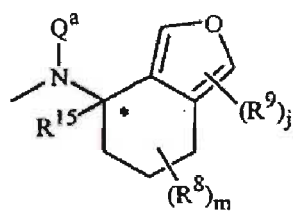
R^{11} es alquilo C_1 - C_3 ;

5 W^2 es O o S;

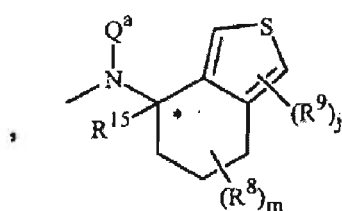
Q es un radical seleccionado de



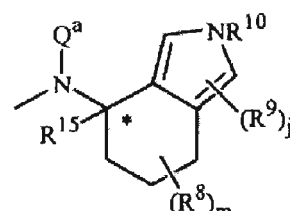




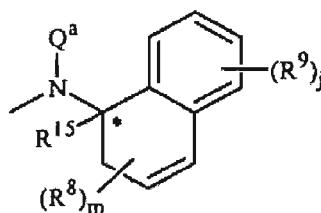
Q-19



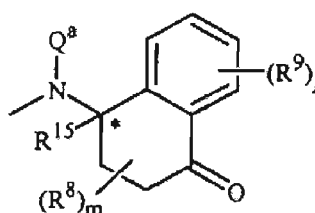
Q-20



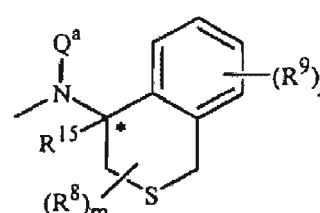
Q-21



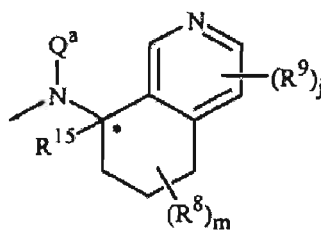
Q-22



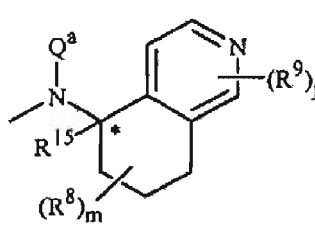
Q-23



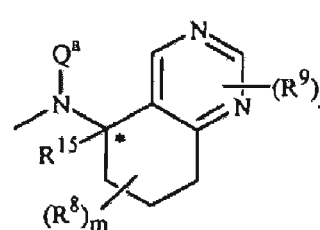
Q-24



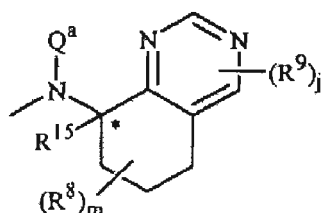
Q-25



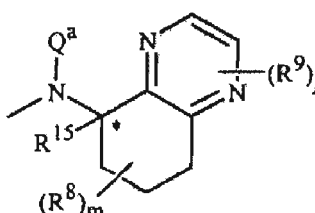
Q-26



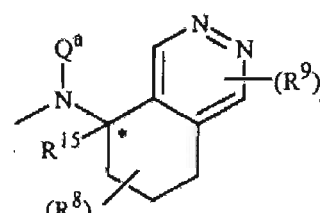
Q-27



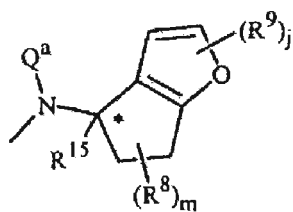
Q-28



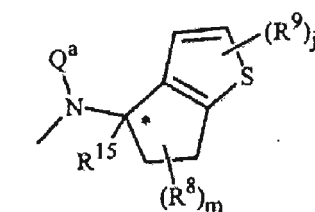
Q-29



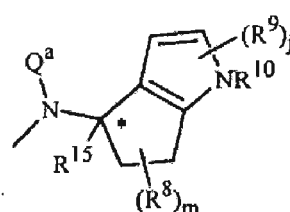
Q-30



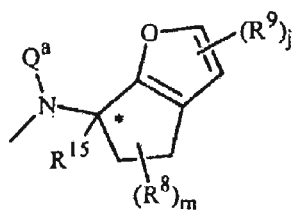
Q-31



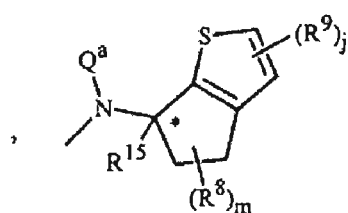
Q-32



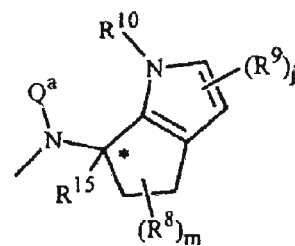
Q-33



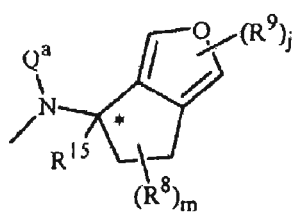
Q-34



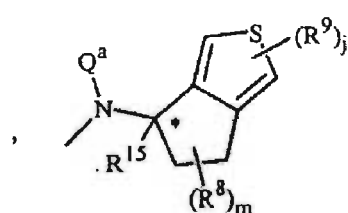
Q-35



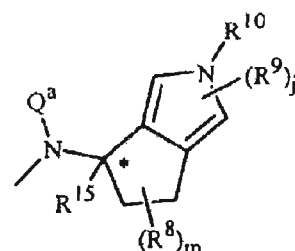
Q-36



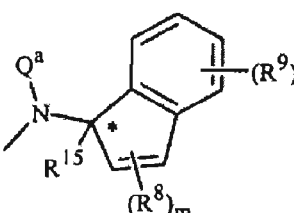
Q-37



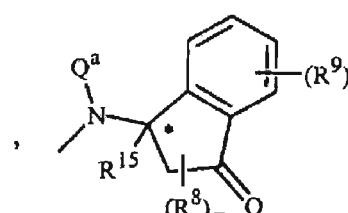
Q-38



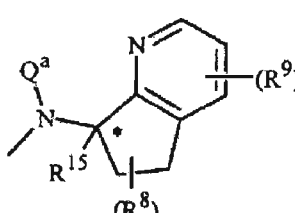
Q-39



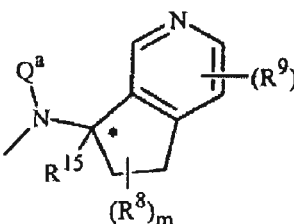
Q-40



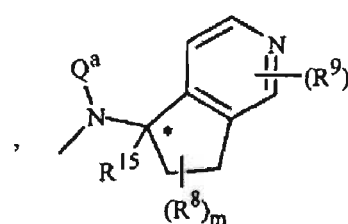
Q-41



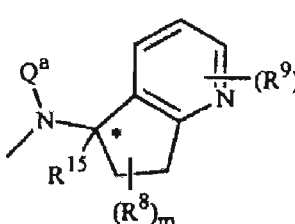
Q-42



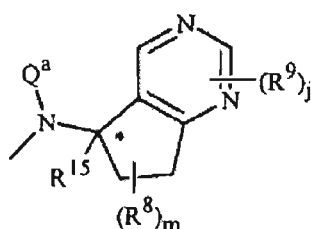
Q-43



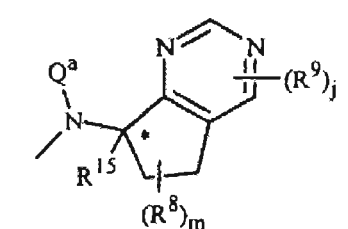
Q-44



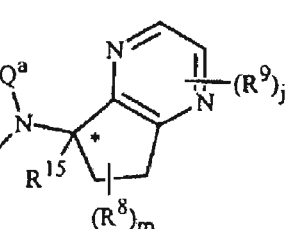
Q-45



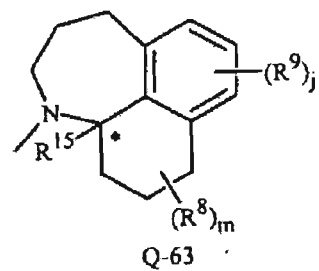
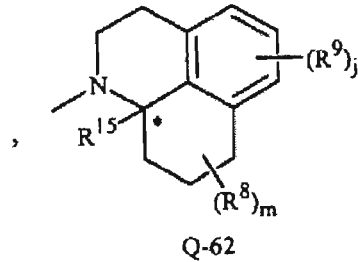
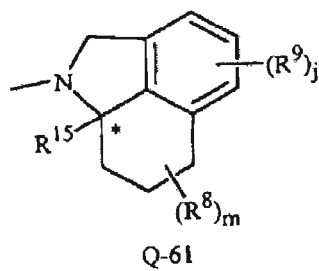
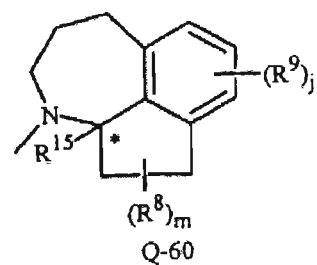
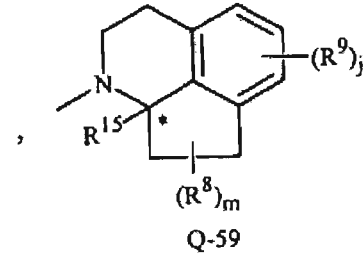
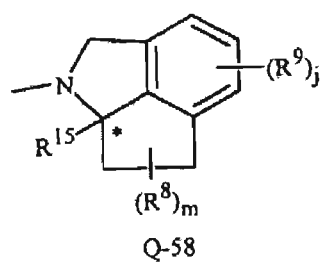
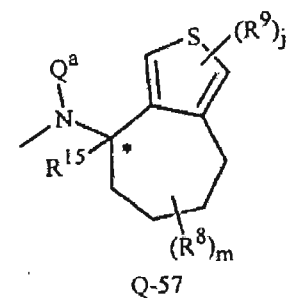
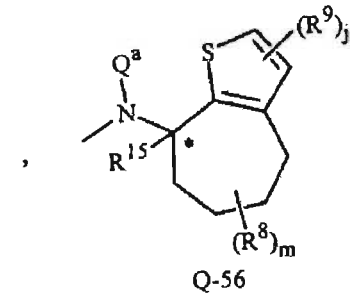
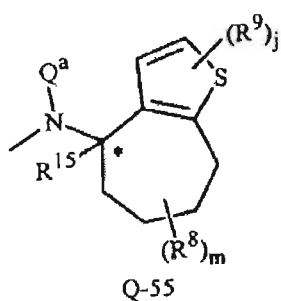
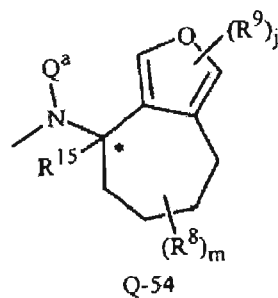
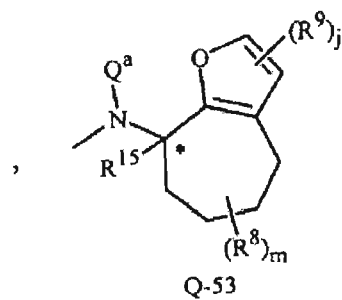
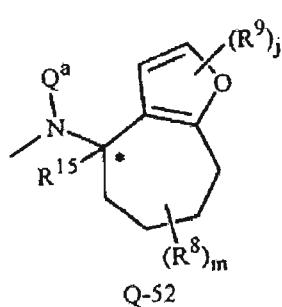
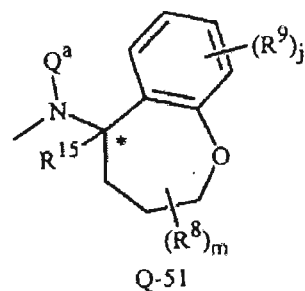
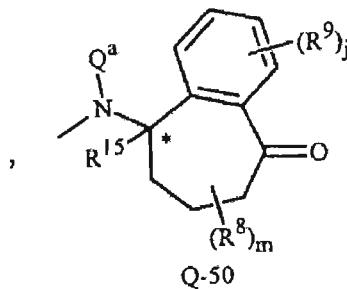
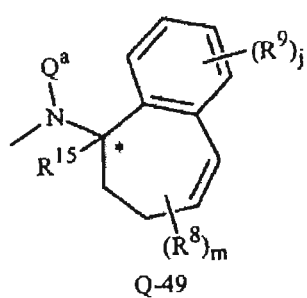
Q-46

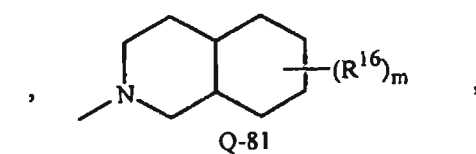
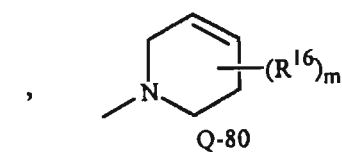
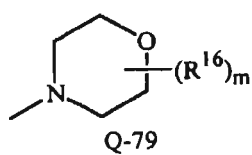
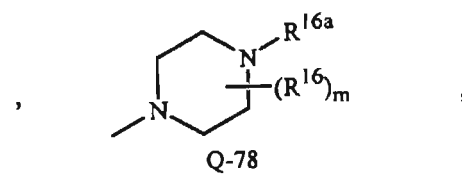
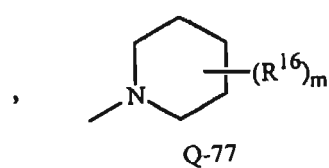
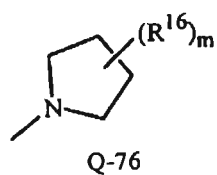
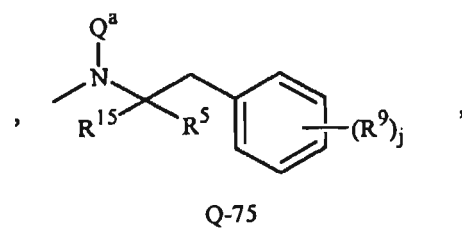
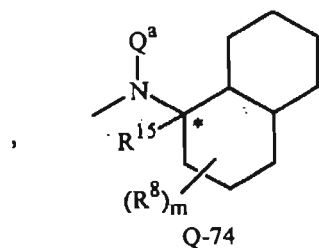
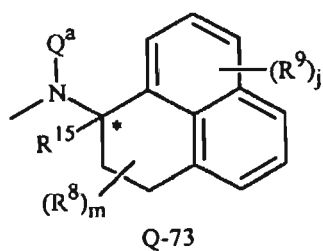
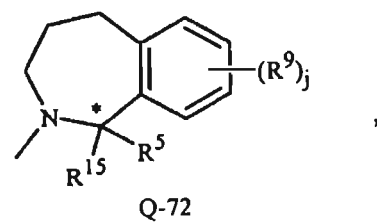
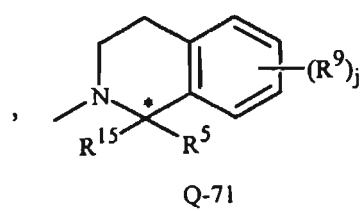
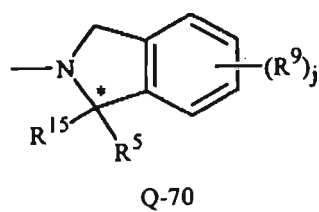
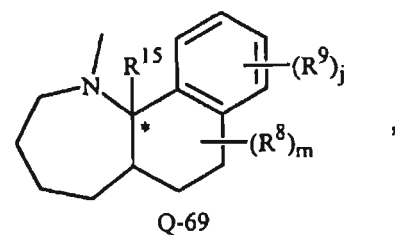
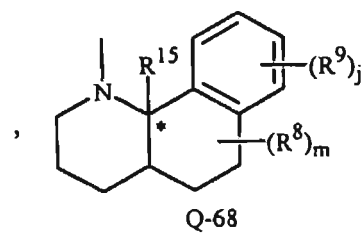
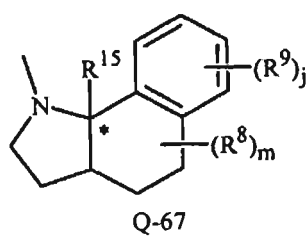
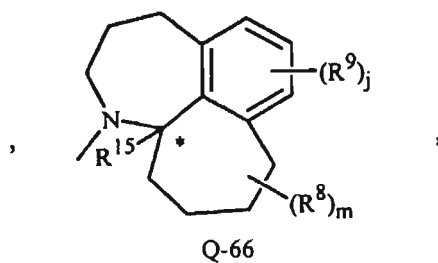
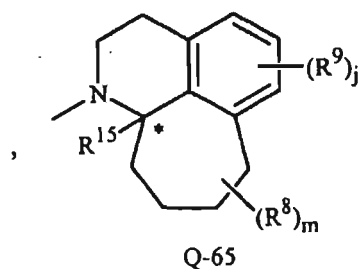
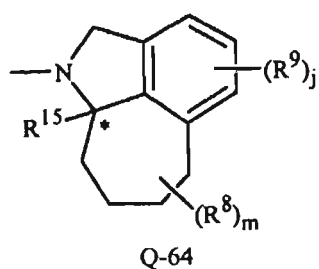


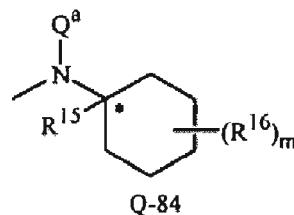
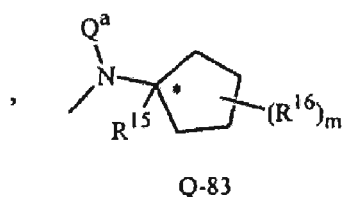
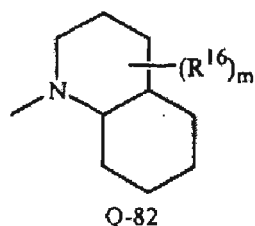
Q-47



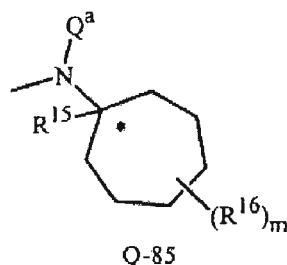
Q-48







y



en la que el átomo de carbono identificado con el asterisco (*) contiene un estereocentro; y para Q-2 a Q-76, cada R⁸ está independientemente unido a los átomos de carbono del anillo carbocíclico no aromático o anillo heterocíclico del grupo Q; y cada R⁹ está independientemente unido a los átomos de carbono del fenilo o anillo heteroaromático del grupo Q; cada R⁸ es independientemente H, alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₃-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalqueno C₂-C₄, haloalquino C₃-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, hidroxilo, amino, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfino C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfino C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₆, cicloalquilamino C₃-C₆, amino, alcoxialquilo C₂-C₄, hidroxialquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcocarbonilo C₂-C₄, alcocarbonilo C₂-C₄, alquilcarboniltio C₂-C₄, alquilaminocarbonilo C₂-C₄, alquilaminocarbonilo C₂-C₄, dialquilaminocarbonilo C₃-C₆ o trialquilsililo C₃-C₆; cada R⁹ es independientemente alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆, haloalquino C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, hidroxilo, amino, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfino C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfino C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquilo C₂-C₄, hidroxialquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcocarbonilo C₂-C₆, alquilcarbonilo C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₈ o trialquilsililo C₃-C₆;

R¹⁰ es H o alquilo C₁-C₃;

m es 0, 1 o 2;

j es 0, 1 o 2;

cada R¹⁶ es independientemente alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, Alquino C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, Cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, Alquilcicloalquilo C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquilo C₅-C₁₀, haloalquilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆, haloalquino C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, hidroxilo, amino, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfino C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfino C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquilo C₂-C₄, hidroxialquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcocarbonilo C₂-C₆, alquilcarbonilo C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₈ o trialquilsililo C₃-C₆; o un anillo fenilo o bencilo, opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados de R¹³, o dos R¹⁶ unidos a átomos de carbono anulares adyacentes se toman juntos como -(CH₂)₃- o -(CH₂)₄- opcionalmente sustituido con 1-3 sustituyentes seleccionados de alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, halógeno, hidroxilo, amino, ciano y nitro;

R^{16a} es H, alquilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆, alquino C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilcicloalquilo C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquilo C₅-C₁₀, haloalquilo C₁-C₆, haloalqueno C₃-C₆, Haloalquino C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilsulfino C₁-C₄, haloalquilsulfino C₁-C₄, amino, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquilo C₂-C₄, hidroxialquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcocarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₈; o un anillo fenilo o bencilo, opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados de R¹³;

cada R^{13} es independientemente alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilalquilo C_4-C_{10} , alquilocicloalquilo C_4-C_{10} , alquilocicloalquilalquilo C_5-C_{10} , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , halógeno, hidroxilo, amino, ciano, nitro, alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_8 , cicloalquilamino C_3-C_6 , alcoxialquilo C_2-C_4 , hidroxialquilo C_1-C_4 , alquilcarbonilo C_2-C_4 , alcoxycarbonilo C_2-C_6 , alquilcarbonilo C_2-C_6 , alquilcarboniltio C_2-C_6 , alquilaminocarbonilo C_2-C_6 , dialquilaminocarbonilo C_3-C_8 o trialquilsililo C_3-C_6 ;

R^6 es un fenilo, bencilo, naftalenilo, cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquenilo C_3-C_6 o anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada uno opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes seleccionados de R^7 en los miembros anulares de carbono y R^{12} en los miembros anulares de nitrógeno;

cada R^7 es independientemente alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilalquilo C_4-C_{10} , alquilocicloalquilo C_4-C_{10} , alquilocicloalquilalquilo C_5-C_{10} , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , halógeno, hidroxilo, amino, ciano, nitro, alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_8 , cicloalquilamino C_3-C_6 , alcoxialquilo C_2-C_4 , hidroxialquilo C_1-C_4 , alquilcarbonilo C_2-C_4 , alcoxycarbonilo C_2-C_6 , alquilcarbonilo C_2-C_6 , alquilcarboniltio C_2-C_6 , alquilaminocarbonilo C_2-C_6 , dialquilaminocarbonilo C_3-C_8 o trialquilsililo C_3-C_6 ;

R^{12} es H o alquilo C_1-C_3 ;

Q^a es H, alquilo C_1-C_3 , alquenilo C_2-C_3 , alquinilo C_2-C_3 , cicloalquilalquilo C_4-C_{10} , alquilocicloalquilo C_4-C_{10} , alquilocicloalquilalquilo C_5-C_{10} , haloalquilo C_1-C_3 , haloalquenilo C_2-C_3 , ciano, hidroxilo, alcoxi C_1-C_3 , alcoxialquilo C_2-C_3 , hidroxialquilo C_1-C_3 , alquilcarbonilo C_2-C_3 , alcoxycarbonilo C_2-C_3 , alquilaminocarbonilo C_2-C_3 o dialquilaminocarbonilo C_3-C_5 ;

R^5 es H, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilalquilo C_4-C_{10} , alquilocicloalquilo C_4-C_{10} , alquilocicloalquilalquilo C_5-C_{10} , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , ciano, nitro, alcoxialquilo C_2-C_4 , hidroxialquilo C_1-C_4 , alquilcarbonilo C_2-C_4 , alcoxycarbonilo C_2-C_6 , alquilaminocarbonilo C_2-C_6 , dialquilaminocarbonilo C_3-C_8 o trialquilsililo C_3-C_6 ; y

R^{15} es H, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , cicloalquilalquilo C_4-C_{10} , alquilocicloalquilo C_4-C_{10} , alquilocicloalquilalquilo C_5-C_{10} , haloalquilo C_1-C_4 , haloalquenilo C_2-C_4 , haloalquinilo C_2-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 o alcoxialquilo C_2-C_4 ;

siempre que:

(a) El compuesto de Fórmula 1 sea distinto que 2-[1-[(2-clorofenil)acetil]4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1-feniletíl]-4-tiazolcarboxamida;

(b) Cuando X es X^2 , X^3 , X^4 , X^6 o X^8 , después G no está unido a X a través de un heteroátomo del anillo G; y

(c) R^1 es distinto que 4-fluorofenilo.

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

La presente invención también se refiere a una composición funguicida que comprende una cantidad funguicidamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1 y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos o diluyentes líquidos.

La presente invención también se refiere a una composición funguicida que comprende una mezcla de un compuesto de Fórmula 1 y al menos otro funguicida, particularmente al menos otro funguicida que tiene un modo de acción diferente

La presente invención además se refiere a un procedimiento para controlar enfermedades vegetales provocadas por patógenos vegetales micóticos que comprende aplicar a la planta o porción de la misma, o a la semilla de la planta o plántula, una cantidad funguicidamente efectiva de un compuesto de la invención (es decir como una composición que se describe en la presente memoria).

La presente invención también proporciona una composición funguicida que comprende una cantidad funguicidamente efectiva de un compuesto que tiene una fórmula correspondiente a la Fórmula 1 excepto que R^1 es 4-fluorofenilo y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos o diluyentes líquidos.

La presente invención también se refiere a una composición funguicida que comprende una cantidad funguicidamente efectiva de un compuesto que tiene una fórmula correspondiente a la Fórmula 1 excepto que R¹ es 4-fluorofenilo y al menos otro fungicida.

- 5 La presente invención además se refiere a un procedimiento para controlar enfermedades vegetales provocadas por patógenos vegetales micóticos que comprende aplicar a la planta o porción de la misma, o a la semilla de la planta o plántula, una cantidad funguicidamente efectiva del compuesto que tiene una fórmula correspondiente a la Fórmula 1 excepto que R¹ es 4-fluorofenilo (es decir como una composición que se describe en la presente memoria).

- 10 La presente invención también proporciona una composición funguicida que comprende una cantidad funguicidamente efectiva del compuesto de 2-[1-[(2-clorofenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1-feniletil]-4-tiazolcarboxamida y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos o diluyentes líquidos.

La presente invención también se refiere a una composición funguicida que comprende una mezcla del compuesto de 2-[1-[(2-clorofenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1-feniletil]-4-tiazolcarboxamida y al menos otro fungicida.

- 15 La presente invención además se refiere a un procedimiento para controlar enfermedades vegetales provocadas por patógenos vegetales micóticos que comprende aplicar a la planta o porción de la misma, o a la semilla de la planta o plántula, una cantidad funguicidamente efectiva del compuesto de 2-[1-[(2-clorofenil)acetil]-N-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1-feniletil]-4-tiazolcarboxamida (es decir como una composición que se describe en la presente memoria).

Detalles de la invención

- 20 Tal como se utiliza en la presente memoria, los términos "comprende" "que comprende", "incluye,"que incluye", "tiene", "que tiene" o cualquier otra variación de los mismos, tiene por objeto contemplar una inclusión no exclusiva. Por ejemplo, un a composición, proceso, procedimiento, artículo o aparato que comprende una lista de elementos no se limita necesariamente a solamente aquellos elementos sino también puede incluir otros elementos no detallados expresamente o inherentes a dicha composición, proceso, procedimiento, artículo o aparato. Además, a menos que se establezca expresamente lo contrario, "o" se refiere a una o inclusiva y no exclusiva. Por ejemplo, una condición A o B
- 25 está satisfecha por uno de los siguientes: A es verdadero (o está presente) y B es también (o no está presente), A es también (o no está presente) y B es verdadero (o está presente), y ambos A y B son verdaderos (o están presentes).

- También, el uso de "un" o "una" se emplea ara describir elementos y componentes de la invención. Esto se realiza simplemente por conveniencia y para dar un sentido general de la invención. Esta descripción debe ser leída para incluir uno o al menos uno y la forma singular también incluye la forma plural a menos que sea evidente que se quiere decir lo contrario.
- 30

- En las recitaciones anteriores, el término "alquilo", utilizado sólo o en palabras compuestas tal como "alquilitio" o "haloalquilo" incluye alquilo de cadena lineal o ramificada, tal como, metilo, etilo, n- propilo, i-propilo, o los diferentes isómeros butilo, pentilo o hexilo. El término "1-2 alquilo" indica que una o dos de las posiciones disponibles que ese
- 35 sustituyente puede ser alquilo que se selecciona independientemente. "Alquenilo" incluye alquenos de cadena lineal o ramificada tal como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, y los diferentes isómeros butenilo, pentenilo y hexenilo. "Alquenilo" también incluye polienos tal como 1,2- propadienilo y 2,4-hexadienilo. "Alquinilo" incluye alquinos de cadena lineal o ramificada tal como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo y los diferentes isómeros butinilo, pentinilo y hexinilo. "Alquinilo" también puede incluir restos comprendidos por múltiples enlaces triples tal como 2,5- hexadiinilo. "Alquilenilo" indica un alcanediilo de cadena lineal o ramificada. Los ejemplos de "alquileno" incluyen CH₂, CH₂CH₂, CH(CH₃), CH₂CH₂CH₂, CH₂CH(CH₃) y los diferentes isómeros butileno. "Alquenileno" indica un alquenediilo de cadena lineal o ramificada que contiene un enlace olefinico. Los ejemplos de "alquenileno" incluyen CH=CH. CH₂CH=CH, CH=C(CH₃) y los diferentes isómeros butenileno. "Alquinileno" indica un alquinediilo de cadena lineal o ramificada que contiene un enlace triple. Los ejemplos de "alquinileno" incluyen C≡C, CH₂C≡C, C=CCH₂ y los diferentes isómeros butinileno. "Alcoxi" incluye, por ejemplo, metoxi, etoxi, n- propiloxi, isopropiloxi y los diferentes isómeros butoxi, pentoxi y hexiloxi. "Alcoxialquilo" indica la sustitución de alcoxi en el alquilo. Los ejemplos de "alcoxialquilo" incluyen CH₃OCH₂, CH₃OCH₂CH₂-CH₃CH₂OCH₂, CH₃CH₂CH₂CH₂OCH₂ y CH₃CH₂OCH₂CH₂. "Alcoxialcoxi" indica la sustitución de alcoxi en el alcoxi. "Alqueniloxi" incluye restos alqueniloxi de cadena lineal o ramificada. Los ejemplos de "alqueniloxi" incluyen H₂C=CHCH₂O, (CH₃)₂C=CHCH₂O, (CH₃)CH=CHCH₂O, (CH₃)CH=C(CH₃)CH₂O y CH₂=CHCH₂CH₂O. "Alquiniloxi" incluyen restos alquiniloxi de cadena lineal o ramificada. Los ejemplos de "alquiniloxi" incluyen HC≡CCH₂O, CH₃C≡CH₂O y CH₃C≡CCH₂CH₂O. "Alquilitio" incluye restos alquilitio de cadena lineal o ramificada tal como metiltio, etiltio, y los diferentes isómeros propiltio, butiltio, pentiltio y hexiltio. "Alquilsulfínilo" incluye ambos enantiómeros de un grupo alquil-sulfínilo. Los ejemplos de "alquilsulfínilo" incluyen CH₃S(O), CH₃CH₂S(O), CH₃CH₂CH₂S(O), (CH₃)₂CHS(O) y los diferentes isómeros butilsulfínilo, pentilsulfínilo y hexilsulfínilo. Los ejemplos de "alquilsulfonilo" incluyen CH₃S(O)₂,
- 40
- 45
- 50

CH₃CH₂S(O)₂, CH₃CH₂CH₂S(O)₂, (CH₃)₂CHS(O)₂ y los diferentes isómeros butilsulfonilo, pentilsulfonilo y hexilsulfonilo. "Alquilamino", "dialquilamino", "alquenilto", "alquenilsulfonilo", "alquenilsulfonilo", "alquinilto", "alquinilsulfonilo", "alquinilsulfonilo", y similar, se definen en forma análoga a los ejemplos anteriores. "Cicloalquilo" incluye, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, y ciclohexilo. El término "anillo carbocíclico" indica un anillo en el que los átomos forman la estructura principal anular y se seleccionan solamente de carbono. El término "sistema anular aromático" indica carbociclos y heterociclos completamente insaturados en los que el sistema anular policíclico es aromático. Aromático indica que cada uno de los átomos anulares está esencialmente en el mismo plano y tiene una órbita p perpendicular al plano anular, y en el que los electrones (4n + 2) π, cuando n es 0 o un número entero positivo, están asociados con el anillo para cumplir con la regla de Huckel. El término "sistema anular carbocíclico aromático" incluye carbociclos completamente aromáticos y carbociclos en los que al menos un anillo de un sistema anular policíclico es aromático. Los términos "sistema heterocíclico anular aromático" y "anillo heteroaromático" incluyen heterociclos y heterociclos completamente aromáticos en los que al menos un anillo de un anillo policíclico es aromático. El término "sistema heterocíclico anular saturado" indica heterociclos completamente saturados en los que ninguno de los anillos en el sistema anular son aromáticos. El término "sistema heterocíclico anular parcialmente saturado" indica heterociclos parcialmente insaturados en los que parte de los anillos en el sistema anular pueden ser aromáticos. Los sistemas anulares heterocíclicos pueden unirse a cualquier carbono o nitrógeno mediante el reemplazo de un hidrógeno en dicho carbono o nitrógeno. Un experto en la técnica apreciará que no todo heterociclo que contiene nitrógeno puede formar N-óxidos ya que el nitrógeno requiere un par de electrones solos disponibles para la oxidación a óxido. Un experto en la técnica reconocerá aquellos heterociclos que contienen nitrógeno que pueden formar N-óxidos. Un experto en la técnica también reconocerá que las aminas terciarias pueden formar N-óxidos. Los procedimientos sintéticos para la preparación de N-óxidos de heterociclos y aminas terciarias son bien conocidos por un experto en la técnica incluyendo la oxidación de heterociclos y aminas terciarias con ácidos peroxi tal como ácido peracético y m-cloroperbenzoico (MCPBA), hidrógeno peróxido, alquil hidropéroxidos tal como t-butil hidropéroxido, perborato de sodio, y dioxiranos tal como dimetildioxirano. Estos procedimientos para la preparación de N-óxidos se han descrito y revisado en forma extensa en la literatura, véase por ejemplo: T. L. Gilchrist in *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, páginas 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler y B. Stanovnik in *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, páginas 18-20, A. J. Boulton y A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett y B. R. T. Keene in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, páginas 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler y B. Stanovnik in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, páginas 285-291, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, Eds., Academic Press; y G. W. H. Cheeseman y E. S. G. Werstiuk in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, páginas 390-392, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

El término "halógeno", sólo en palabras compuestas tal como "haloalquilo", incluye flúor, cloro, bromo o yodo. El término "1-2 halógeno" indica que una o dos de las posiciones disponibles para ese sustituyente pueden ser halógeno que se seleccionan independientemente. Además, cuando se utiliza en las palabras compuestas tal como "haloalquilo", dicho alquilo puede estar parcialmente o completamente sustituido con átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. Los Ejemplos de "haloalquilo" incluyen F₃C, ClCH₂, CF₃CH₂ y CF₃CCl₂. Los términos "haloalqueno", "haloalquino", "halocicloalquilo", "haloalcoxi", "haloalquilito", y similares, se definen en forma análoga al término "haloalquilo". Los ejemplos de "haloalqueno" incluyen (Cl)₂C=CH₂ (Cl) y CF₃CH₂CH=CHCH₂. Los ejemplos de "haloalquino" incluyen HC≡CCHCl, CF₃C≡C, CCl₃C≡C y FCH₂C≡CH₂. Los ejemplos de "haloalcoxi" incluyen CF₃O, CCl₃CH₂O, HCF₂CH₂CH₂O y CF₃CH₂O. Los ejemplos de "haloalquilito" incluyen CCl₃S, CF₃S, CCl₃CH₂S y ClCH₂CH₂CH₂S. Los ejemplos de "haloalquilsulfonilo" incluyen CF₃S(O)₂, CCl₃S(O)₂, CF₃CH₂S(O)₂ y CF₃CF₂S(O)₂. Los ejemplos de "sistema anular bicíclico parcialmente saturado" incluyen tetrahidronaftaleno, tetrahidroquinolina, tetrahidroisoquinolina. "Trialkilsililo" incluye 3 radicales alquilo de cadena ramificada y/o lineal unidos a y enlazados a un átomo de silicio tal como trimetilsililo, trietilsililo y t-butil-dimetilsililo. El número total de átomos de carbono en un grupo sustituyente está indicado por el prefijo "C_i-C_j" donde i y j son números de 1 a 10. Por ejemplo, alquilsulfonilo C₁-C₄ designa metilsulfonilo a butilsulfonilo; alcoialquilo C₂ designa CH₃OCH₂; alcoialquilo C₃ designa, por ejemplo, CH₃CH(OCH₃), CH₃OCH₂CH₂ o CH₃CH₂OCH₂; y alcoialquilo C₄ designa los diversos isómeros de un grupo alquilo sustituido con un grupo alcoxi que contiene un total de cuatro átomos de carbonos, los ejemplos incluyen CH₃CH₂CH₂OCH₂ y CH₃CH₂OCH₂CH₂, alquilaminoalquilo C₂ designa CH₃NHCH₂; alquilaminoalquilo C₃ designa, por ejemplo, CH₃(NH)CH-, CH₃NHCH₂CH₂- o CH₃CH₂NHCH₂-; y los ejemplos de "alquilcarbonilo" incluyen C(O)CH₃, C(O)CH₂CH₂CH₃- y C(O)CH(CH₃)₂. Los ejemplos de "alkroxycarbonilo" incluyen CH₃OC(=O), CH₃CH₂OC(=O), CH₃CH₂CH₂OC(=O), (CH₃)₂CHOC(=O) y los diferentes isómeros butoxi o pentoxycarbonilo. Los ejemplos de "alquilaminocarbonilo" incluyen CH₃NHC(=O)-, CH₃CH₂NHC(=O)-, CH₃CH₂CH₂NHC(=O)-, (CH₃)₂CHNHC(=O)- y los diferentes isómeros butilamino o pentilaminocarbonilo. Los ejemplos de "dialquilaminocarbonilo" incluyen (CH₃)₂NC(=O)-, (CH₃CH₂)₂NC(=O)-, CH₃CH₂(CH₃)NC(=O)-, (CH₃)₂CHN(CH₃)C(=O)- y CH₃CH₂CH₂(CH₃)NC(=O)-. En las citas anteriores, cuando un compuesto de Fórmula 1 está compuesto por uno o más anillos heterocíclicos, todos los sustituyentes están unidos a estos anillos a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible por el reemplazo de un hidrógeno en dicho carbono o nitrógeno.

La línea punteada en la Formula 1 representa que el enlace indicado puede ser un enlace simple o enlace doble.

Cuando X es un radical seleccionado de X^1 , X^2 , X^3 , X^4 , X^5 , X^6 , X^7 y X^8 , el enlace del lado izquierdo de X que está identificado con "t" está conectado al átomo de carbono al lado del nitrógeno identificado con "q" de Fórmula 1, y el enlace inferior derecho de X que está identificado con "u" está conectado al átomo de carbono identificado con "r" de Fórmula 1 y el enlace del lado superior derecho de X que está identificado con "v" está conectado al anillo G de Fórmula 1.

Cuando un compuesto está sustituido con un sustituyente que lleva un subíndice que indica el número de dichos sustituyentes puede variar, cuando el número de dichos sustituyentes es mayor que 1, dichos sustituyentes son independientemente seleccionados del grupo de sustituyentes definidos. Además, cuando el subíndice indica un intervalo, por ejemplo $(R)_{i-j}$, después el número de sustituyentes puede seleccionarse de los números enteros entre i y j inclusive. También, un experto en la técnica reconoce que el número de puntos de unión disponibles limita el número de sustituyentes posibles que pueden ser inferiores que la definición amplia; por ejemplo, el subíndice "k" en U-16, U-17, U-18, U-19, U-32, U-33 y U-35 que se muestra en la Realización 14 no puede ser mayor que 1.

Cuando un grupo contiene un sustituyente que puede ser hidrógeno, por ejemplo Q^a , R^5 o R^{15} , después, cuando este sustituyente es tomado como hidrógeno, se reconoce que éste es equivalente a dicho grupo que no está sustituido. Cuando se muestra que un grupo variable está opcionalmente unido a una posición, por ejemplo $(R^2)_n$ en la que n puede ser 0, después hidrógeno puede estar en la posición aún si no está nombrado en la definición del grupo variable. Cuando se dice que una posición en un grupo es "no sustituida" o "insustituida", después los átomos de hidrógeno están unidos para tomar cualquier valencia libre. El término "opcionalmente sustituido" en conexión con los grupos detallados para R^1 , R^2 , R^5 , R^6 , R^{15} , R^{16} , R^{16a} , G, Q^a y Q^b se refiere a grupos que no están sustituidos o tienen al menos 1 sustituyente distinto de hidrógeno. Estos grupos pueden estar sustituidos con tantos sustituyentes opcionales como pueden ser acomodados reemplazando un átomo de hidrógeno con un sustituyente distinto de hidrógeno en cualquier átomo de nitrógeno o carbono disponible. Comúnmente, el número de sustituyentes opcionales (cuando están presentes) varía de 1 a 3.

Tal como se indica más arriba, R^1 es un fenilo opcionalmente sustituido o anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros; G es un anillo heteroaromático de 5 miembros opcionalmente sustituido o anillo heterocíclico saturado o parcialmente saturado de 5 miembros; Q^a y Q^b se toman juntos con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo heterocíclico saturado o parcialmente saturado de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido; y R^6 es un fenilo opcionalmente sustituido, bencilo, naftalenilo, cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquenilo C_3-C_6 o anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros; y Q-2 a Q-85 están opcionalmente sustituido. El término "sustituido" en conexión con estos grupos R^1 , G, R^6 , Q^a y Q^b se refiere a grupos que al menos tienen un sustituyente distinto de hidrógeno que no extingue la actividad fungicida. Debido a que estos grupos están opcionalmente sustituidos, no necesitan tener ningún sustituyente distinto de hidrógeno.

El nombramiento de sustituyentes en la presente divulgación utiliza terminología reconocida que proporciona concisión en la transmisión con precisión de la estructura química a aquellos con experiencia en la técnica. Por ejemplo, tal como se utiliza en la nomenclatura, el prefijo "per" indica "completamente", y "perhidro" significa que el anillo heteroaromático o sistema anular referenciado (por ejemplo, quinolina, isoquinolina) ha sido completamente hidrogenado, por lo que está completamente saturado. También, la finalización de un nombre de sustituyente heterocíclico con la letra "o" (por ejemplo, "piperidino", "pirrolidino", "isoquinolino", "isoindolo") significa que el sustituyente heterocíclico está unido al resto de la molécula a través del átomo de nitrógeno del heterociclo. A los fines de concisión, pueden omitirse los descriptores localizadores; "pirazol-1-ilo" significa "1H-pirazol-1-ilo" de acuerdo al sistema químico abstracto de nomenclatura. El término "piridilo" es sinónimo de "piridinilo". El orden de los sustituyentes de la lista puede ser diferente del sistema químico abstracto si la diferencia no o afecta el significado.

B. Son notables los compuestos de Fórmula I más arriba en los que R^1 es uno de U-1 a U-50 tal como se describe con relación a la Realización 14 que se describe más adelante; G es uno de G-1 a G-55 tal como se describe con relación a la Realización 36 que se describe más adelante; cada R^{3a} es independientemente H, alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 o halógeno (más particularmente H, alquilo C_1-C_3 o halógeno, y mucho más particularmente H o alquilo C_1-C_3); R^{11a} es H o alquilo C_1-C_3 ; R^6 es uno de H-1 a H-46 tal como se describe con relación a la Realización 65 que se describe más adelante; y R^{12} es H o alquilo C_1-C_3 . Entre estos compuestos son particularmente notables los compuestos en los que cada R^4 es independientemente alquilo C_1-C_3 , alquenilo C_2-C_3 , alquinilo C_2-C_3 , ciclopropilo, haloalquilo C_1-C_3 , haloalquenilo C_2-C_3 , haloalquinilo C_2-C_3 , halociclopropilo, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C_1-C_2 o haloalcoxi C_1-C_2 ; R^5 es alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , haloalquenilo C_2-C_4 , haloalquinilo C_2-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , ciano o alcocicloalquilo C_2-C_4 ; y cada R^7 es independientemente alquilo C_1-C_3 , alquenilo C_2-C_3 , alquinilo C_2-C_3 , ciclopropilo, haloalquilo C_1-C_3 , haloalquenilo C_2-C_3 , haloalquinilo C_2-C_3 , halociclopropilo, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C_1-C_2 o haloalcoxi C_1-C_2 ; cada R^8 es independientemente H, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_3-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_4 , haloalquenilo C_2-C_4 , haloalquinilo C_2-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_6 , halógeno, hidroxilo, amino, ciano, nitro, alcoxi C_1-C_4 o alcocicloalquilo C_2-C_4 ; cada R^9 es independientemente alquilo C_1-C_3 , ciclopropilo, haloalquilo C_1-C_3 , halociclopropilo, halógeno, hidroxilo, alquilcarbonilo C_2-C_3 , alcoxi C_1-C_2 o haloalcoxi C_1-C_2 ; R^{10} es H o metilo; cada R^{16} es independientemente alquilo C_1-C_3 , alquenilo C_2-C_3 , alquinilo C_2-C_3 , ciclopropilo, haloalquilo C_1-C_3 ,

haloalquenilo C₂-C₃, haloalquinilo C₂-C₃, halociclopropilo, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₂ o haloalcoxi C₁-C₂; o un anillo fenilo o bencilo, opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados de R¹³; R^{16a} es H, alquilo C₁-C₃, alilo, propargilo, ciclopropilo o haloalquilo C₁-C₃; o un anillo fenilo o bencilo, opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados de R¹³; y cada R¹³ es independientemente alquilo C₁-C₃, alquenilo C₂-C₃, alquinilo C₂-C₃, ciclopropilo, haloalquilo C₁-C₃, haloalquenilo C₂-C₃, haloalquinilo C₂-C₃, halociclopropilo, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₂ o haloalcoxi C₁-C₂.

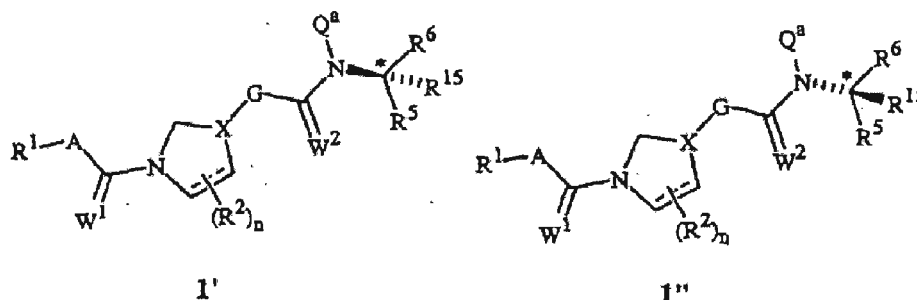
C. Los ejemplos de los compuestos del Párrafo B más arriba incluyen los compuestos en los que X es uno de X¹, X² y X³; y cada R² es independientemente alquilo C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, halógeno, ciano o hidroxilo; Q^a es H o CH₃; y R¹⁵ es H o CH₃.

D. Los ejemplos de los compuestos del Párrafo C más arriba incluyen los compuestos en los que R¹ es uno de U-1 a U-3, U-11, U-13, U-20, U-22, U-23, U-36, U-37 a U-39 y U-50; y cada R⁴ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₂ o haloalcoxi C₁-C₂. También están incluidos los compuestos en los que G es G-1, G-2, G-3, G-7, G-8, G-10, G-11, G-14, G-15, G-23, G-24, G-26, G-27, G-28, G-30, G-36, G-37, G-38 o G-49 a G-55; R^{3a} es H, CH₃, Cl o Br, y R¹¹ es H o CH₃. Son notables los compuestos en los que G es G-1, G-2, G-7, G-8, G-14, G-15, G-23, G-24, G-26, G-27, G-36, G-37, G-38, G-49 o G-50 (incluyendo por ejemplo, donde G no está sustituido).

E. Otros ejemplos de los compuestos del Párrafo C incluyen compuestos en los que Q es Q-1, Q-2, Q-3, Q-4, Q-8, Q-9, Q-10, Q-12, Q-14, Q-22, Q-23, Q-24, Q-40, Q-41, Q-59, Q-62, Q-74 o Q-84; R⁵ es alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₄ ciano o alcoxialquilo C₂-C₄; R⁶ es H-1, H-20, H-32, H-45 o H-46; cada R⁷ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₂ o haloalcoxi C₁-C₂; cada R⁸ es independientemente alquilo C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, haloalcoxi C₁-C₂, alcoxycarbonilo C₂-C₄ o hidroxilo; y cada R⁹ es independientemente halógeno, hidroxilo, OCH₃ o CH₃. Están incluidos los compuestos en los que Q es Q-1, Q-2, Q-8, Q-14, Q-23, Q-41, Q-59 o Q-62; Q^a es metilo; R⁵ es alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄ o ciano; R⁶ es H-1 o H-45; R¹² es H o CH₃; cada R⁷ es independientemente F, Cl, Br, OCH₃ o metilo; R¹⁵ es H; R⁸ es CH₃, OCH₃ o OH; y R¹⁰ es H o CH₃.

F. Los ejemplos adicionales de los compuestos del Párrafo C incluyen compuestos en los que W¹ y W² son independientemente O; Q⁸ es CH₃; m, j, n y p son todos independientemente 0 o 1; R^{3a} es H; cada R⁷ es independientemente F, Cl, Br, OCH₃ o metilo; cada R⁸ es independientemente alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂ o hidroxilo; y cada R⁹ es independientemente F, Cl, Br, hidroxilo, OCH₃ o CH₃. Están incluidos los compuestos en los que R¹ es U-1 o U-50; cada R⁴ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃ o alcoxi C₁-C₂; G es G-1, G-2, G-15, G-26, G-27, G-36, G-37 o G-38; Q es Q-1, Q-2, Q-8, Q-23 o Q-41; R⁵ es alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄ o ciano; R⁶ es H-45; y cada R⁴ está independientemente conectado a la posición 3 o 5 de U-1, cada R⁴ está independientemente conectado a la posición 3 y 5 de U-1, cada R⁴ está independientemente conectado a la posición 2 o 3 de U-50, o cada R⁴ está independientemente conectado a la posición 2 y 5 de U-50 (por ejemplo, compuestos donde X es X¹ y G es G-1; X es X¹ y G es G-2; X es X¹ y G es G-15; X es X¹ y G es G-26; X es X¹ y G es G-36; X es X² y G es G-1; o X es X² y G es G-2). En lo anterior, "cada R⁴ está independientemente conectado a la posición 3 o 5 de U-1" significa k es 1 y R⁴ está conectado a la posición 3 o 5 de U-1, "cada R⁴ está independientemente conectado a la posición 3 y 5 de U-1" significa k es 2 y un R⁴ independientemente seleccionado está conectado a cada una de las posiciones 3 y 5 de U-1. "cada R⁴ está independientemente conectado a la posición 2 o 3 de U-50" significa k es 1 y R⁴ está conectado a la posición 3 o 5 de U-50, y "cada R⁴ está independientemente conectado a la posición 2 y 5 de U-50" significa k es 2 y un R⁴ independientemente seleccionado está conectado a cada una de las posiciones 2 y 5 de U-50.

Los compuestos de la presente invención pueden existir como uno o más estereoisómeros. Los diversos estereoisómeros incluyen enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros y isómeros geométricos. Un experto en la técnica apreciará que un estereoisómero puede ser más activo y/o puede exhibir efectos beneficiosos cuando es enriquecido respecto de otros estereoisómero/s o cuando es separado de los otros estereoisómero. Adicionalmente, el experto en la técnica conoce cómo separar, enriquecer y/o preparar selectivamente dichos estereoisómeros. Por consiguiente, la presente invención comprende compuestos seleccionados de la Fórmula 1, N-óxidos y sales apropiadas para uso agrícola de los mismos. Los compuestos de la invención pueden estar presentes como una mezcla de estereoisómeros, estereoisómeros individuales, o como una forma ópticamente activa. Por ejemplo, cuando Q es Q-1, y R⁵, R⁶ y R¹⁵ de Q-1 en la Fórmula 1 son diferentes, después la Fórmula 1 posee un centro quiral en el átomo de carbono al que están comúnmente unidos. La presente invención comprende mezclas racémicas. Además, la presente invención incluye compuestos que están enriquecidos en comparación con la mezcla racémica en un enantiómero de Fórmula 1.



Están incluidos los enantiómeros esencialmente puros de los compuestos de Fórmula 1, por ejemplo, Formula 1' y Formula 1'' en las que Q es Q-1.

- 5 Cuando está enantioméricamente enriquecido, un enantiómero está presente en mayores cantidades que el otro, y el grado de enriquecimiento puede definirse mediante una expresión de exceso enantiomérico ("ee"), que se define como $(2x - 1) \cdot 100 \%$, donde x es la fracción en moles del enantiómero dominante en la mezcla (por ejemplo, un ee de 20 % corresponde a una relación 60:40 de enantiómeros).

- 10 Para los compuestos de Fórmula 1 donde Q es Q-1 a Q-74, se cree que el enantiómero funguicidamente más activo es aquel en el que R¹⁵ es un hidrógeno, el átomo de hidrógeno unido al átomo de carbono identificado con un asterisco (*) está debajo del plano definido por 3 átomos distintos de hidrógeno unidos al átomo de carbono identificado con el asterisco (*) como en la Formula 1' (con el anillo aromático de Q-2 a Q-74 posicionado con respecto al átomo de carbono identificado con un asterisco (*) en una forma análoga a R⁶ en Q-1 en la Fórmula 1'). Por ejemplo cuando R⁵ es CH₃, R⁶ es fenilo y R¹⁵ es H, la Fórmula 1' tiene la configuración R en el átomo de carbono al que R⁵, R⁶ y R¹⁵ están unidos comúnmente.

- 15 Preferiblemente las composiciones de la presente invención tienen al menos un exceso enantiomérico del 50 %; más preferiblemente al menos un exceso enantiomérico del 75 %; aún más preferiblemente al menos un exceso enantiomérico del 90 %; y mucho más preferiblemente al menos un exceso enantiomérico del 94 % del isómero más activo. Son particularmente notables las realizaciones enantioméricamente puras del isómero más activo.

- 20 Los compuestos de Fórmula 1 pueden comprender centros quirales adicionales. Por ejemplo, los mismos sustituyentes R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹, R¹³, R¹⁵, R¹⁶, R^{16a}, Q^a, Q^b y X¹ a X⁸ pueden contener centros quirales. La presente invención comprende mezclas racémicas así como estereoconfiguraciones enriquecidas y esencialmente puras en estos centros quirales adicionales.

- 25 Los compuestos de la presente invención pueden existir como uno o más isómeros conformacionales debido a las uniones de amida en los compuestos de Fórmula 1 tal como es conocido por un experto en la técnica. La presente invención comprende mezclas de isómeros conformacionales. Además, la presente invención incluye compuestos que están enriquecidos en comparación con la mezcla de un conformador de Fórmula 1.

- 30 Las sales apropiadas para uso agrícola de los compuestos de la invención incluyen sales de adición ácida con ácidos inorgánicos u orgánicos tal como ácidos hidrobromico, hidroclicorico, nítrico, fosfórico, sulfúrico, acético, butírico, fumárico, láctico, maleico, malónico, oxálico, propiónico, salicílico, tartárico, 4-toluenosulfónico o valérico. Las sales apropiadas para uso agrícola de los compuestos de la invención también incluyen aquellas formadas con bases orgánicas (por ejemplo, piridina, amoníaco, o trietilamina) o bases inorgánicas (por ejemplo, hidruros, hidróxidos, o carbonatos de sodio, potasio, litio, calcio, magnesio o bario) cuando el compuesto contiene un grupo ácido tal como un ácido carboxílico o fenol. Un experto en la técnica reconoce que debido a que en el ambiente y en condiciones fisiológicas las sales de los compuestos de la invención están en equilibrio con sus correspondientes formas distintas de sales, las sales apropiadas para uso agrícola comparten la utilidad biológica de las formas distintas de sales.

Las realizaciones de la presente invención incluyen:

Realización 1. Un compuesto de Fórmula 1 en el que A es CH₂.

Realización 2. Un compuesto de Fórmula 1 en el que A es NH.

Realización 3. Un compuesto de Fórmula 1 en el que W¹ es O.

- 40 Realización 4. Un compuesto de Fórmula 1 en el que W¹ es S.

Realización 5. Un compuesto de Fórmula 1 en el que W^2 es O.

Realización 6. Un compuesto de Fórmula 1 en el que W^2 es S.

Realización 7. Un compuesto de Fórmula 1 en el que R^2 es metilo.

Realización 8. Un compuesto de Fórmula 1 en el que n es 0 o 1.

5 Realización 9. Un compuesto de la Realización 8 en el que n es 0.

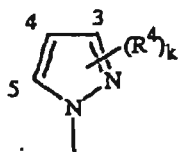
Realización 10. Un compuesto de Fórmula 1 en el que X es X^1 , X^2 o X^3 .

Realización 11. Un compuesto de la Realización 10 en el que X es X^1 o X^2 y cada anillo está saturado.

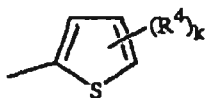
Realización 12. Un compuesto de la Realización 10 en el que X es X^1

Realización 13. Un compuesto de la Realización 12 en el que X es X^1 y el anillo está saturado.

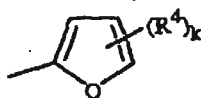
10 Realización 14. Un compuesto de Fórmula 1 en el que R^1 es uno de U-1 a U-50;



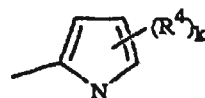
U-1



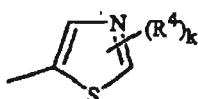
U-2



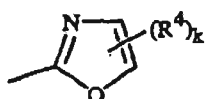
U-3



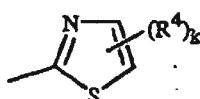
U-4



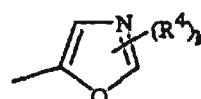
U-5



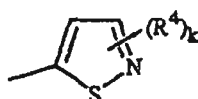
U-6



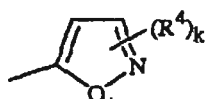
U-7



U-8



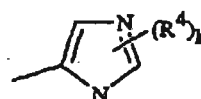
U-9



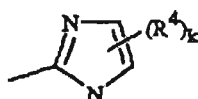
U-10



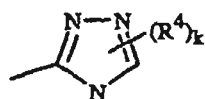
U-11



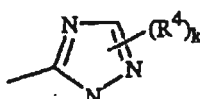
U-12



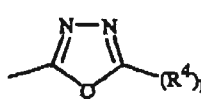
U-13



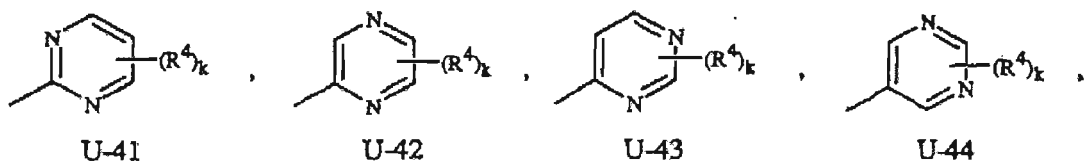
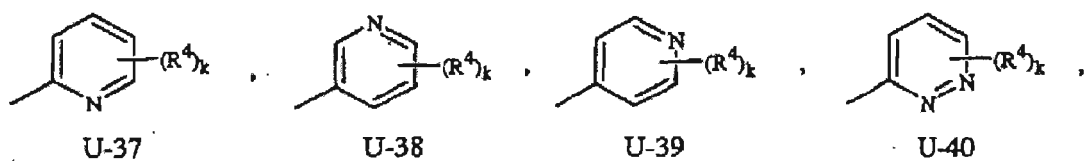
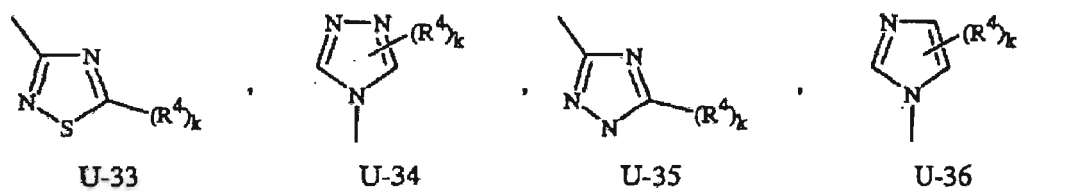
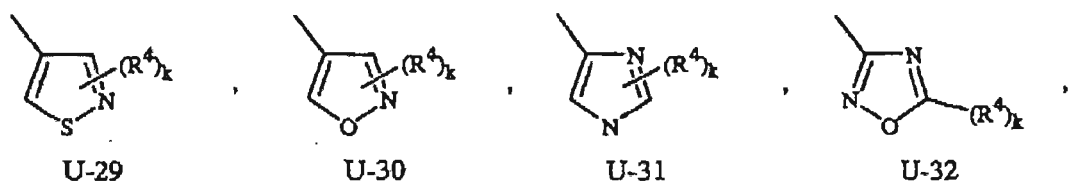
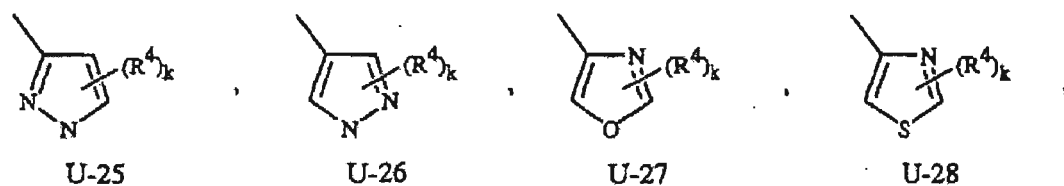
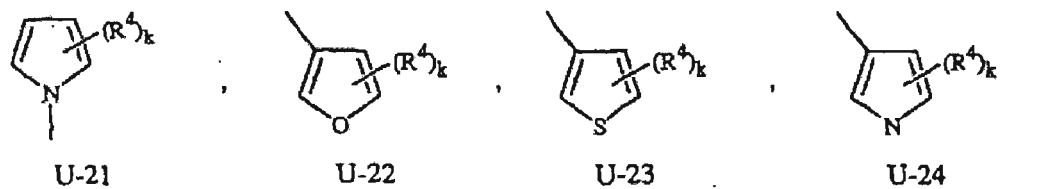
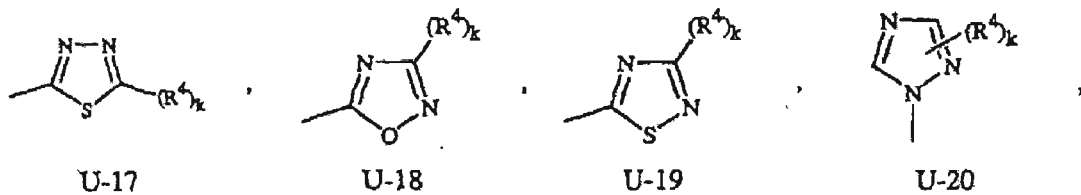
U-14

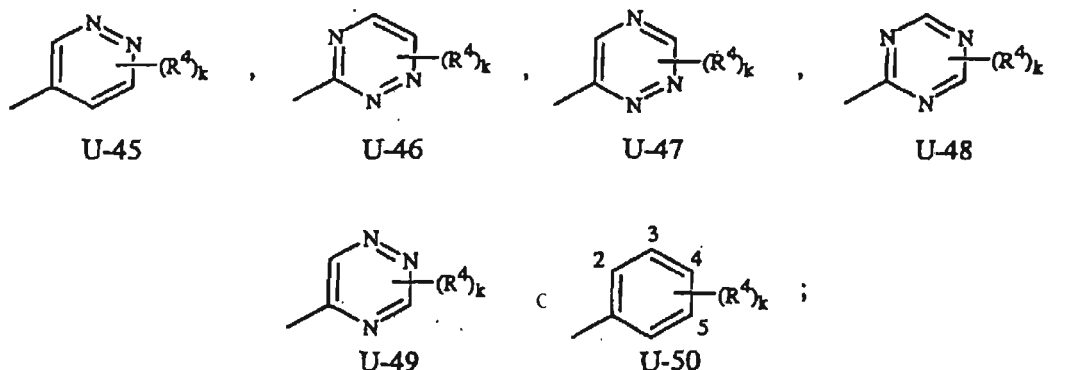


U-15



U-16





en la que k es 0, 1 o 2;

siempre que cuando U es U- 4, U-11 a U-15; U-24 a U-26, U-31 y U-35, y un radical R^4 está unido a un átomo de nitrógeno del anillo, dicho radical R^4 es alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 o alcoxialquilo C_2-C_4 .

Realización 15. Un compuesto de la Realización 14 en el que R^1 es seleccionado de U- 1 a U-5, U-8, U-11, U-13, U-15, U-20 a U-28, U-31, U-36, U-37, U-38, U-39 y U-50.

Realización 16. Un compuesto de la Realización 15 en el que R^1 es seleccionado de U-1 a U-3, U-5, U-8, U-13, U-20, U-22, U-23, U-25 a U-28, U-36 a U-39 y U-50.

Realización 17. Un compuesto de la Realización 16 en el que R^1 es seleccionado de U-1 a U-3, U-13, U-20, U-22, U-23, U-36 a U-39 y U-50.

Realización 18. Un compuesto de la Realización 17 en el que R^1 es U-1 o U-50.

Realización 19. Un compuesto de la Realización 18 en el que R^1 es U-1.

Realización 20. Un compuesto de la Realización 18 en el que R^1 es U-50.

Realización 21. Un compuesto de Fórmula 1 en el que R^1 es un fenilo o anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, opcionalmente sustituido con 1 a 2 sustituyentes independientemente seleccionados de R^4 y cada R^4 es independientemente alquilo C_1-C_3 , alquenilo C_2-C_3 , alquinilo C_2-C_3 , ciclopropilo, haloalquilo C_1-C_3 , haloalquenilo C_2-C_3 , haloalquinilo C_2-C_3 , halociclopropilo, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C_1-C_2 , haloalcoxi C_1-C_2 , alquiltio C_1-C_2 , haloalquiltio C_1-C_2 , alcoxialquilo C_1-C_2 , alquilcarbonilo C_2-C_3 , alcoxycarbonilo C_2-C_3 , alquilaminocarbonilo C_2-C_3 o dialquilaminocarbonilo C_3-C_4 .

Realización 22. Un compuesto de la Realización 21 en el que cada R^4 es independientemente alquilo C_1-C_3 , alquenilo C_2-C_3 , alquinilo C_2-C_3 , ciclopropilo, haloalquilo C_1-C_3 , haloalquenilo C_2-C_3 , haloalquinilo C_2-C_3 , halociclopropilo, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C_1-C_2 o haloalcoxi C_1-C_2 .

Realización 23. Un compuesto de la Realización 22 en el que cada R^4 es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_2 o haloalcoxi C_1-C_2 .

Realización 24. Un compuesto de la Realización 23 en el que cada R^4 es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_2 , haloalquilo C_1-C_2 o alcoxi C_1-C_2 .

Realización 25. Un compuesto de la Realización 24 en el que cada R^4 es independientemente Cl, Br, I, metilo, etilo, trifluorometilo o metoxi.

Realización 26. Un compuesto de la Realización 25 en el que al menos un R^4 es Cl.

Realización 27. Un compuesto de la Realización 25 en el que al menos un R^4 es Br.

Realización 28. Un compuesto de la Realización 25 en el que al menos un R^4 es metilo.

Realización 29. Un compuesto de la Realización 25 en el que al menos un R^4 es etilo.

Realización 30. Un compuesto de la Realización 25 en el que al menos un R^4 es trifluorometilo.

Realización 31. Un compuesto de la Realización 25 en el que al menos un R^4 es metoxi.

Realización 32. Un compuesto de la Realización 19 en el que cada R^4 está independientemente conectado a la posición 3 o 5 de U-1 (es decir k es 1, y R^4 está conectado a la posición 3 o 5 de U-1).

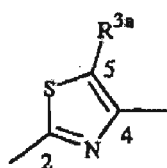
- 5 Realización 32a. Un compuesto de la Realización 19a en el que cada R^4 está independientemente conectado a la posición 3 o 5 de U-1 (es decir k es 1, y R^4 está conectado a la posición 3 o 5 de U-1); y cada R^4 es independientemente alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , halógeno, hidroxilo, amino, ciano, nitro, alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfinilo C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfinilo C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_8 , cicloalquilamino C_3-C_6 , alcoxialquilo C_2-C_4 , hidroxialquilo C_1-C_4 , alquilcarbonilo C_2-C_4 , alcoxycarbonilo C_2-C_6 , alquilcarboniloxi C_2-C_6 , alquilcarboniltio C_2-C_6 , alquilaminocarbonilo C_2-C_6 , dialquilaminocarbonilo C_3-C_8 o trialquilsililo C_3-C_6 .
- 10

- Realización 33. Un compuesto de la Realización 19 en el que cada R^4 está independientemente conectado a la posición 3 y 5 de U-1 (es decir k es 2, y un R^4 independientemente seleccionado está conectado a las posiciones 3 y 5 de U-1). Son notables los compuestos de la Realización 33 que corresponden a los compuestos notables para la Realización 19 más arriba donde cada R^4 es independientemente alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , halógeno, hidroxilo, amino, ciano, nitro, alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfinilo C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfinilo C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_8 , cicloalquilamino C_3-C_6 , alcoxialquilo C_2-C_4 , hidroxialquilo C_1-C_4 , alquilcarbonilo C_2-C_4 , alcoxycarbonilo C_2-C_6 , alquilcarboniloxi C_2-C_6 , alquilcarboniltio C_2-C_6 , alquilaminocarbonilo C_2-C_6 , dialquilaminocarbonilo C_3-C_8 o trialquilsililo C_3-C_6 .
- 15
- 20

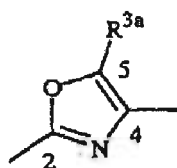
Realización 34. Un compuesto de la Realización 20 en el que cada R^4 está independientemente conectado a la posición 2 o 3 de U-50 (es decir k es 1, y R^4 está conectado a la posición 2 o 3 de U-50).

- Realización 35. Un compuesto de la Realización 20 en el que cada R^4 está independientemente conectado a la posición 2 y 5 de U-50 (es decir k es 2, y un R^4 independientemente seleccionado está conectado a cada una de las posiciones 2 y 5 de U-50).
- 25

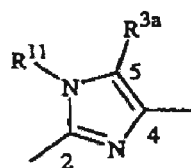
Realización 36. Un compuesto de Fórmula 1 en el que G es uno de G-1 a G-55;



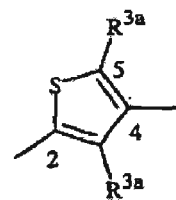
G-1



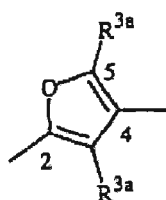
G-2



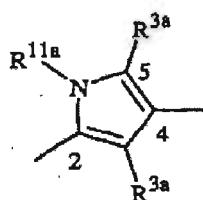
G-3



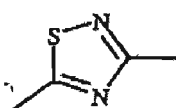
G-4



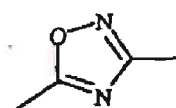
G-5



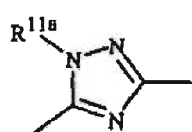
G-6



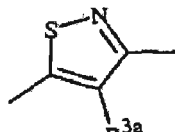
G-7



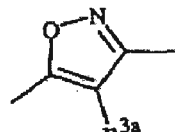
G-8



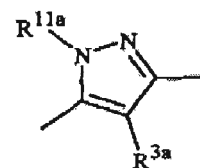
G-9



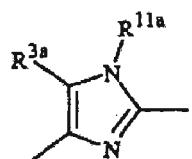
G-10



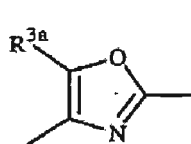
G-11



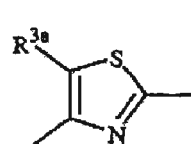
G-12



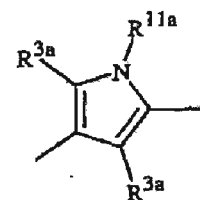
G-13



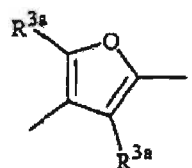
G-14



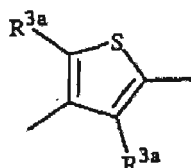
G-15



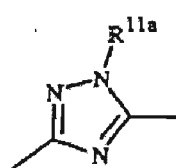
G-16



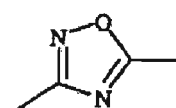
G-17



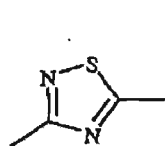
G-18



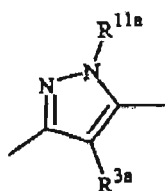
G-19



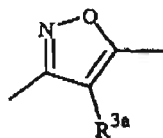
G-20



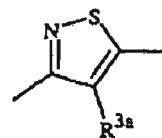
G-21



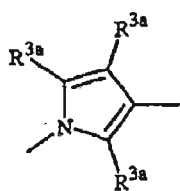
G-22



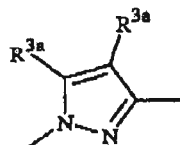
G-23



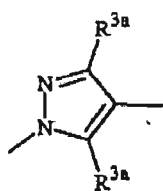
G-24



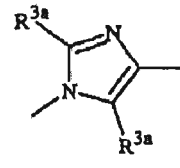
G-25



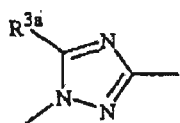
G-26



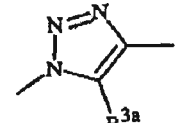
G-27



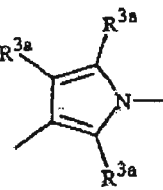
G-28



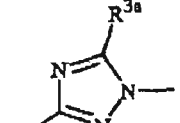
G-29



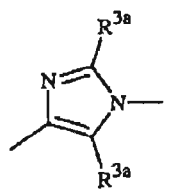
G-30



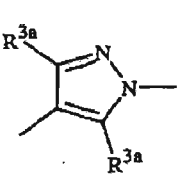
G-31



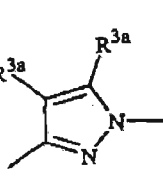
G-32



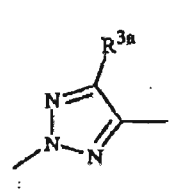
G-33



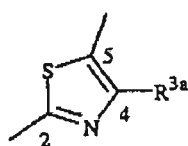
G-34



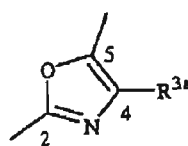
G-35



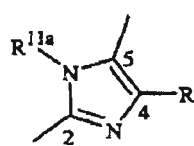
G-36



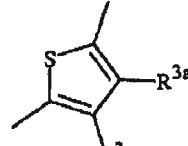
G-37



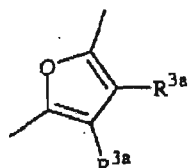
G-38



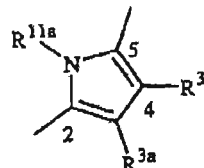
G-39



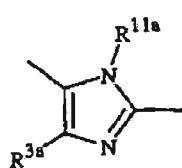
G-40



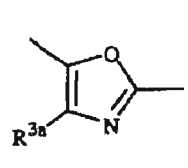
G-41



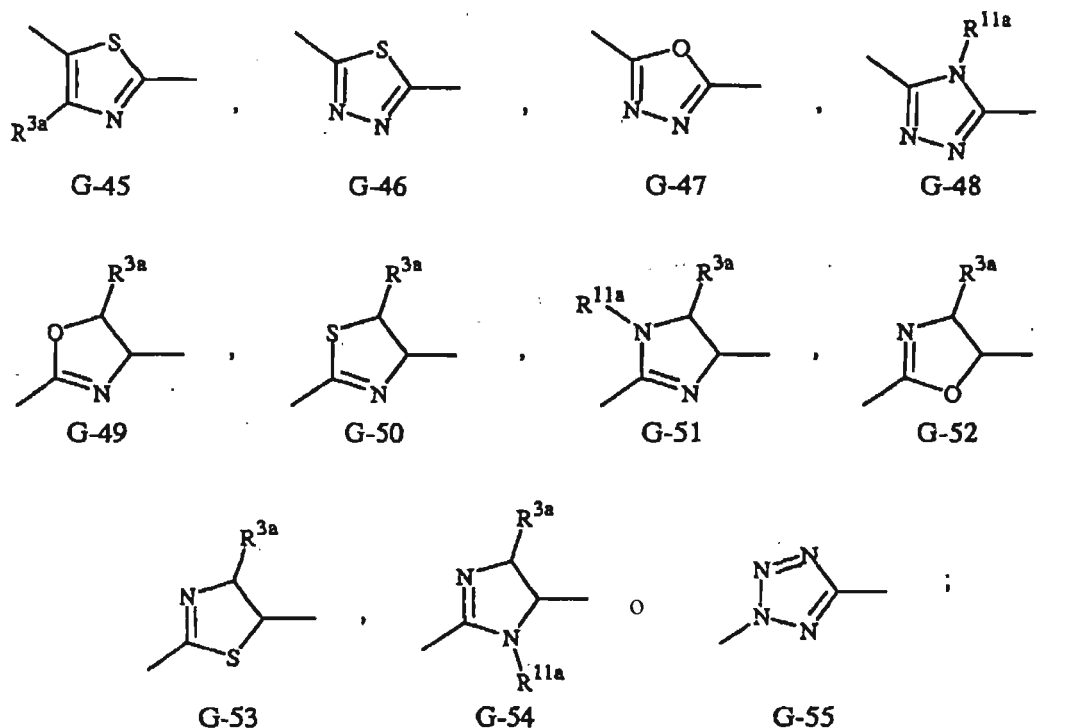
G-42



G-43



G-44



en la que cada R^3 es independientemente alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 o halógeno; cada R^{3a} es seleccionado independientemente de H o R^3 ; R^{11} es alquilo C_1-C_3 ; R^{11a} es seleccionado de H o R^{11} ; y el enlace que se proyecta a la izquierda está unido a X, y el enlace que se proyecta a la derecha está unido a C ($=W^2$).

- 5 Realización 37. Un compuesto de la Realización 36 en el que G es seleccionado de G-1 a G-3, G-7, G-8, G-10, G-11, G-14, G-15, G-23, G-24, G-26 a G-28, G-30, G-36 a G-38 y G-49 a G-55.

Realización 38. Un compuesto de la Realización 37 en el que G es seleccionado de G-1, G-2, G-7, G-8, G-14, G-15, G-23, G-24, G-26, G-27, G-36, G-37, G-38, G-49, G-50 y G-55.

- 10 Realización 39. Un compuesto de la Realización 38 en el que G es seleccionado de G-1, G-2, G-15, G-26, G-27, G-36, G-37 y G-38.

Realización 40. Un compuesto de la Realización 39 en el que G es seleccionado de G-1, G-2, G-15, G-26 y G-36.

Realización 41. Un compuesto de la Realización 40 en el que G es G-1. Son notables las realizaciones de estos compuestos dentro de las Realizaciones 1 a 35, Realizaciones 46 a 96, Realizaciones A1 a A4, y Realizaciones A6 a A13.

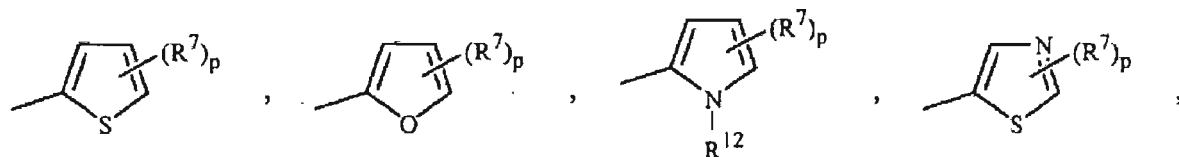
- 15 Realización 42. Un compuesto de la Realización 39 en el que G es G-2. Son notables las realizaciones de estos compuestos dentro de las Realizaciones 1 a 35, Realizaciones 46 a 96, Realizaciones A1 a A4, y Realizaciones A6 a A13.

- 20 Realización 43. Un compuesto de la Realización 36 en el que G es G-15. Son notables las realizaciones de estos compuestos dentro de las Realizaciones 1 a 35, Realizaciones 46 a 96, Realizaciones A1 a A4, y Realizaciones A6 a A13.

Realización 44. Un compuesto de la Realización 36 en el que G es G-26. Son notables las realizaciones de estos compuestos dentro de las Realizaciones 1 a 35, Realizaciones 46 a 96, Realizaciones A1 a A4, y Realizaciones A6 a A13.

- 25 Realización 45. Un compuesto de la Realización 36 en el que G es G-36. Son notables las realizaciones de estos compuestos dentro de las Realizaciones 1 a 35, Realizaciones 46 a 96, Realizaciones A1 a A4, y Realizaciones A6 a A13.

- Realización 46. Un compuesto de Fórmula 1 en el que R^3 es independientemente alquilo C_1-C_3 o halógeno.
- Realización 47. Un compuesto de la Realización 46 en el que R^3 es metilo.
- Realización 48. Un compuesto de una cualquiera de las Realizaciones 36 a 45 en el que G no está sustituido.
- Realización 49. Un compuesto de la Realización 36 en el que R^{3a} es H y R^{11} es H o metilo.
- 5 Realización 51. Un compuesto de Fórmula 1 en el que Q es seleccionado de Q-1 a Q-4, Q-8 a Q-10, Q-12, Q-14, Q-22 a Q-24, Q-40, Q-41, Q-59, Q-62, Q-74 y Q-84.
- Realización 52. Un compuesto de la Realización 51 en el que Q es Q- 1, Q-2, Q-8, Q-14, Q-23, Q-41, Q-59 y Q-62.
- Realización 53. Un compuesto de la Realización 52 en el que Q es Q- 1, Q-2, Q-8, Q-23 y Q-41.
- Realización 54. Un compuesto de la Realización 53 en el que Q es Q- 1.
- 10 Realización 55. Un compuesto de la Realización 53 en el que Q es Q- 2.
- Realización 56. Un compuesto de la Realización 53 en el que Q es Q- 8.
- Realización 57. Un compuesto de la Realización 53 en el que Q es Q- 23.
- Realización 58. Un compuesto de la Realización 53 en el que Q es Q- 41.
- 15 Realización 59. Un compuesto de Fórmula 1 en el que R^5 es alquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , alquino C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , haloalqueno C_2-C_4 , haloalquino C_2-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , ciano, nitro, alcohalquilo C_2-C_4 , alcocarbonilo C_2-C_6 , alquilaminocarbonilo C_2-C_6 o dialquilaminocarbonilo C_3-C_8 .
- Realización 60. Un compuesto de la Realización 59 en el que R^5 es alquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , alquino C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , haloalqueno C_2-C_4 , haloalquino C_2-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , ciano o alcohalquilo C_2-C_4 .
- 20 Realización 61. Un compuesto de la Realización 60 en el que R^5 es alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , haloalqueno C_2-C_4 o ciano.
- Realización 62. Un compuesto de la Realización 61 en el que R^5 es alquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 o ciano.
- Realización 63. Un compuesto de la Realización 62 en el que R^5 es alquilo C_1-C_3 .
- Realización 64. Un compuesto de la Realización 63 en el que R^5 es etilo.
- 25 Realización 65. Un compuesto de Fórmula 1 en el que R^6 es uno de H-1 a H-46;

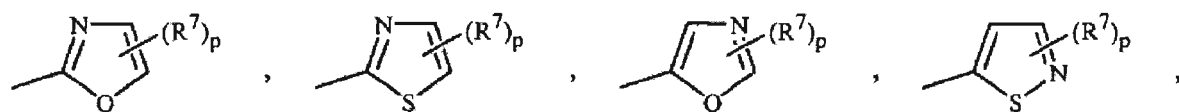


H-1

H-2

H-3

H-4

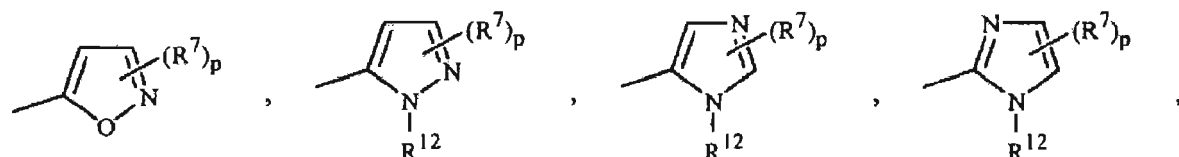


H-5

H-6

H-7

H-8

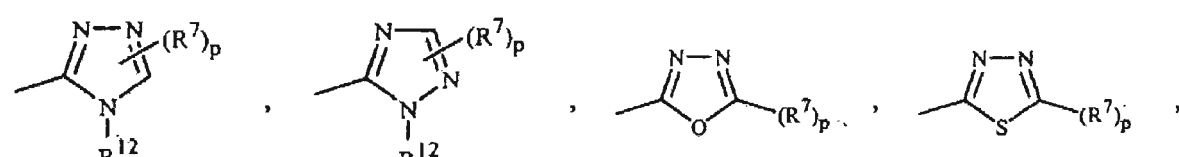


H-9

H-10

H-11

H-12

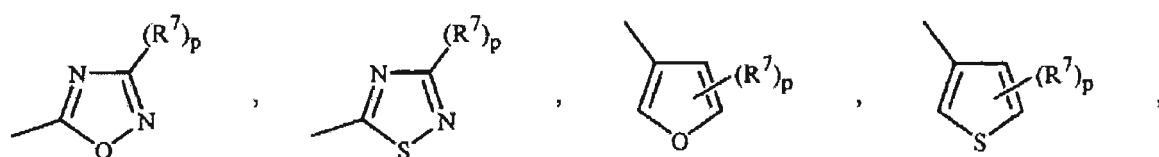


H-13

H-14

H-15

H-16

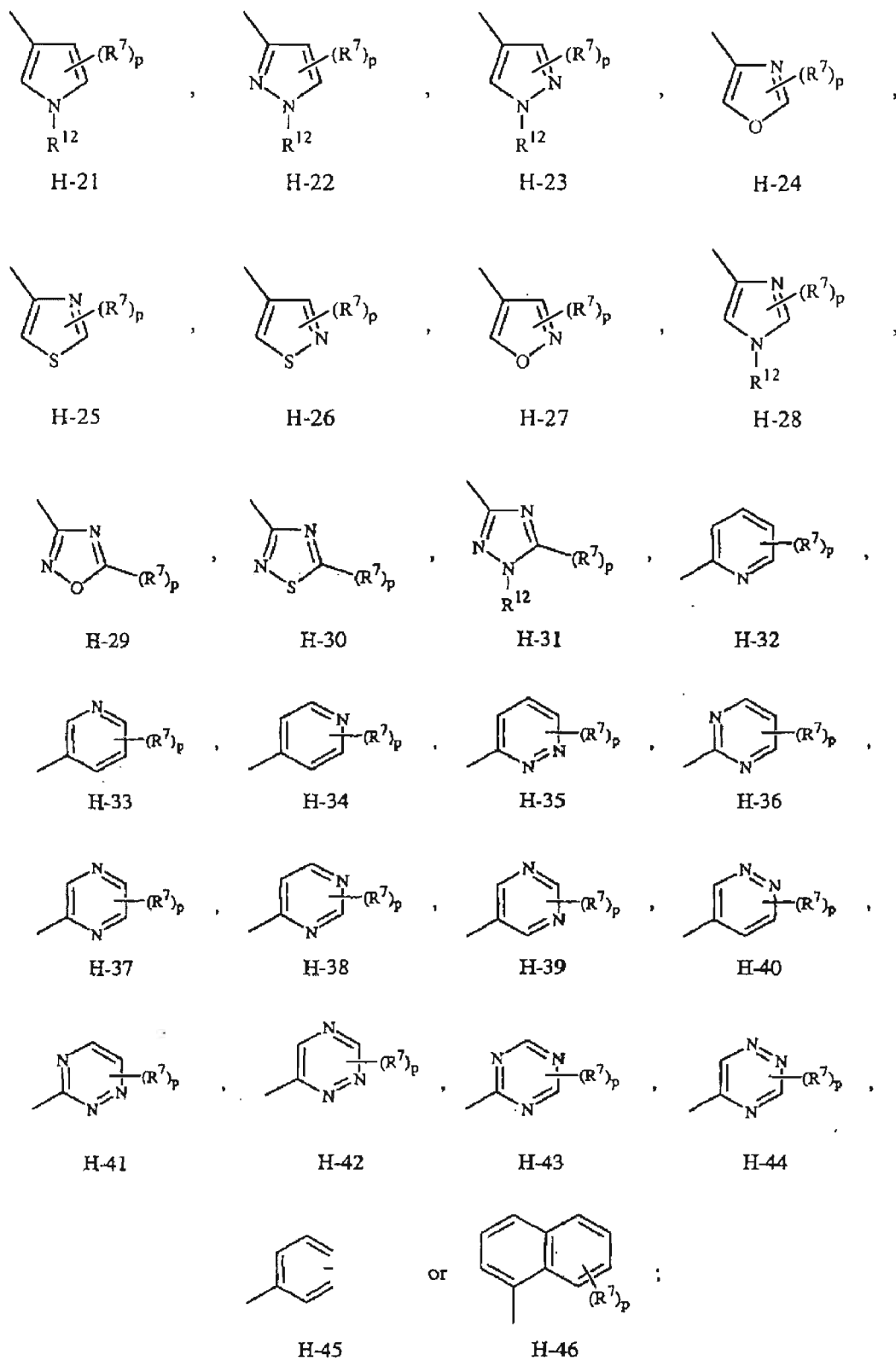


H-17

H-18

H-19

H-20



- en el que cada R^7 es independientemente alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilalquilo C_4-C_{10} , alquilocicloalquilo C_4-C_{10} , alquilocicloalquilalquilo C_5-C_{10} , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , halógeno, hidroxilo, amino, ciano, nitro, alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_8 , cicloalquilamino C_3-C_6 , alcóxialquilo C_2-C_4 , hidroxialquilo C_1-C_4 , alquilcarbonilo C_2-C_4 , alcóxicarbonilo C_2-C_6 , alquilcarboniloxi C_2-C_6 , alquilcarboniltio C_2-C_6 , alquilaminocarbonilo C_2-C_6 , dialquilaminocarbonilo C_3-C_8 o trialquilsililo C_3-C_6 ; y p es 0, 1 o 2.
- Realización 66. Un compuesto de la Realización 65 en el que R^6 es H-1, H-20, H-32, H-45 o H-46.
- Realización 67. Un compuesto de la Realización 66 en el que R^6 es H-1 o H-45.
- Realización 68. Un compuesto de la Realización 67 en el que R^6 es H-45.
- Realización 74. Un compuesto de la Realización 65 en el que p es 0.
- Realización 75. Un compuesto de la Realización 65 en el que R^{12} es H o alquilo C_1-C_2 .
- Realización 76. Un compuesto de la Realización 75 en el que R^1 es metilo.
- Realización 77. Un compuesto de Fórmula 1 en el que R^{15} es H, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 .
- Realización 78. Un compuesto de la Realización 77 en el que R^{15} es H o alquilo C_1-C_3 .
- Realización 79. Un compuesto de la Realización 78 en el que R^{15} es H.
- Realización 80. Un compuesto de Fórmula 1 en el que Q^a es H o alquilo C_1-C_3 .
- Realización 81. Un compuesto de la Realización 80 en el que Q^a es H o metilo.
- Realización 82. Un compuesto de la Realización 81 en el que Q^a es metilo.
- Realización 83. Un compuesto de la Realización 50 en el que cada R^8 es independientemente H, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_3-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_4 , haloalquenilo C_2-C_4 , haloalquinilo C_2-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_6 , halógeno, hidroxilo, amino, ciano, nitro, alcoxi C_1-C_4 o alcóxicarboniloxi C_2-C_4 .
- Realización 84. Un compuesto de la Realización 83 en el que cada R^8 es independientemente H, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_3-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_6 , halógeno, hidroxilo, amino, ciano, nitro, alcoxi C_1-C_4 o alcóxicarboniloxi C_2-C_4 .
- Realización 85. Un compuesto de la Realización 84 en el que cada R^8 es independientemente H, alquilo C_1-C_3 , hidroxilo, alcoxi C_1-C_3 o alquilcarboniloxi C_2-C_3 .
- Realización 86. Un compuesto de la Realización 85 en el que R^8 es H, metilo, metoxi o hidroxilo.
- Realización 87. Un compuesto de Fórmula 1 en el que m es 0 o 1.
- Realización 88. Un compuesto de la Realización 87 en el que m es 0.
- Realización 89. Un compuesto de Fórmula 1 en el que cada R^9 es independientemente alquilo C_1-C_3 , alquenilo C_2-C_3 , alquinilo C_2-C_3 , ciclopropilo, haloalquilo C_1-C_3 , haloalquenilo C_2-C_3 , haloalquinilo C_2-C_3 , halociclopropilo, halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilcarboniloxi C_2-C_3 , alcoxi C_1-C_2 , haloalcoxi C_1-C_2 , alquiltio C_1-C_2 , haloalquiltio C_1-C_2 , alcóxialquilo C_2-C_3 , alquilcarbonilo C_2-C_3 , alcóxicarbonilo C_2-C_3 , alquilaminocarbonilo C_2-C_3 o dialquilaminocarbonilo C_4-C_4 .
- Realización 90. Un compuesto de la Realización 89 en el que cada R^9 es independientemente alquilo C_1-C_3 , ciclopropilo, haloalquilo C_1-C_3 , halociclopropilo, halógeno, hidroxilo, alquilcarboniloxi C_2-C_3 , alcoxi C_1-C_2 o haloalcoxi C_1-C_2 .
- Realización 91. Un compuesto de la Realización 90 en el que cada R^9 es independientemente alquilo C_1-C_3 , hidroxilo, alcoxi C_1-C_2 o halógeno.
- Realización 92. Un compuesto de la Realización 91 en el que cada R^9 es independientemente metilo, F, Cl, Br, hidroxilo o metoxi.
- Realización 93. Un compuesto de Fórmula 1 en el que j es 0 o 1.

Realización 94. Un compuesto de la Realización 93 en el que j es 0.

Realización 95. Un compuesto de Fórmula 1 en el que cada R¹⁰ es H o metilo.

5 Realización 96. Un compuesto de Fórmula 1 en el que Q es Q-1 a Q-75 y Q-83 a Q-85 y Q tiene la orientación que se detalla más arriba en la Realización 50, y en el que R¹⁵ tiene una orientación abajo del plano definido por los átomos distintos de hidrógeno unidos al átomo de carbono identificado con el asterisco (*) (por ejemplo, para Q-1, Formula 1').

Realización 97. Un compuesto de Fórmula 1 en el que cada R¹⁶ es independientemente alquilo C₁-C₃, alquenilo C₂-C₃, alquinilo C₂-C₃, ciclopropilo, haloalquilo C₁-C₃, haloalquenilo C₂-C₃, haloalquinilo C₂-C₃, halociclopropilo, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₂ o haloalcoxi C₁-C₂, o un anillo fenilo o bencilo, opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados de R¹³.

10 Realización 98. Un compuesto de Fórmula 1 en el que R^{16a} es H, alquilo C₁-C₃, alilo, propargilo, ciclopropilo o haloalquilo C₁-C₃; o un anillo fenilo o bencilo, opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados de R¹³.

Realización 99. Un compuesto de la Realización 50 en el que cuando Q es Q-76, Q-77, Q-79, Q-80, Q-81, Q-82, Q-83, Q-84 o Q-85, después m es 0 o 1.

Realización 100. Un compuesto de la Realización 99 en el que m es 1.

15 Realización 101. Un compuesto de Fórmula 1 en el que cuando Q es Q-78 y R^{16a} es distinto que H, después m es 0.

Realización 102. Un compuesto de Fórmula 1 en el que cuando Q es Q-78 y R^{16a} es H, después m es 1.

Realización 103. Un compuesto de Fórmula 1 en el que cuando Q es Q-78, después R^{16a} es distinto que H y m es 0.

Las combinaciones de las Realizaciones 1-103 están ilustradas por:

20 Realización A1. Un compuesto de Fórmula 1 en el que n es 0; R¹ es un fenilo o anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, opcionalmente sustituido con 1 a 2 sustituyentes independientemente seleccionados de R⁴; y cada R⁴ es independientemente alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, hidroxilo, amino, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinito C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinito C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquilo C₂-C₄, hidroxialquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxycarbonilo C₂-C₆, alquilcarboniloxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₈ o trialkilsililo C₃-C₆.

Realización A2. Un compuesto de la Realización A1 en el que W¹ es O y W² es O.

Realización A3. Un compuesto de la Realización A2 en el que A es CH₂.

Realización A4. Un compuesto de la Realización A3 en el que X es X¹ y X².

30 Realización A5. Un compuesto de la Realización A4 en el que G es G-1, G-2, G-15, G-26 o G-36.

Realización A6. Un compuesto de la Realización A5 en el que G no está sustituido.

Realización A7. Un compuesto de la Realización A6 en el que Q es Q-1, Q-2, Q-8, Q-23 o Q-41 y Q^a es H o alquilo C₁-C₃.

Realización A8. Un compuesto de la Realización A7 en el que R⁵ es alquilo C₁-C₃, R⁶ es H-45, R¹ es H, y p es 0.

35 Realización A9. Un compuesto de la Realización A7 en el que j es 0, m es 0 o 1, y R⁸ es H, metilo, metoxi o hidroxilo.

Realización A10. Un compuesto de una cualquiera de las Realizaciones A8 y A9 en el que R¹ es U-1 o U-50.

Realización A11. Un compuesto de la Realización A10 en el que cada R⁴ es independientemente Cl, Br, metilo, etilo, trifluorometilo o metoxi.

40 Realización A12. Un compuesto de la Realización A11 en el que Q es Q-1, Q^a es metilo, R⁵ es alquilo C₁-C₂, R¹⁵ es H, y el átomo de carbono al que R⁵ y R⁶ están unidos es un estereocentro con la configuración R.

Realización A13. Un compuesto de la Realización A11 en el que Q es Q-2, Q-8, Q-23 o Q-41, Q^a es metilo, R¹⁵ es H, y el átomo de carbono identificado con el asterisco (*) es un estereocentro que tiene una configuración que se describe como

R, siempre que cuando m es 1, R⁸ es hidroxilo o metoxi y el grupo R⁸ está unido al carbono adyacente al átomo de carbono identificado con un asterisco (*), después el átomo de carbono identificado con el asterisco (*) es un estereocentro que tiene una configuración que se describe como S.

Las realizaciones específicas incluyen compuestos de Fórmula 1 seleccionadas del grupo que consiste en:

- 5 2-[1-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida,
2-[1-[(2,5-diclorofenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida,
N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida,
- 10 N-[(1R)-2,3-dihidro-1H-inden-1-il]-N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarboxamida,
N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida,
N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R,4S)-1,2,3,4-tetrahidro-4-hidroxilo-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida y su enantiómero,
- 15 N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-(1,2,3,4-tetrahidro-2-metil-1-naftalenil)-4-tiazolcarboxamida,
N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R,4R)-1,2,3,4-tetrahidro-4-hidroxilo-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida y su enantiómero,
- 20 2-[1-[[5-etil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida,
2-[1-[[3,5-bis(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida,
N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-(1,2,3,4-tetrahidro-4-oxo-1-naftalenil)-1-tiazolcarboxamida,
- 25 N-metil-2-[4-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-1-piperazinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida,
N-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarboxamida,
- 30 N-(2,3-dihidro-2-metil-1H-inden-1-il)-N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarboxamida,
N-metil-1-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-1H-pirazol-3-carboxamida,
N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-2H-1,2,3-triazol-4-carboxamida,
- 35 N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-1H-pirazol-4-carboxamida,
N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R,1S)-1,2,3,4-tetrahidro-2-metil-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida y su enantiómero,
- 40 N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-4-tiazolcarboxamida,
2-[1-[[3,5-dicloro-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida,
2-[1-[[5-cloro-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida,

N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-oxazolcarboxamida, y

N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil)-4-tiazolcarboxamida.

- 5 Son notables los compuestos de Fórmula 1 donde G es el anillo tiazol, Q es Q-1 y X es X^1 y X está unido al anillo tiazol G en la posición 2 de dicho anillo tiazol. Son particularmente notables las realizaciones de estos compuestos dentro de las Realizaciones 1 a 35, Realización 41, Realizaciones 59 a 82, Realización 96, Realizaciones A1 a A4, Realización A6, Realización A8 y Realizaciones A10 a A12.
- 10 Son notables los compuestos de Fórmula 1 donde G es el anillo oxazol, Q es Q-1 y X es X^1 y X está unido a el anillo oxazol G en la posición 2 de dicho anillo oxazol. Son particularmente notables las realizaciones de estos compuestos dentro de las Realizaciones 1 a 11, Realizaciones 14 a 35, Realización 41, Realizaciones 59 a 82, Realización 96, Realizaciones A1 a A4, Realización A6, Realización A8 y Realizaciones A10 a A12.
- 15 Son notables los compuestos de Fórmula 1 donde G es el anillo tiazol, Q es Q-1 y X es X^2 y X está unido al anillo tiazol G en la posición 2 de dicho anillo tiazol. Son particularmente notables las realizaciones de estos compuestos dentro de las Realizaciones 1 a 11, Realizaciones 14 a 35, Realización 41, Realizaciones 59 a 82, Realización 96, Realizaciones A1 a A4, Realización A6, Realización A8 y Realizaciones A10 a A12.
- 20 Son notables los compuestos de Fórmula 1 donde G es el anillo oxazol, Q es Q-1 y X es X^2 y X está unido al anillo oxazol G en la posición 2 de dicho anillo oxazol. Son particularmente notables las realizaciones de estos compuestos dentro de las Realizaciones 1 a 11, Realizaciones 14 a 35, Realización 41, Realizaciones 59 a 82, Realización 96, Realizaciones A1 a A4, Realización A6, Realización A8 y Realizaciones A10 a A12.
- 25 Son notables los compuestos de Fórmula 1 donde G es el anillo tiazol, Q es Q-2 y X es X^1 y X está unido al anillo tiazol G en la posición 2 de dicho anillo tiazol. Son particularmente notables las realizaciones de estos compuestos dentro de las Realizaciones 1 a 35, Realización 41, Realizaciones 59 a 82, Realización 96, Realizaciones A1 a A4, Realización A6, Realización A8 y Realizaciones A10 a A12.
- 30 Son notables los compuestos de Fórmula 1 donde G es el anillo tiazol, Q es Q-2 y X es X^2 y X está unido al anillo tiazol G en la posición 2 de dicho anillo tiazol. Son particularmente notables las realizaciones de estos compuestos dentro de las Realizaciones 1 a 11, Realizaciones 14 a 35, Realización 41, Realizaciones 59 a 82, Realización 96, Realizaciones A1 a A4, Realización A6, Realización A8 y Realizaciones A10 a A12.
- 35 Son notables los compuestos de Fórmula 1 donde G es el anillo oxazol, Q es Q-2 y X es X^2 y X está unido al anillo oxazol G en la posición 2 de dicho anillo oxazol. Son particularmente notables las realizaciones de estos compuestos dentro de las Realizaciones 1 a 11, Realizaciones 14 a 35, Realización 41, Realizaciones 59 a 82, Realización 96, Realizaciones A1 a A4, Realización A6, Realización A8 y Realizaciones A10 a A12.
- 40 Son notables los compuestos de Fórmula 1 donde G es el anillo tiazol, Q es Q-8 y X es X^1 y X está unido al anillo tiazol G en la posición 2 de dicho anillo tiazol. Son particularmente notables las realizaciones de estos compuestos dentro de las Realizaciones 1 a 35, Realización 41, Realizaciones 59 a 82, Realización 96, Realizaciones A1 a A4, Realización A6, Realización A8 y Realizaciones A10 a A12.
- 45 Son notables los compuestos de Fórmula 1 donde G es el anillo oxazol, Q es Q-8 y X es X^1 y X está unido al anillo oxazol G en la posición 2 de dicho anillo oxazol. Son particularmente notables las realizaciones de estos compuestos dentro de las Realizaciones 1 a 35, Realizaciones 42, Realizaciones 59 a 82, Realización 96, Realizaciones A1 a A4, Realización A6, Realización A8 y Realizaciones A10 a A12.
- 50 Son notables los compuestos de Fórmula 1 donde G es el anillo tiazol, Q es Q-8 y X es X^2 y X está unido al anillo tiazol G en la posición 2 de dicho anillo tiazol. Son particularmente notables las realizaciones de estos compuestos dentro de las Realizaciones 1 a 11, Realizaciones 14 a 35, Realización 41, Realizaciones 59 a 82, Realización 96, Realizaciones A1 a A4, Realización A6, Realización A8 y Realizaciones A10 a A12.
- 50 Son notables los compuestos de Fórmula 1 donde G es el anillo oxazol, Q es Q-8 y X es X^2 y X está unido al anillo oxazol G en la posición 2 de dicho anillo oxazol. Son particularmente notables las realizaciones de estos compuestos dentro de las Realizaciones 1 a 11, Realizaciones 14 a 35, Realización 41, Realizaciones 59 a 82, Realización 96, Realizaciones A1 a A4, Realización A6, Realización A8 y Realizaciones A10 a A12.

dentro de las Realizaciones 1 a 11, Realizaciones 14 a 35, Realización 41, Realizaciones 59 a 82, Realización 96, Realizaciones A1 a A4, Realización A6, Realización A8 y Realizaciones A10 a A12.

La presente invención proporciona una composición funguicida que comprende un compuesto de Fórmula 1 (incluyendo todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, N-óxidos, y sales apropiadas para uso agrícola del mismo), y al menos otro fungicida. Son notables como realización de dichas composiciones las composiciones que comprenden un compuesto correspondiente a cualquiera de las realizaciones del compuesto que se describen más arriba.

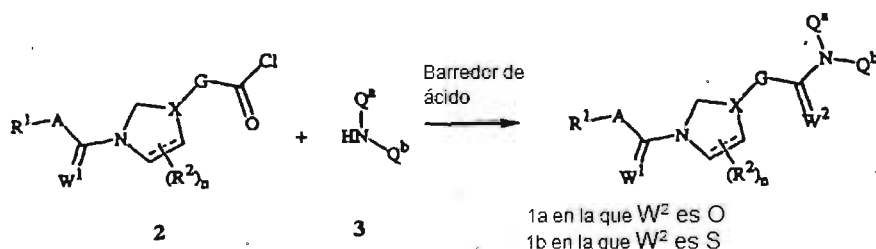
La presente invención proporciona una composición funguicida que comprende una cantidad funguicidamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1 (incluyendo todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, N-óxidos, y sales apropiadas para uso agrícola del mismo), y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. Son notables como realización de dichas composiciones las composiciones que comprenden un compuesto correspondiente a cualquiera de las realizaciones del compuesto que se describe más arriba.

La presente invención proporciona un procedimiento para controlar enfermedades vegetales provocadas por patógenos vegetales micóticos que comprende aplicar a la planta o porción de la misma, o a la semilla de la planta o plántula, una cantidad funguicidamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1 (incluyendo todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, N-óxidos, y sales apropiadas para uso agrícola del mismo). Son notables como realización de dichos procedimientos los procedimientos que comprenden aplicar una cantidad funguicidamente efectiva de un compuesto correspondiente a cualquiera de las realizaciones del compuesto que se describe más arriba. Es particularmente notable la realización donde los compuestos se aplican como composiciones de la presente invención.

Los compuestos de Fórmula 1 pueden prepararse mediante uno o más de los siguientes procedimientos y variaciones tal como se describe en los Esquemas 1-22. las definiciones de R^1 , R^2 , A, W^1 , W^2 , X, G, Q^a , y n en los compuestos de Fórmulas 1-46 más abajo son tal como se definen más arriba en el Compendio de la invención y el grupo NQ^aQ^b corresponde a Q en los compuestos de Fórmula 1 a menos que se indique lo contrario. Los compuestos de Fórmulas 1a-1k son diversos subgrupos de los compuestos de Fórmula 1. Los compuestos de Fórmulas 19a-19b son diversos subgrupos de los compuestos de Fórmula 19. Los compuestos de Fórmulas 23a, 26a y 27a son diversos subgrupos de los compuestos de Fórmula 23, 26 y 27 respectivamente.

Tal como se muestra en el Esquema 1, los compuestos de Fórmula 1 pueden prepararse mediante el acoplamiento de un cloruro de ácido de Fórmula 2 con una amina de Fórmula 3 en presencia de un barredor de ácido para proporcionar el compuesto de Fórmula 1a. los barredores de ácido típicos incluyen bases de amina tal como trietilamina, diisopropiletilamina y piridina. Otros barredores incluyen hidróxidos tal como hidróxido de sodio y potasio y carbonatos tal como carbonato de sodio y carbonato de potasio. En ciertos casos es útil utilizar barredores de ácido soportados por polímeros tal como diisopropiletilamina unida a polímeros y N,N dimetilaminopiridina unida a polímeros. En una etapa posterior, las amidas de Fórmula 1a pueden convertirse en tioamidas de Fórmula 1b utilizando una variedad de reactivos tantes estándar tal como pentasulfuro de fósforo o 2,4-bis (4-metoxifenil)-1,3-ditia-2,4-difosfetano-2,4-disulfuro (reactivo de Lawesson). Un experto en la técnica reconocerá que cuando W^1 es O, la conversión de W^2 de O a S puede estar acompañada por la conversión de W^1 de O a S. Las aminas de Fórmula 3 son conocidas o pueden prepararse mediante procedimientos conocidos para un experto en la técnica. Las NH_2 con formato de alquilo seguido por la reducción de hidruro de aluminio y litio o por una reducción de borohidruro de sodio de iminas de N-alquilo preparadas tratando $Q^a(=O)$ con una alquilamina.

Esquema 1

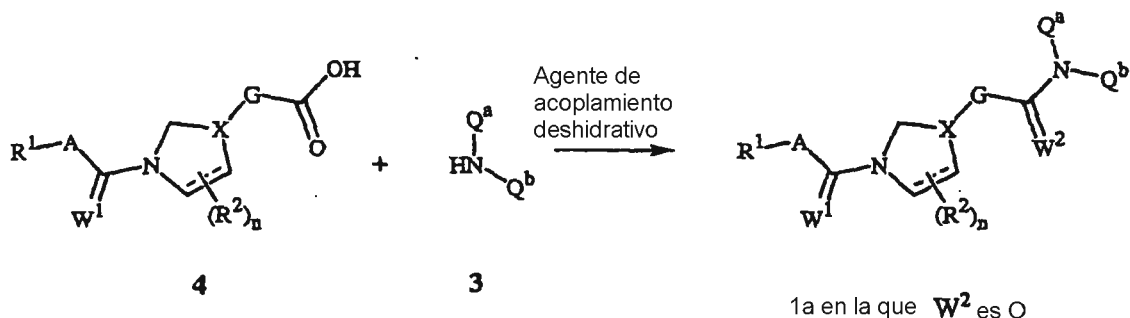


Un procedimiento alternativo para la preparación de los compuestos de Fórmula 1a está representado en el Esquema 2 e incluye acoplar un ácido de Fórmula 4 con una amina de Fórmula 3 en presencia de un reactivo de acoplamiento deshidrativo tal como diciclohexilcarbodiimida (DCC), hidrocloreto de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDC) o hexafluorofosfato de O-benzotriazol-1-il-N,N,N',N'-tetrametiluronio (HBTU). Los reactivos soportados por polímeros son nuevamente útiles aquí, tal como ciclohexilcarbodiimida unida a polímeros. Estas reacciones se operan típicamente a

0-40 °C en un disolvente tal como diclorometano o acetonitrilo en presencia de una base tal como trietilamina o diisopropiletilamina.

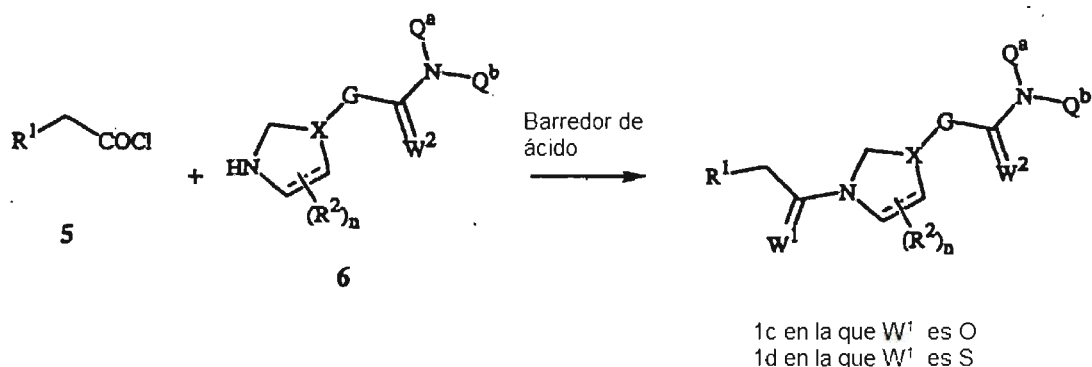
Tal como se muestra en el Esquema 3, los compuestos de Fórmula 1c en los que A es metileno pueden prepararse mediante el acoplamiento de un cloruro de ácido de Fórmula 5 con una amina de Fórmula 6 en presencia de un barredor de ácido, tal como se describe para el Esquema 1 más arriba. Las sales ácidas de las aminas de Fórmula 6 también pueden utilizarse en esta reacción, siempre que estén presentes al menos 2 equivalentes del barredor de ácido, tal como es conocido para un experto en la técnica. Los ácidos típicos utilizados para formar sales con aminas incluyen ácido clorhídrico, ácido oxálico y ácido trifluoroacético. En una etapa posterior, las amidas de Fórmula 1c pueden convertirse en tioamidas.

Esquema 2



Tal como se muestra en el Esquema 3, los compuestos de Fórmula 1c en los que A es metileno pueden prepararse mediante el acoplamiento de un cloruro de ácido de Fórmula 5 con una amina de Fórmula 6 en presencia de un barredor de ácido, tal como se describe para el Esquema 1 más arriba. Las sales ácidas de aminas de Fórmula 6 también pueden utilizarse en esta reacción, siempre que al menos 2 equivalentes del barredor de ácido estén presentes, tal como es conocido para un experto en la técnica. Los ácidos típicos utilizados para formar sales con aminas incluyen ácido clorhídrico, ácido oxálico y ácido trifluoroacético. En una etapa posterior, las amidas de Fórmula 1c pueden convertirse en tioamidas de Fórmula 1d utilizando una variedad de reactivos tiantes estándar tal como pentasulfuro de fósforo o 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3-ditio-2,4-difosfetano-2,4-disulfuro (reactivo de Lawesson¹). Un experto en la técnica reconocerá que cuando W² es O, que la conversión de W¹ de O a S no puede ser selectiva.

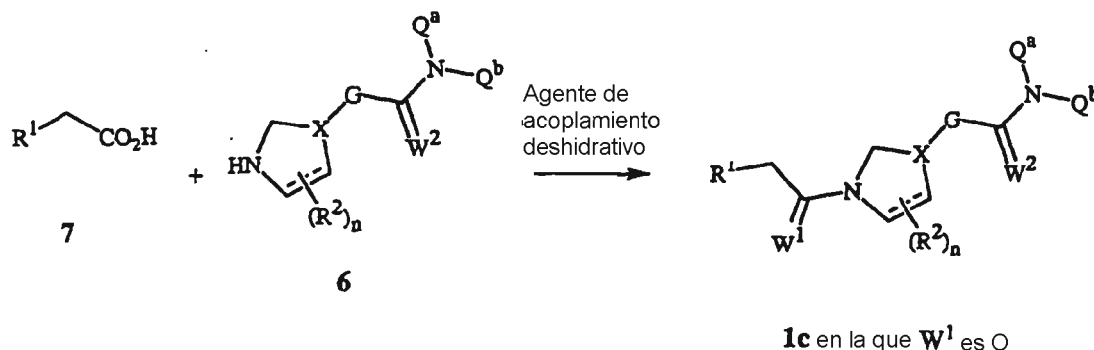
Esquema 3



Tal como se muestra en el Esquema 4, los compuestos de Fórmula 1c también pueden prepararse mediante el acoplamiento de un ácido de Fórmula 7 con una amina de Fórmula 6 (o su sal de ácido) en presencia de un reactivo de acoplamiento deshidrativo, análogo al procedimiento que se describe en el Esquema 2 más arriba. Los ácidos de Fórmula 7 son conocidos o pueden prepararse mediante procedimientos conocidos para un experto en la técnica. Por ejemplo, R^1CH_2COOH donde R^1 es un anillo heteroaromático unido a través de nitrógeno puede prepararse haciendo reaccionar el correspondiente compuesto R^1H con un ácido haloacético o éster en presencia de base; véase, por ejemplo, la patente estadounidense 4.084.955. R^1CH_2COOH donde R^1 es un fenilo o un anillo heteroaromático unido a través del carbono puede prepararse a partir de los correspondientes compuestos de R^1CH_2 -halógeno mediante el

desplazamiento del halógeno con cianuro seguido por hidrólisis; véase, por ejemplo, K. Adachi, Yuki Gosei Kagaku Kyokasho 1969, 27, 875-876; a partir de $R^1C(=O)CH_3$ por la reacción de Willgerdt-Kindler; véase, por ejemplo, H. R. Darabi, et al., Tetrahedron Letters 1999, 40, 7549-7552 y M. M. Alam y S. R. Adapa, Synthetic Communications 2003, 33, 59-63 y referencias citadas en el mismo; o a partir de R^1Br o R^1I por el acoplamiento catalizado de paladio con acetato de t-butilo o malonato de dietilo seguido por hidrólisis de éster; véase, por ejemplo, W. A. Moradi y S. L. Buchwald, J. Am. Chem. Soc. 2001, 123, 7996-8002 y J. F. Hartwig et al., J. Am. Chem. Soc. 2002, 124, 12557-12565.

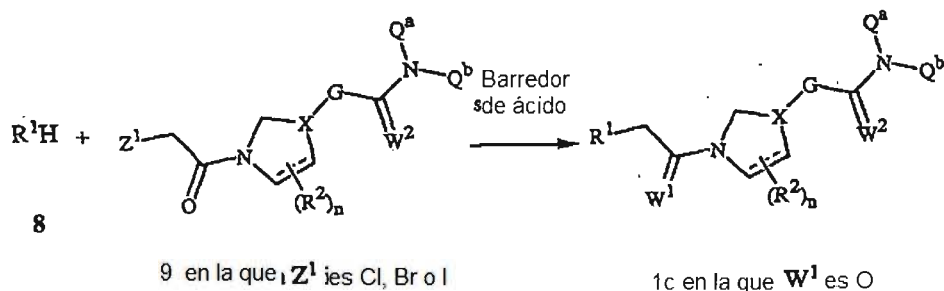
Esquema 4



Los procedimientos sintéticos de los Esquemas 1, 2, 3 y 4 son solamente ejemplos representativos de procedimientos útiles para la preparación de los compuestos de Fórmula 1, ya que la literatura sintética es extensa para las reacciones de formación de amida. Un experto en la técnica reconocerá que el compuesto de Fórmula 1 donde Q^a es distinto que H o OH pueden prepararse a partir de compuestos de Fórmula 1 donde Q^a es H mediante procedimientos de alquilación o acilación estándar. Un experto en la técnica también se dará cuenta que los cloruros de ácido de Fórmula 2 y Fórmula 5 pueden prepararse a partir de ácidos de Fórmula 4 y Fórmula 7, respectivamente, mediante numerosos procedimientos bien conocidos.

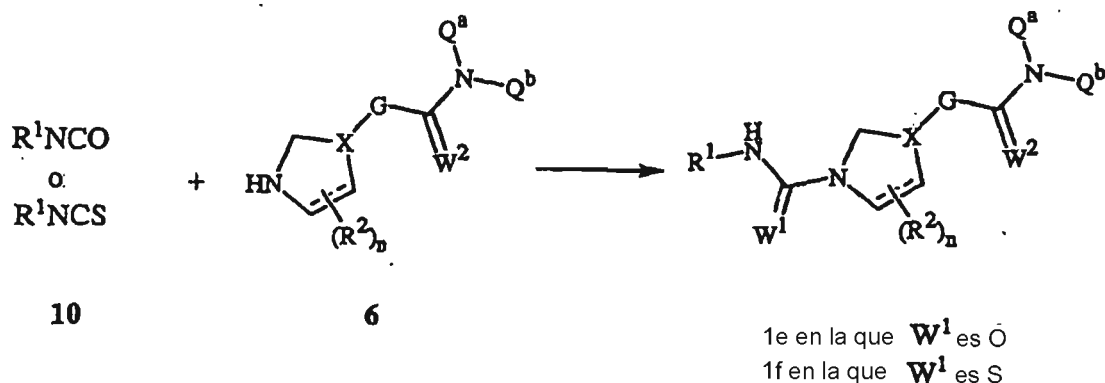
Ciertos compuestos de Fórmula 1c donde R^1 es un anillo heteroaromático que contiene nitrógeno de 5 miembros unido al átomo de nitrógeno pueden prepararse mediante la reacción del heterociclo progenitor de Fórmula 8 y una haloacetamida de Fórmula 9 tal como se muestra en el Esquema 5. La reacción se lleva a cabo en presencia de una base tal como hidruro de sodio o carbonato de potasio en un disolvente tal como tetrahidrofurano, N,N-dimetilformamida o acetonitrilo a 0 a 80 °C. La haloacetamida de Fórmula 9 puede prepararse mediante la reacción de una amina de Fórmula 6 con un haluro de haloacetilo o un ácido haloacético o su anhídrido, análoga a las reacciones de formación de amida que se describen en los Esquemas 3 y 4, respectivamente.

Esquema 5



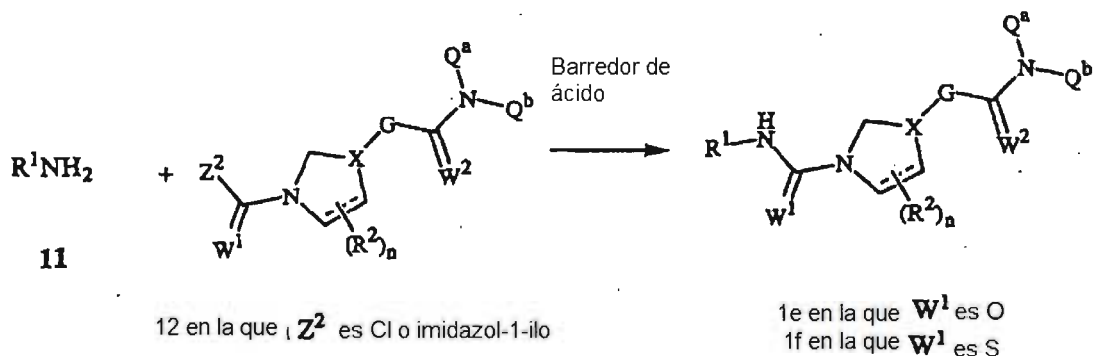
Los compuestos de Fórmula 1e y 1f en los que A es NH, donde R^1 es fenilo o a anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros unido a través de un átomo de carbono, pueden prepararse mediante la reacción de un isocianato o un isotiocianato de Fórmula 10 con una amina de Fórmula 6, respectivamente, tal como se describe en el Esquema 6. esta reacción típicamente se lleva a cabo a una temperatura ambiente en un disolvente aprótico tal como diclorometano o acetonitrilo.

Esquema 6



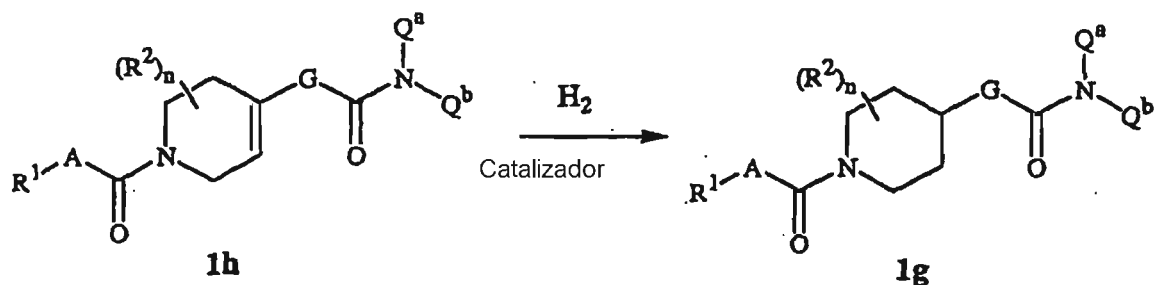
Los compuestos de Fórmula 1e y 1f también pueden prepararse mediante la reacción de una amina de Fórmula 11 con un cloruro de tiocarbamoilo o carbamoilo o imidazol de Fórmula 12 tal como se muestra en el Esquema 7. Cuando Z^2 es cloro, la reacción típicamente se lleva a cabo en presencia de un barredor de ácido. Los barredores de ácido típicos incluyen bases de amina tal como trietilamina, diisopropiletilamina y piridina. Otros barredores incluyen hidróxidos tal como hidróxido de sodio y potasio y carbonatos tal como carbonato de sodio y carbonato de potasio. Los cloruros de tiocarbamoilo o carbamoilo de Fórmula 12 (en los que Z^2 es Cl) pueden prepararse a partir de aminas de Fórmula 6 mediante el tratamiento con fosgeno o tiofosgeno, respectivamente, o sus equivalentes, mientras los imidazoles de carbamoilo o tiocarbamoilo de Fórmula 12 (en los que Z^2 es imidazol-1-ilo) pueden prepararse a partir de aminas de Fórmula 6 mediante el tratamiento con 1,1'-carbonildiimidazol o 1,1'-tiocarbonildiimidazol, respectivamente, de acuerdo a procedimientos generales conocidos para un experto en la técnica.

Esquema 7



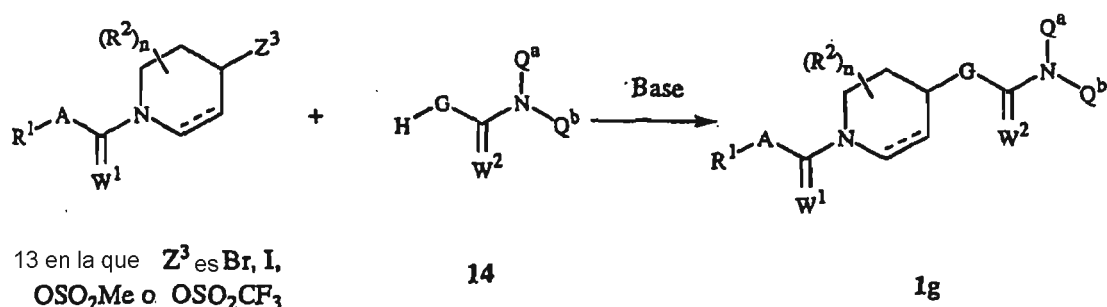
Ciertos compuestos de Fórmula 1g donde G está unido al anillo piperidina a través de un átomo de carbono pueden prepararse a partir de los compuestos de Fórmula 1h por hidrogenación catalítica tal como se muestra en el Esquema 8. Las condiciones típicas incluyen exponer un compuesto de Fórmula 1h a hidrógeno gaseoso a una presión de 14 a 100 psi (96 a 689 kPa), preferiblemente 40 a 50 psi (276 a 345 kPa), en presencia de un catalizador de metal tal como paladio soportado en un vehículo inerte tal como carbón activado, en una relación en peso de 5 a 20 % de metal y vehículo, suspendido en un disolvente tal como etanol a una temperatura ambiente. La literatura sintética acerca de estos tipos de reducciones es extensa; véase, por ejemplo, Catalytic Hydrogenation, L. Cervený, Ed., Elsevier Science, Amsterdam, 1986. Un experto en la técnica reconocerá que ciertas funcionalidades que pueden estar presentes en los compuestos de Fórmula 1h también pueden ser reducidas en condiciones de hidrogenación catalítica, requiriendo una selección apropiada de catalizador y condiciones.

Esquema 8



Ciertos compuestos de Fórmula 1g donde G está unido al anillo piperidina a través de un átomo de nitrógeno pueden prepararse mediante el desplazamiento de un grupo saliente apropiado Z^3 en una piperidina de Fórmula 13 con un heterociclo que contiene nitrógeno de Fórmula 14 en presencia de una base tal como está representado en el Esquema 9. Las bases apropiadas incluyen hidruro de sodio o carbonato de potasio y la reacción se lleva a cabo en un disolvente tal como N,N-dimetilformamida o acetonitrilo a 0 a 80 °C. Los grupos salientes apropiados en las piperidinas de Fórmula 13 incluyen bromo, yodo, mesilato (OMs, $OS(O)_2CH_3$), triflato ($OS(O)_2CF_3$) y similar, y pueden prepararse a partir de los correspondientes compuestos de piperidina de Fórmula 13 donde Z^3 es OH, tal como es conocido para un experto en la técnica

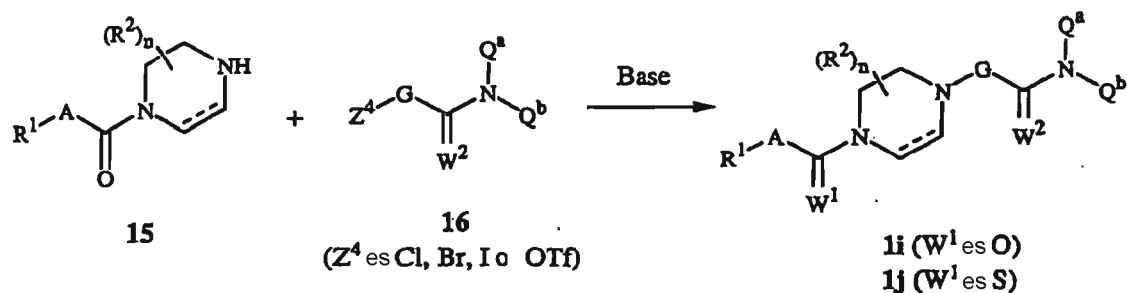
Esquema 9



Los compuestos de Fórmula 1i pueden prepararse mediante la reacción de una piperazina de Fórmula 15 con un haluro o triflato heterociclo (OTf, $OS(O)_2CF_3$) de Fórmula 16 tal como se muestra en el Esquema 10. La reacción se lleva a cabo en presencia de una base

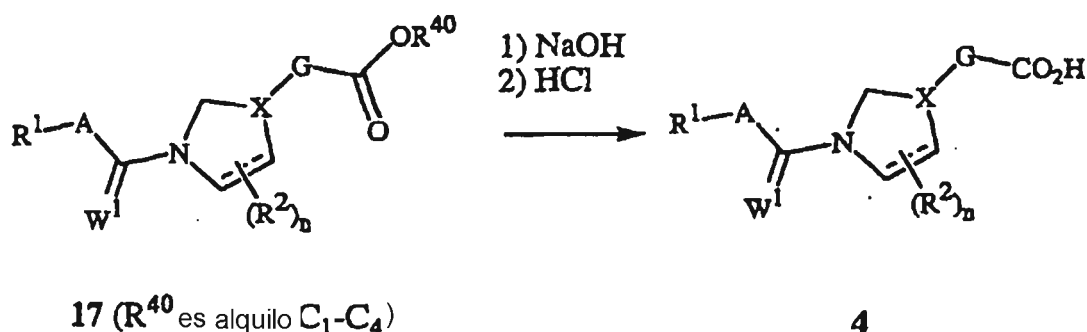
Los compuestos de Fórmula 11 pueden prepararse mediante la reacción de una piperazina de Fórmula 15 con un haluro o triflato heterociclo (OTf, $OS(O)_2CF_3$) de Fórmula 16 tal como se muestra en el Esquema 10. La reacción se lleva a cabo en presencia de una base tal como carbonato de potasio en un disolvente tal como dimetilsulfóxido, NN-dimetilformamida o acetonitrilo a 0 a 80 °C. En una etapa posterior, los compuestos de Fórmula 11 pueden convertirse en compuestos de Fórmula 1j utilizando una variedad de reactivos tantes estándar tal como pentasulfuro de fósforo o 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3-ditia-2,4-difosfetano-2,4-disulfuro (reactivo de Lawesson). Un experto en la técnica reconocerá que cuando W^2 es O, que la conversión de W^1 de O a S puede no ser selectiva. Los compuestos de Fórmula 16 donde Z^4 es triflato pueden prepararse a partir de los correspondientes compuestos de Fórmula 16 donde Z^4 es OH mediante procedimientos conocidos para un experto en la técnica.

Esquema 10



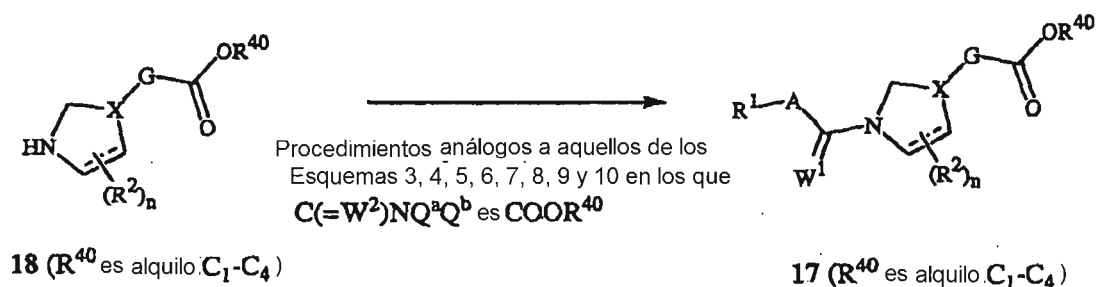
Los compuestos de ácido de Fórmula 4 pueden prepararse por saponificación de los correspondientes compuestos de éster de Fórmula 17 utilizando un hidróxido de metal alcali tal como LiOH, NaOH o KOH habitualmente en presencia de agua junto con un co-disolvente tal como tetrahidrofurano y/o metanol para ayudar a la solubilidad del éster tal como se muestra en el Esquema 11. La reacción típicamente se realiza a 0 a 60 °C con la sal de carboxilato resultante siendo convertida en el ácido libre mediante la adición de un leve exceso de ácido mineral tal como ácido clorhídrico o ácido sulfúrico.

Esquema 11



Según lo detallado en el Esquema 12, los compuestos de éster de Fórmula 17 pueden prepararse a partir de los compuestos de amina de Fórmula 18 mediante procedimientos análogos a aquellos que se describen más arriba para la preparación de los compuestos de Fórmula 1 según lo detallado en el Esquema 12. Un experto en la técnica reconocerá que pueden utilizarse procedimientos análogos a aquellos de los Esquemas 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 y 10, en los que el grupo COOR⁴⁰ donde R⁴⁰ es alquilo C₁-C₄ es sustituido por el grupo C(=W²)NQ^aQ^b para proporcionar intermediarios de Fórmula 17 útiles para la preparación de los compuestos de Fórmula 1.

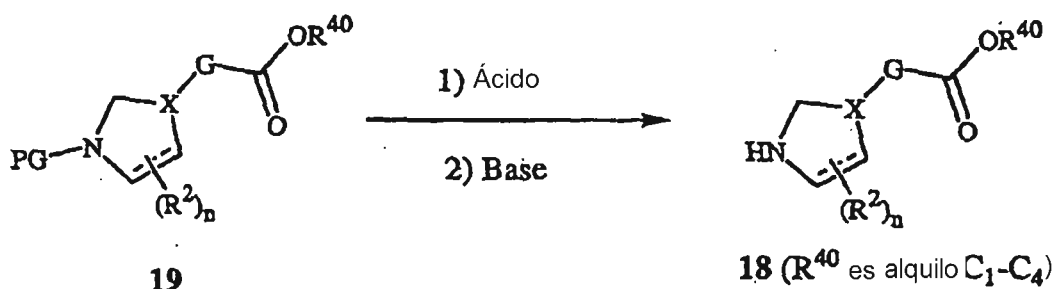
Esquema 12



Los compuestos de amina de Fórmula 18 pueden prepararse a partir de los compuestos de amina protegidos de Fórmula 19 donde PG es un grupo protector de amina lábil al ácido tal como un grupo t-butoxicarbonilo (t-Boc) o benciloxicarbonilo (Cbz) tal como se muestra en el Esquema 13. El grupo protector es eliminado mediante el tratamiento

con un ácido tal como ácido trifluoroacético o HCl gaseoso en presencia de un disolvente tal como diclorometano o dioxano. La amina puede aislarse como su sal de ácido o convertirse en una etapa posterior en la amina libre mediante el tratamiento con una base, tal como es conocido para un experto en la técnica.

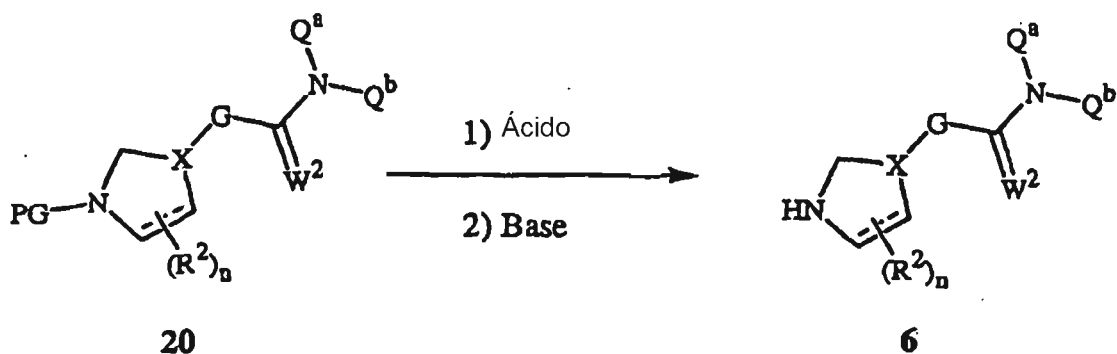
Esquema 13



en la que R^{40} es alquilo $C_1\text{-C}_4$; PG es un grupo protector lábil al ácido.

Las aminas de Fórmula 6 pueden prepararse a partir de aminas protegidas de Fórmula 20 donde PG es yb grupo protector lábil al ácido tal como un grupo t-butoxicarbonilo (t-Boc) o benciloxicarbonilo (Cbz) tal como está representado en el Esquema 14 mediante procedimientos análogos a aquellos que se describen más arriba para la preparación de los compuestos de Fórmula 18 según lo detallado en el Esquema 13.

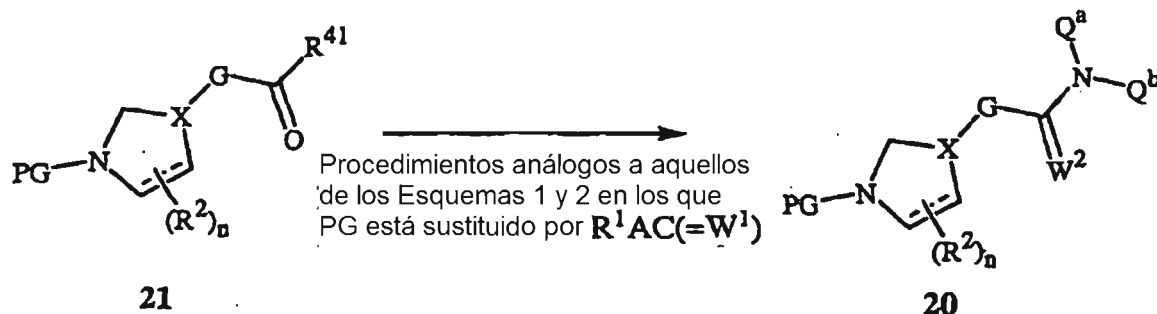
Esquema 14



en la que PG es un grupo protector lábil al ácido.

Las aminas protegidas de Fórmula 20 pueden prepararse a partir de compuestos de ácido o cloruro de ácido de Fórmula 21 mediante procedimientos análogos a aquellos que se describen más arriba para la preparación de los compuestos de Fórmula 1 según lo detallado en el Esquema 15. Un experto en la técnica reconocerá que en los Esquemas 1, 2, 8, 9 y 10, el grupo $R^1\text{AC}(=W^1)$ puede ser reemplazado en forma análoga por PG donde PG es un grupo protector de amina lábil al ácido estándar tal como un grupo t-butoxicarbonilo (t-Boc) o benciloxicarbonilo (Cbz) para dar intermediarios útiles de Fórmula 20 para la preparación de los compuestos de Fórmula 1. Los compuestos de Fórmula 21 donde R^{41} es OH pueden obtenerse a partir de los compuestos de Fórmula 19 por saponificación, análogos a los procedimientos que se describen para el Esquema 11.

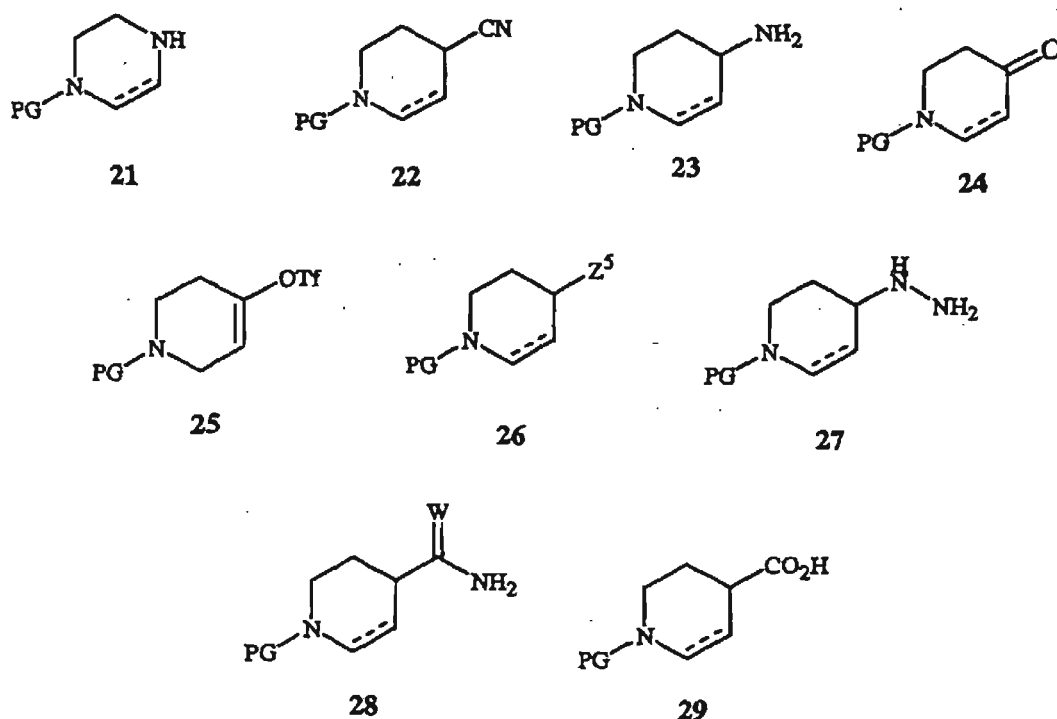
Esquema 15



en la que R^{41} es Cl u OH; PG es un grupo protector lábil al ácido.

Muchos compuestos de Fórmula 19 son conocidos o pueden prepararse mediante procedimientos conocidos para una persona con experiencia en la técnica comenzando con intermediarios tal como, pero sin limitarse a, aquellos que se describen en el Anexo Explicativo 1. La literatura sintética es extensa para la formación del sistema heteroaromático anular de 5 miembros o sistema heterocíclico anular parcialmente saturado de 5 miembros (por ejemplo, G-1 a G-55); véase, por ejemplo, Comprehensive Heterocyclic Chemistry, Vol. 4-6, A. R. Katritzky y C. W. Rees editors, Pergamon Press, Nueva York, 1984; Comprehensive Heterocyclic Chemistry II, Vol. 2-4, A. R. Katritzky, C. W. Rees, y E. F. Scriven editors, Pergamon Press, Nueva York, 1996; y la serie, The Chemistry of Heterocyclic Compound, E. C. Taylor, editor, Wiley, Nueva York. Se ha descrito el uso de intermediarios de Fórmula 26 para preparar reactivos de organo zinc para su uso en reacciones de acoplamiento cruzado con sistemas anulares aromáticos, véase, por ejemplo, S. Bellotte, Synlett 1998, 379-380, y M. Nakamura et al., Synlett 2005, 1794-1798.

Anexo Explicativo 1

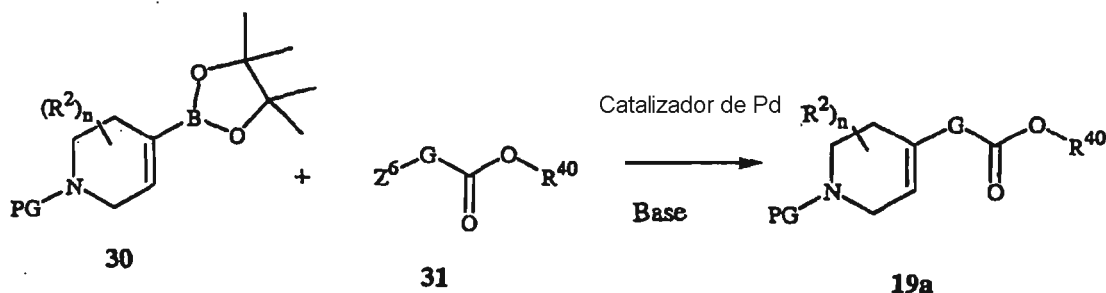


En la misma Z^5 es Br, I, OH, OMs, o OTf; W es O o S; y PG es un grupo protector lábil al ácido tal como t-Boc o Cbz.

Adicionalmente, los compuestos de Fórmula 19a donde G está unido al anillo tetrahidropiridina a través de un átomo de

carbono pueden prepararse haciendo reaccionar los boronatos cíclicos de Fórmula 30 con los compuestos heteroaromáticos de Fórmula 31 donde Z^6 es un halógeno, preferiblemente Br o I, o un grupo triflato tal como se muestra en el Esquema 16. La reacción se lleva a cabo en presencia de una cantidad catalítica de paladio tal como PdCl_2dppf (PdCl₂-1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno) y una base tal como acetato de potasio en un disolvente tal como dioxano a 80 a 100 °C, similar a aquella informada para el acoplamiento de boronatos de Fórmula 30 con haluros de arilo y triflatos por P. R. Easdosod, Tetrahedron Letters 2000, 41, 3705-3708. El uso de paladio en la síntesis de heterociclos es bien conocido; véase, por ejemplo, J. J. Li y G. W. Gribble, "Palladium in Heterocyclic Chemistry", Pergamon Press, Amsterdam, 2000. Existen muchas variaciones de tipo de catalizador, base y condiciones de reacción que pueden utilizarse tal como es conocido para un experto en la técnica. Muchos compuestos de Fórmula 31 donde Y es halógeno son conocidos o pueden prepararse mediante procedimientos conocidos para un experto en la técnica.

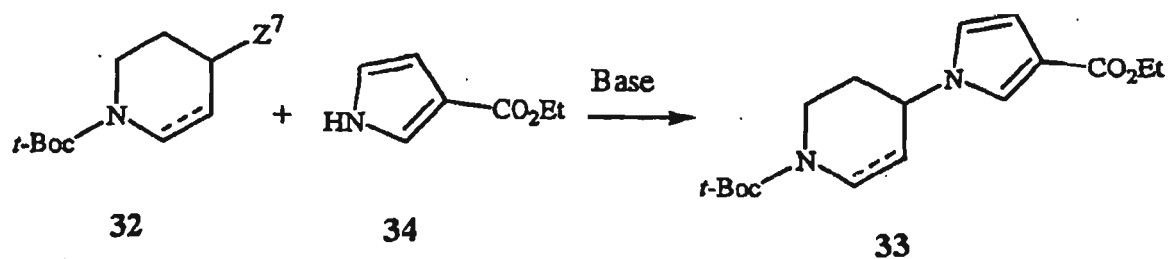
Esquema 16



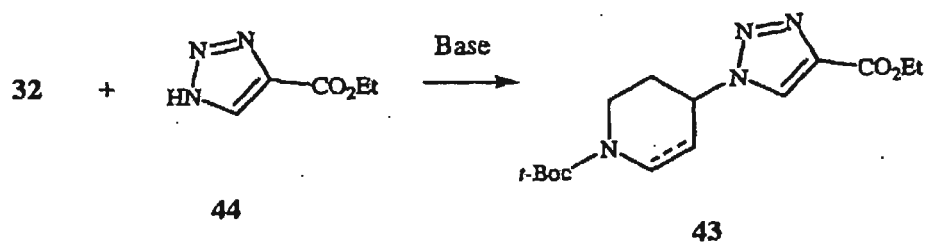
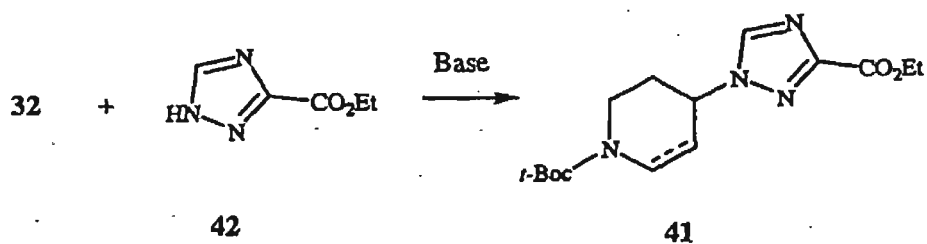
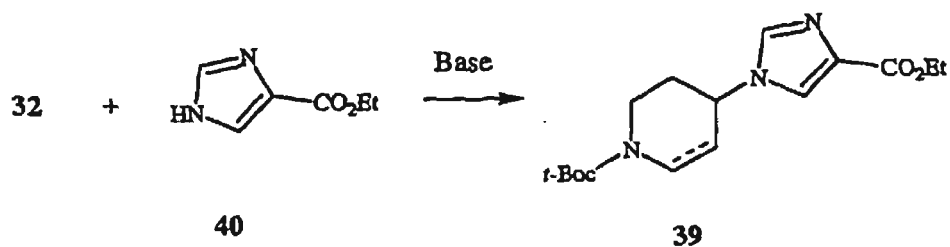
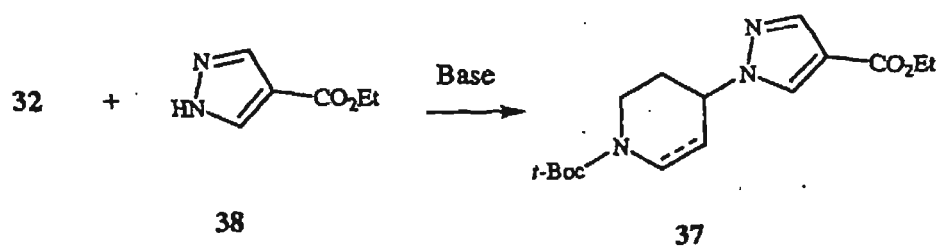
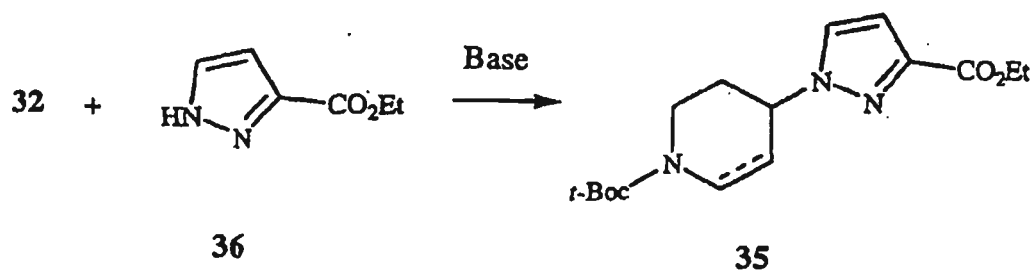
en la que PG es un grupo protector lábil al ácido; Z^6 es Cl, Br, I o OTf; R^{40} es alquilo C₁-C₄.

La preparación de los análogos unidos a N en los que G es G-25 a G-30 puede llevarse a cabo mediante el desplazamiento de un grupo saliente apropiado en el anillo piperidina con el éster heterociclo deseado según lo detallado en el Esquema 17 utilizando los procedimientos que se describen en Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters 2001, 11 (18), 2475-2479; Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters 2002, 12(12), 1683-1686; Tetrahedron 2002, 58(23), 4707-4716 y la Publicación de Solicitud de Patente PCT WO 2004/007499. Alternativamente los análogos unidos a N pueden prepararse a partir de hidroxipiperidinas y el heterociclo apropiado a través de una reacción de Mitsunobu, para ejemplos de reacciones de este tipo véase: J. Med Chem. 2004, 47 (27), 6921-6934. La preparación de los ésteres de heterociclo se describen en las siguientes referencias: Synthesis 1990, 753-754; Synthesis 1995, 1491-1492; J. Het. Chem 1993, 30 (4), 865-872; Tetrahedron 1986, 42 (8), 2351-2358; J. Het. Chem. 1988, 25 (2), 651-654; y Helv. Chem. Acta 1996, 79(2), 449-453.

Esquema 17



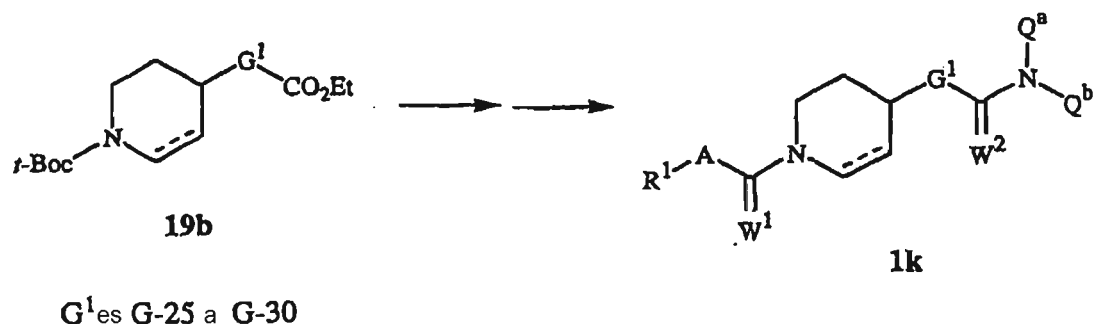
Z^7 es Br, I o OMs



La eliminación del grupo t-BOC del compuesto de Fórmula 19b y saponificación del éster seguido por la formación de

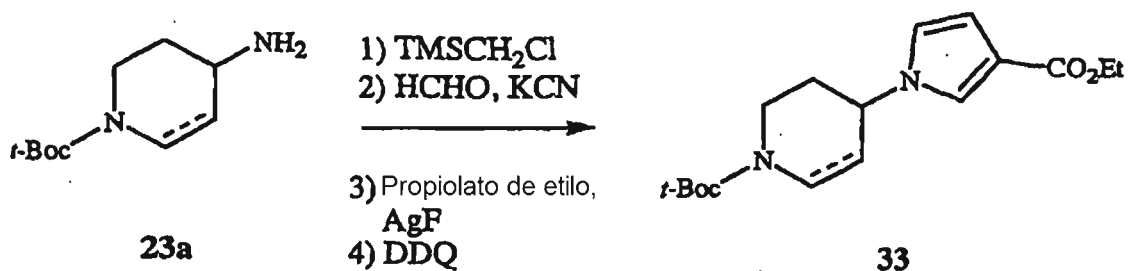
amida con el cloruro de ácido o amina apropiados en condiciones estándar produce el compuesto final de Fórmula 1k tal como se muestra en el Esquema 18.

Esquema 18



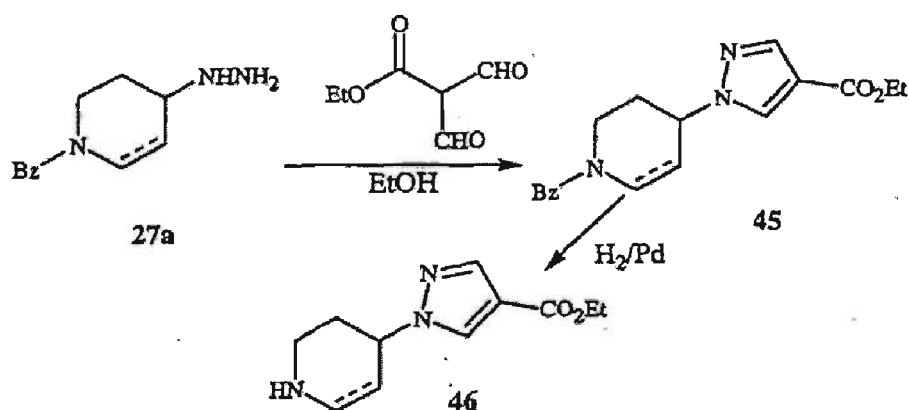
- 5 El compuesto de Fórmula 33 puede obtenerse mediante la vía que se muestra en el Esquema 19 a partir de la amino piperidina de la Fórmula 23a; véase, por ejemplo, Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters 2001, 11 (18), 2475-2479 y J. Org. Chem. 1985, 50(21), 4006-4014.

Esquema 19



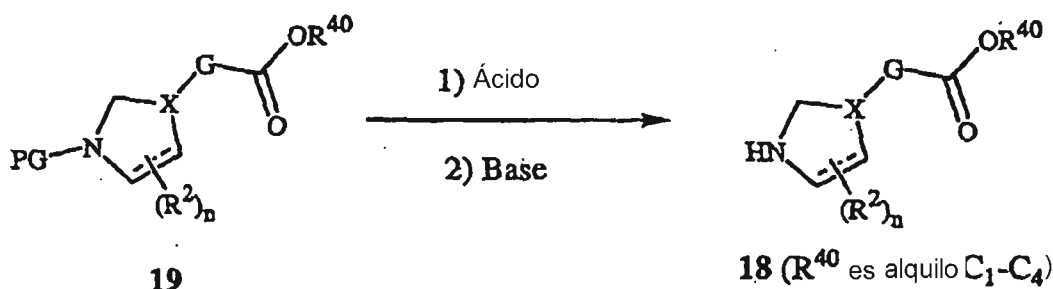
- 10 El compuesto de Fórmula 46 también puede prepararse a partir de la N-bencil hidrazino piperidina de Fórmula 27a tal como se muestra en el Esquema 20; véase, por ejemplo, Bioorganic & Medicinal Chemistry letters 1999, 9(9), 1285-1290 y J. Het. Chem., 1993, 30(4), 865-872.

Esquema 20



con un ácido tal como ácido trifluoroacético o HCl gaseoso en presencia de un disolvente tal como diclorometano o dioxano. La amina puede aislarse como su sal de ácido o convertirse en una etapa posterior en la amina libre mediante el tratamiento con una base, tal como es conocido para un experto en la técnica.

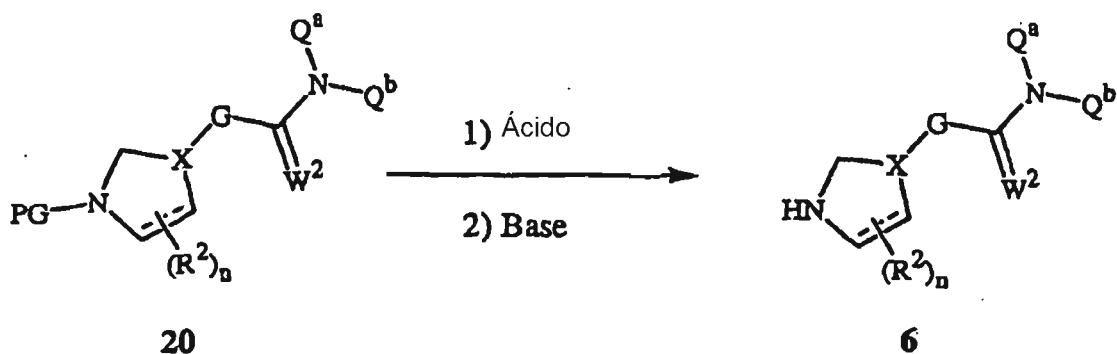
Esquema 13



en la que R^{40} es alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$; PG es un grupo protector lábil al ácido.

Las aminas de Fórmula 6 pueden prepararse a partir de aminas protegidas de Fórmula 20 donde PG es yb grupo protector lábil al ácido tal como un grupo t-butoxicarbonilo (t-Boc) o benciloxicarbonilo (Cbz) tal como está representado en el Esquema 14 mediante procedimientos análogos a aquellos que se describen más arriba para la preparación de los compuestos de Fórmula 18 según lo detallado en el Esquema 13.

Esquema 14



en la que PG es un grupo protector lábil al ácido.

Las aminas protegidas de Fórmula 20 pueden prepararse a partir de compuestos de ácido o cloruro de ácido de Fórmula 21 mediante procedimientos análogos a aquellos que se describen más arriba para la preparación de los compuestos de Fórmula 1 según lo detallado en el Esquema 15. Un experto en la técnica reconocerá que en los Esquemas 1, 2, 8, 9 y 10, el grupo $\text{R}^1\text{AC}(=\text{W}^1)$ puede ser reemplazado en forma análoga por PG donde PG es un grupo protector de amina lábil al ácido estándar tal como un grupo t-butoxicarbonilo (t-Boc) o benciloxicarbonilo (Cbz) para dar intermediarios útiles de Fórmula 20 para la preparación de los compuestos de Fórmula 1. Los compuestos de Fórmula 21 donde R^{41} es OH pueden obtenerse a partir de los compuestos de Fórmula 19 por saponificación, análogos a los procedimientos que se describen para el Esquema 11.

Esquema 15

EJEMPLO 1

Preparación de 2-[1-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1-fenilpropil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 58)

Etapas A: Preparación de 4-[4-(etoxicarbonil)-2-tiazolil]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo

- 5 A una suspensión de 4-(aminotioxometil)-1-tetrahidropiridina-carboxilato de 1,1-dimetiletilo (30 g, 123 mmol) en etanol (180 ml), enfriada hasta 0 °C en un baño de hielo, se añadió en gotas una solución de bromopiruvato de etilo (15,7 ml, 125 mmol) en etanol (180 ml). Se removió el baño de hielo, y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. Se añadió trietilamina (30 ml), y la mezcla se concentró bajo presión reducida, se diluyó con acetato de etilo, se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró bajo presión reducida para dar 31 g de un aceite marrón, que se solidificó en reposo. Una porción de este producto crudo (8,1 g) se calentó con 200 ml de éter, y el éter después se decantó. Esto se repitió una segunda vez, y las soluciones de éter combinadas se evaporaron bajo presión reducida para dar 7,6 g del compuesto del título como un sólido amarillo.

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,40 (t, 3H), 1,46 (s, 9H), 1,7 (m, 2H), 2,1 (m, 2H), 2,85 (m, 2H), 3,25 (m, 1H), 4,2 (m, 2H), 4,42 (q, 2H), 8,08 (s, 1H).

- 15 Etapas B: Preparación de 4-(4-carboxi-2-tiazolil)-1-piperidinacarboxilato de 1-(1,1-dimetiletilo)

- 20 A una solución de 4-[4-(etoxicarbonil)-2-tiazolil]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo (es decir el producto del Ejemplo 1, Etapa A) (3,4 g, 10 mmol) en 20 ml de metanol y 20 ml de tetrahidrofurano se añadió solución acuosa de NaOH 1N (15 ml), y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 1,5 horas. La mezcla de reacción se concentró bajo presión reducida, se diluyó con agua y se acidificó con solución acuosa de ácido cítrico al 20% en exceso para dar un precipitado gomoso. Se añadió acetato de etilo (30 ml) para disolver el precipitado, la capa acuosa se saturó con NaCl, y la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. El extracto se secó sobre MgSO₄ y se concentró bajo presión reducida para dar 3,09 g del compuesto del título como un sólido de color tostado.

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,47 (s, 9H), 1,75 (m, 2H), 2,13 (m, 2H), 2,88 (m, 2H), 3,2 (m, 1H), 4,22 (m, 2H), 8,19 (s, 1H).

- 25 Etapas C: Preparación de (αR)-α-etil-N-metilbencenometanamina (alternativamente denominada (αR)-(α-etil-N-metilbencenometanamina))

- 30 Una solución de (R)-(+)-1-fenilpropilamina (9,19 g, 68,1 mmol) en 90 ml de diclorometano se enfrió hasta -30 °C y se trató con trietilamina (11,4 ml, 81,7 mmol) seguido por la adición en gotas de cloroformato de etilo (7,8 ml, 81,7 mmol). La mezcla de reacción se calentó hasta temperatura ambiente, se agitó durante 1 hora, se vertió en 100 ml de ácido clorhídrico acuoso 1N y se extrajo con diclorometano. El extracto se lavó con solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio, se secó sobre MgSO₄ y se concentró bajo presión reducida para dar 14,2 g de un aceite incoloro. El aceite se disolvió en 15 ml de tetrahidrofurano y se añadió en gotas a una suspensión de hidruro de aluminio y litio (7,82 g, 206 mmol) en 25 ml de tetrahidrofurano que se había enfriado hasta 0 °C. La mezcla de reacción se sometió a reflujo durante toda la noche, se enfrió hasta 0 °C y se desactivó mediante la adición secuencial de 8 ml de agua, 8 ml de solución acuosa de NaOH al 15% y 24 ml de agua. La mezcla se filtró a través de Celite®, auxiliar de filtro diatómico, el sólido resultante se lavó con acetato de etilo caliente, y los filtrados y lavados combinados se concentraron bajo presión reducida para dar 7,06 g del compuesto del título como un aceite amarillo.

¹H RMN (CDCl₃) δ 0,81 (t, 3H), 1,4 (br s, 1H), 1,55-1,85 (m, 2H), 2,28 (s, 3H), 3,37 (m, 1H), 7,2-7,4 (m, 5H).

Etapas D: Preparación de 4-[4-[[metil[(1R)-1-fenilpropil]amino]-carbonil]-2-tiazolil]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo

- 40 4-(4-carboxi-2-tiazolil)-1-piperidinacarboxilato de 1-(1,1-dimetiletilo) (es decir el producto del Ejemplo 1, Etapa B) (3,1 g, 9,9 mmol) se suspendió en 10 ml de acetonitrilo seco y se trató con trietilamina (3,0 ml, 21 mmol) para dar una solución homogénea. A esto se añadió hexafluorofosfato de O-benzotriazol-1-il-N,N,N',N'-tetrametiluronio (3,98 g, 10,5 mmol) seguido por (αR)-α-etil-N-metilbencenometanamina (es decir el producto del Ejemplo 1, Etapa C) (10 mmol, 1,50 g). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 4 días, se concentró bajo presión reducida, se diluyó con acetato de etilo, se lavó con ácido clorhídrico acuoso 1N, solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y salmuera, se secó sobre MgSO₄ y se concentró bajo presión reducida para dar 5,1 g de un aceite oscuro. La purificación por cromatografía en gel de sílice utilizando acetato de etilo al 25% en hexanos dio 3,6 g del compuesto del título como un aceite amarillo.

¹H RMN (CDCl₃) δ 0,9-1,1 (br m, 3H), 1,46 (s, 9H), 1,6-1,8 (m, 2H), 1,9-2,2 (m, 4H), 2,7-3,0 (m, 5H), 3,15 (m, 1H), 4,15 (m, 2H), 5,6-6,0 (m, 1H), 7,25-7,45 (m, 5H), 7,8 (s, 1H).

- 50 Etapas E: Preparación de N-metil-N-[(1R)-1-fenilpropil]-2-(4-piperidinil)-4-tiazolcarboxamida

4-[4-[[metil[(1R)-1-fenilpropil]amino]carbonil]-2-tiazolil]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo (es decir el producto del Ejemplo 1, Etapa D) (3,6 g, 8,1 mmol) se disolvió en 100 ml de éter y se trató con 20 ml de HCl 4N en dioxano. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 4 horas tiempo durante el que se formó el precipitado y se recolectó. Las aguas madres se concentraron bajo presión reducida, se trataron con 20 ml de HCl 4N en dioxano, se agitaron a temperatura ambiente durante 1 hora y se concentraron bajo presión reducida. El residuo se combinó con el precipitado recolectado previamente, se disolvió en agua y se lavó con éter. La capa acuosa se basificó con solución acuosa de NaOH 1N y se extrajo con acetato de etilo. El extracto se secó sobre MgSO₄ y se concentró bajo presión reducida para dar 2,33 g del compuesto del título como un aceite naranja apropiado para su uso en reacciones posteriores.

¹HRMN (CDCl₃) δ 0,9-1,1 (br m, 3H), 1,75 (m, 2H), 1,9-2,2 (m, 5H), 2,7-3,0 (m, 5H), 5,7-6,0 (m, 1H), 7,25-7,45 (m, 5H), 7,8 (s, 1H).

Etapa F: Preparación de 2-[1-[(2,5-dimetilfenil) acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1-fenilpropil]-4-triazomecarboxamida

N-metil-N-[(1R)-1-fenilpropil]-2-(4-piperidinil)-4-tiazolcarboxamida (es decir el producto del Ejemplo 1, Etapa E) (206 mg, 0,6 mmol) se disolvió en 4 ml de diclorometano seco. A esta mezcla de reacción se añadió trietilamina (90 ml, 0,65 mmol), ácido 2,5-dimetilbencenoacético (98 mg, 0,6 mmol), hidrocloreuro de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (125 mg, 0,65 mmol) y una cantidad catalítica de 4-(dimetilamino)piridina (-1 mg). La mezcla se agitó durante toda la noche a temperatura ambiente, se pasó a través de un ChemElute™ de 5 ml de capacidad, tubo de filtro diatómico, se pretrató con 3 ml de solución acuosa de ácido clorhídrico 1N y se eluyó con 2 volúmenes de columna de diclorometano. La solución de diclorometano se concentró bajo presión reducida, y el residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice utilizando acetona para dar 276 mg del producto del título, un compuesto de la presente invención como un aceite amarillo claro.

¹H RMN (CDCl₃) δ 0,9-1,1 (br m, 3H), 1,5-1,9 (m, 2H), 1,9-2,2 (m, 4H), 2,23 (s, 3H), 2,26 (s, 3H), 2,7-3,0 (m, 4H), 3,1-3,3 (m, 2H), 3,65 (s, 2H), 3,8 (br m, 1H), 4,7 (br m, 1H), 5,6-6,0 (m, 1H), 6,9-7,1 (m, 3H) 7,25-7,45 (m, 5H), 7,8 (s, 1H).

EJEMPLO 2

Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1-fenilpropil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 117)

Etapa A: Preparación de ácido 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acético

Una mezcla de 3-metil-5-trifluorometilpirazol (10,0 g, 66,7 mmol), bromoacetato de etilo (11,1 ml, 100 mmol) y carbonato de potasio (18,4 g, 133 mmol) en 80 ml de N,N-dimetilformamida se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. La mezcla naranja se filtró, se diluyó con acetato de etilo, se lavó con agua y salmuera, se secó sobre MgSO₄ y se concentró bajo presión reducida para dar 15,7 g del éster de pirazol. El éster, en 100 ml de tetrahidrofurano, se trató con 11 ml de una solución acuosa de NaOH al 50% en 90 ml de agua y se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. El tetrahidrofurano se eliminó bajo presión reducida y la solución acuosa se lavó con éter y se acidificó con HCl concentrado asta pH 1 para dar un precipitado. El precipitado se filtró, se lavó con agua y se secó para dar 12,1 g del compuesto del título como un sólido blanco.

¹H RMN (Acetona-d₆) δ 2,35 (s, 3H), 5,07 (s, 2H), 6,45 (s, 1H).

Etapa B: Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1-fenilpropil]-4-tiazolcarboxamida

N-metil-N-[(1R)-1-fenilpropil]-2-(4-piperidinil)-4-tiazolcarboxamida (es decir el producto del Ejemplo 1, Etapa B) (150 mg, 0,44 mmol) se disolvió en 3 ml de diclorometano seco. A esta solución se añadió trietilamina (30 ml, 0,22 mmol), ácido 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acético (83 mg, 0,4 mmol), hidrocloreuro de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (84 mg, 0,44 mmol) y una cantidad catalítica de 4-(dimetilamino)piridina (1 mg). La mezcla de reacción se agitó durante toda la noche a temperatura ambiente, se concentró bajo presión reducida y se pasó a través de una columna de gel de sílice (2 g) utilizando 1:1 hexanos/acetato de etilo como eluyente. La solución de diclorometano/hexanos/acetato de etilo se concentró bajo presión reducida, y el residuo se purificó por cromatografía preparativa líquida de alta presión de fase inversa (HPLC) utilizando un gradiente de disolvente que fue de 100 % de agua a 100 % de acetonitrilo para dar 85 mg del producto del título, un compuesto de la presente invención como un aceite.

¹H RMN (CDCl₃) δ 0,9-1,1 (br m, 3H), 1,7-1,9 (m, 2H), 1,9-2,2 (m, 4H), 2,31 (s, 3H), 2,7-3,0 (m, 4H), 3,2-3,4 (m, 2H), 3,9-4,6 (br m, 2H), 4,96 (br s, 2H), 5,6-6,0 (m, 1H), 6,3 (s, 1H) 7,20-7,45 (m, 5H), 7,8 (s, 1H).

EJEMPLO 3

Preparación de 2-[1-[(2,5-diclorofenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1-fenilpropil]-4-tiazotecarboxamida (Compuesto 110)

Etapas A: Preparación de ácido 2,5-diclorobencenoacético

- 5 Una mezcla de bromuro de 2,5-diclorobencilo (5,4 g, 22,5 mmol) en 16 ml de etanol y cianuro de potasio (1,63 g, 25 mmol) en 4 ml de agua se calentó a 80 °C durante toda la noche, después se enfrió, y los sólidos se filtraron y se lavaron con etanol para dar 3,5 g de 2,5-diclorofenilacetronitrilo como un polvo blanco que se fundía a 89-91 °C. El nitrilo se suspendió en 20 ml de etanol, y se añadieron 20 ml de una solución acuosa de NaOH al 25%. La mezcla se calentó en un reactor de microondas CEM Explore™ a 140 °C durante 30 minutos; después se enfrió, se vertió en agua con hielo
- 10 y se acidificó hasta pH 1 con HCl concentrado para dar un precipitado. El precipitado se filtró, se lavó con agua y se secó en un horno al vacío a 90 °C durante 5 horas para dar el compuesto del título como un polvo blanco.

¹H RMN (CDCl₃) δ 3,79 (s, 2H), 7,2-7,4 (m, 3H).

Etapas B: Preparación de 2-[1-[(2,5-diclorofenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1-fenilpropil]-4-tiazolcarboxamida

- 15 N-metil-N-[(1R)-1-fenilpropil]-2-(4-piperidinil)-4-tiazolcarboxamida (es decir el producto del Ejemplo 1, Etapa E) (171 mg, 0,5 mmol) se disolvió en 3 ml de diclorometano seco. A esto se añadió trietilamina (35 ml, 0,25 mmol), ácido 2,5-diclorobencenoacético (102 mg, 0,5 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 3, Etapa A), hidrócloruro de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (100 mg, 0,56 mmol) y una cantidad catalítica de 4-(dimetilamino) piridina (~1 mg). La mezcla se agitó durante toda la noche a temperatura ambiente, se diluyó con diclorometano, se lavó con ácido clorhídrico acuoso 1N, solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y salmuera, se secó sobre MgSO₄ y se
- 20 concentró bajo presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice utilizando acetato de etilo para dar 170 mg del producto del título, un compuesto de la presente invención como un aceite.

¹H RMN (CDCl₃) δ 0,9-1,1 (br m, 3H), 1,65-1,9 (m, 2H), 1,9-2,2 (m, 4H), 2,7-3,0 (m, 4H), 3,25 (m, 2H), 3,8 (s, 2H), 3,9 (br m, 1H), 4,6 (br m, 1H), 5,6-6,0 (m, 1H), 7,15-7,45 (m, 8H), 7,81 (s, 1H).

EJEMPLO 4

- 25 Preparación de 2-[4-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-1-piperazinil]-N-metil-N-[(1R)-1-feniletíl]-5-tiazolcarboxamida (Compuesto 74)

Etapas A: Preparación de 4-[5-(metoxicarbonil)-2-tiazolil]-1-piperazinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo

- 1-piperazinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo (1,86 g, 10 mmol), 2-bromo-5-tiazolacarboxilato de metilo (2,0 g, 9,0 mmol), diazabicycloundeceno (1,5 ml, 10 mmol) y una cantidad catalítica de yoduro de potasio (2 mg) se disolvieron en 10 ml de dimetilsulfóxido seco y se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora para dar un precipitado. Se añadieron 10 ml
- 30 adicionales de dimetilsulfóxido, la mezcla se calentó por poco tiempo para disolver los sólidos, y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 40 minutos y después a 50 °C durante 2 horas. La solución caliente se añadió en gotas con agitación a 200 ml de agua fría que contenía 10 ml de ácido clorhídrico acuoso 1N, y el precipitado resultante se filtró, se disolvió en éter, se secó sobre MgSO₄ y se concentró bajo presión reducida para dar 2,62 g del compuesto del título como un sólido amarillo claro.

- 35 ¹H RMN (CDCl₃) δ 1,48 (s, 9H), 3,56 (s, 8H), 3,83 (s, 3H), 7,88 (s, 1H).

Etapas B: Preparación de 4-(5-carboxi-2-tiazolil)-1-piperazina-carboxilato de 1-(1,1-dimetiletilo)

- 4-[5-(metoxicarbonil)-2-tiazolil]-1-piperazinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo (es decir el producto del Ejemplo 4, Etapa A) (2,56 g, 8 mmol) en 15 ml de metanol y 15 ml de tetrahidrofurano se añadió solución acuosa de NaOH 1N (10 ml), y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. La mezcla se concentró bajo presión reducida, se diluyó con agua, se lavó con éter, y se acidificó con solución acuosa de ácido cítrico al 20% en exceso para dar un precipitado. El precipitado se filtró, se lavó con agua y se secó para dar 2,12 g del compuesto del título como un sólido levemente
- 40 rosa.

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,49 (s, 9H), 3,58 (br s, 8H), 7,97 (s, 1H).

Etapas C: Preparación de 4-[5-[[metil[(1R)-1-feniletíl]amino]-carbonil]-2-tiazolil]-1-piperazinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo

- 45 4-(5-carboxi-2-tiazolil)-1-piperazinacarboxilato de 1-(1,1-dimetiletilo) (es decir el producto del Ejemplo 4, Etapa B) (1,0 g, 3,2 mmol) se suspendió en 10 ml de acetonitrilo seco y se trató con trietilamina, (892 ml, 6,4 mmol) para dar una solución homogénea. A esto se añadió hexafluorofosfato de O-benzotriazol-1-il-N,N,N',N'-tetrametiluronio (1,33 g, 3,5

mmol) seguido por (α R)-N, α -dimetilbencenometanamina (es decir el producto del Ejemplo 1, Etapa C) (200 ml, 1,38 mmol). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 3 días, se concentró bajo presión reducida, se diluyó con acetato de etilo, se lavó con ácido clorhídrico acuoso 1N, solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró bajo presión reducida para dar 1,38 g de una espuma naranja. La purificación por cromatografía en gel de sílice utilizando un gradiente de acetato de etilo/hexanos de 1:9 a 100:0 dio 0,78 g del compuesto del título como un sólido amarillo.

$^1\text{H RMN}$ (CDCl_3) δ 1,48 (s, 9H), 1,6 (m, 3H), 2,88 (s, 3H), 3,54 (br m, 8H), 5,9 (m, 1H), 7,25-7,45 (m, 5H), 7,47 (s, 1H).

Etapa D: Preparación de N-metil-N-[(1R)-1-feniletil]-2-(1-piperazinil)-5-tiazol-carboxamida

4-[5-[[metil[(1R)-1-feniletil]amino]carbonil]-2-tiazolil]-1-piperazinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo (es decir, el producto del Ejemplo 4, Etapa C) (0,75 g, 1,7 mmol) en 10 ml de metanol y 10 ml de diclorometano se trató con 15 ml de 1 N HCl en éter. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche, se concentró bajo presión reducida, se disolvió en agua y salmuera, se basificó con solución acuosa de NaOH 1N y se extrajo con diclorometano. El extracto se secó sobre MgSO_4 y se concentró bajo presión reducida para dar 0,48 g del compuesto del título como un aceite amarillo.

$^1\text{H RMN}$ (CDCl_3) δ 1,6 (d, 3H), 2,87 (s, 3H), 2,98 (m, 4H), 3,52 (m, 4H), 5,9 (m, 1H), 7,25-7,45 (m, 5H), 7,47 (s, 1H).

Etapa E: Preparación de 2-[4-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-1-piperazinil]-N-metil-N-[(1R)-1-feniletil]-5-tiazolcarboxamida

Se trató ácido 2,5-dimetilfenilacético (1,64 g, 10 mmol) en 40 ml de diclorometano seco con cloruro de oxalilo (1,0 ml, 11 mmol) y una cantidad catalítica de N,N-dimetilformamida (1 gota) y se permitió que se agite a temperatura ambiente durante toda la noche. La mezcla de reacción se concentró bajo presión reducida para dar cloruro de 2,5-dimetilfenilacetilo como un aceite. El cloruro ácido (97 ml, 0,6 mmol) se añadió a una mezcla de N-metil-N-[(1R)-1-feniletil]-2-(1-piperazinil)-5-tiazolcarboxamida (es decir el producto del Ejemplo 4, Etapa D) (165 mg, 0,5 mmol) y 4-(dimetilamino)piridina unida al polímero (PS-DMAP, 1,4 meq (miliequivalentes)/g, 1,0 g) en 15 ml de diclorometano, que después se agitó durante 3 horas, se filtró y se concentró bajo presión reducida para dar 140 mg del producto del título, un compuesto de la presente invención como un sólido amarillo.

$^1\text{H RMN}$ (CDCl_3) δ 1,6 (br d, 3H), 2,24 (s, 3H), 2,28 (s, 3H), 2,87 (s, 3H), 3,42 (m, 2H), 3,55 (m, 4H), 3,69 (s, 2H), 3,82 (m, 2H), 5,9 (m, 1H), 6,9-7,1 (m, 3H) 7,25-7,45 (m, 5H), 7,46 (s, 1H).

EJEMPLO 5

Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1-feniletil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 70)

Etapa A: Preparación de 4-[4-[[metil[(1R)-1-feniletil]amino]-carbonil]-2-tiazolil]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo

4-(4-carboxi-2-tiazolil)-1-piperidinacarboxilato de 1-(1,1-dimetiletilo) (es decir el producto del Ejemplo 1, Etapa B) (6,86 g, 21,96 mmol) se suspendió en 30 ml de acetonitrilo seco y se trató con trietilamina (6,12 ml, 43,92 mmol) para dar una solución homogénea. A esto se añadió hexafluorofosfato de O-benzotriazol-1-il-N,N,N',N'-tetrametiluronio (9,16 g, 24,16 mmol) seguido por (α R)-N, α -dimetilbencenometanamina (3,19 ml, 21,96 mmol). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 3 días, se concentró bajo presión reducida, se diluyó con acetato de etilo, se lavó con ácido clorhídrico acuoso 1N, solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró bajo presión reducida para dar un aceite oscuro. La purificación por cromatografía en gel de sílice utilizando 25-100 % acetato de etilo en hexanos como eluyente dio 9,12 g del compuesto del título como un aceite

$^1\text{H RMN}$ (CDCl_3) δ 1,46 (s, 9H), 1,6-1,8 (m, 5H), 2,0-2,2 (m, 2H), 2,7-3,0 (m, 5H), 3,15 (m, 1H), 4,15 (m, 2H), 5,7-6,2 (m, 1H), 7,25-7,45 (m, 5H), 7,81 (s, 1H).

Etapa B: Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1-feniletil]-4-tiazolcarboxamida

Una solución de 400 mg (0,77 mmol) de 4-[4-[[metil[(1R)-1-feniletil]amino]carbonil]-2-tiazolil]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo (es decir el producto del Ejemplo 5, Etapa A) en 10 ml de una mezcla 1: 1 de metanol y diclorometano se trató con 10 ml de ácido clorhídrico 2N en éter y se agitó a temperatura ambiente durante 4 horas. La mezcla de reacción se concentró en evaporador rotatorio, y el residuo se trató tres veces con 10 ml de metanol seguido por concentración para dejar el hidrocloreto de piperidina crudo. La mezcla de reacción después se disolvió en 10 ml de acetonitrilo, y se añadió 1,0 ml de trietilamina. Mientras tanto, una solución de 310 mg (1,49 mmol) de ácido 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acético en 10 ml de acetonitrilo se trató con 1,0 ml de una solución de anhídrido cíclico de ácido 1-propanofosfónico (50 % en acetato de etilo), se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos, después se combinó

con la solución de amina anterior. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche, se diluyó con 50 ml de acetato de etilo, se lavó con ácido clorhídrico acuoso 1N, hidróxido de sodio acuoso 1N y salmuera, se secó con MgSO_4 , se filtró y se concentró bajo presión reducida. La purificación por cromatografía líquida de presión media (MPLC) sobre gel de sílice utilizando acetato de etilo/metanol como eluyente proporcionó 330 mg del producto del título, un compuesto de la presente invención como un sólido blanco.

^1H RMN (CDCl_3) δ 1,60-1,80 (m, 5 H), 2,18 (m, 2 H), 2,30 (s, 3H), 2,80 (m, 5 H), 3,27 (m, 2 H), 4,00 (m, 1H), 4,95 (s, 2 H), 5,79 y 6,14 (m, total 1H), 6,35 (s, 1H), 7,37 (m, 5H), 7,84 (s, 1H).

EJEMPLO 6

Preparación general de 2-[1-[(fenil sustituido)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 144, Compuesto 145, Compuesto 146, Compuesto 147, Compuesto 148 y Compuesto 132) y N-metil-2-[1-[(sustituido-1H-pirazol-1-il)acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 149 y Compuesto 150)

EtapA: Preparación de (1R)-1,2,3,4-tetrahydro-N-metil-1-naftalenamina

(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenamina (5,0 g, 34 mmol) se calentó en 15 ml de formato de etilo a 60 °C durante toda la noche, tiempo en el que se formó un precipitado. La mezcla de reacción se añadió a 100 ml de hexanos con agitación, y los sólidos resultantes se filtraron, se lavaron con hexanos y se secaron para dar 4,63 g de formamida como agujas blancas. La formamida resultante (4,54 g, 26 mmol) se disolvió en 50 ml de tetrahydrofurano y se añadió en gotas a una suspensión de hidruro de aluminio y litio (1,1 g, 29 mmol) en 20 ml de tetrahydrofurano que se había enfriado hasta 0 °C. La mezcla de reacción se sometió a reflujo durante toda la noche, después se enfrió hasta 0 °C y se desactivó mediante la adición secuencial de 1,1 ml de agua, 1,1 ml de solución acuosa de NaOH al 15% y 3,3 ml de agua. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos y se diluyó con acetato de etilo, se añadieron varios gramos de MgSO_4 , y la mezcla se filtró a través de Celite® auxiliar de filtro diatomáceo y se concentró bajo presión reducida para dar 4,0 g del compuesto del título como un aceite incoloro.

^1H RMN (CDCl_3) δ 1,17 (s, 1H), 1,65-2,0 (m, 4H), 2,47 (s, 3H), 2,65-2,85 (m, 2H), 3,63 (m, 1H), 7,0-7,35 (m, 4H).

EtapA: Preparación de 4-[4-[(metil[(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil]amino]carbonil]-2-tiazolil]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo

Una mezcla de 4-[4-carboxi-2-tiazolil]-1-piperidinacarboxilato de 1-(1,1-dimetiletilo) (es decir el producto del Ejemplo 1, EtapA) (3,84 g, 12,29 mmol), hidrocloreto de 1-[3-(dimetilamino)propil]-3-etilcarbodiimida (2,36 g, 12,29 mmol) y trietilamina (2,3 ml, 16,76 mmol) en 50 ml de diclorometano se agitó durante 15 minutos a temperatura ambiente. Se añadió (1R)-1,2,3,4-tetrahydro-N-metil-1-naftalenamina (es decir el producto del Ejemplo 6, EtapA) (2,18 g, 13,5 mmol) y la mezcla de reacción se agitó durante 16 horas. La mezcla de reacción se diluyó con 20 ml de diclorometano, se lavó con ácido clorhídrico acuoso 1N, agua, solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio, agua y salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró bajo presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice utilizando 20 % a 100 % de acetato de etilo en hexanos para dar 2,4 g del compuesto del título como un aceite.

^1H RMN (CDCl_3) δ 1,46-1,48 (s, 9H), 1,62-2,35 (m, 9H), 2,7-2,93 (m, 6H), 3,08-3,10 (m, 1H), 4,06-4,10 (m, 2H), 5,68-6,04 (m, 1H), 7,1-7,2 (m, 4H), 7,82-7,83 (m, 1H).

EtapA: Preparación de monohidrocloreto de N-metil-2-(4-piperidinil)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida

4-[4-[(metil[(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil]amino]-carbonil]-2-tiazolil]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo (es decir el producto del Ejemplo 6, EtapA) (2,4 g, 5,26 mmol) se disolvió en 20 ml de una mezcla de diclorometano y metanol (1: 1), y se añadieron 13,15 ml (52,6 mmol) de HCl 1N en dioxano. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas y después se concentró bajo presión reducida. El residuo se disolvió en 20 ml de metanol y se concentró bajo presión reducida (este procedimiento se repitió 3 veces) dando como resultado 1,7 g del compuesto del título como un sólido.

^1H RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ 1,80-2,05 (m, 3H), 2,1-2,3 (m, 2H), 2,5-2,9 (m, 8H), 2,92-3,12 (m, 2H), 3,25-3,42 (m, 3H), 4,55-4,63 (m, 2H), 5,3-5,8 (m, 1H), 7,0-7,2 (m, 4H), 8,1-8,14 (m, 1H), 8,72-8,88 (m, 1H), 9,0-9,1 (m, 1H).

EtapA: Preparación general de 2-[1-[(sustituido-fenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida y N-metil-2-[1-[(sustituido-1H-pirazol-1-il)acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida

- Una mezcla de de monohidrocloreto de N-metil-2-(4-piperidinil)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (es decir el producto del Ejemplo 6, Etapa C) (157 mg, 0,4 mmol), el ácido acético de heteroarilo o arilo apropiado (0,44 mmol), hidrocloreto de 1-[3-(dimetilamino)propil]-3-etilcarbodiimida (92 mg, 0,48 mmol), trietilamina (100 ml) y una cantidad catalítica de 4-(dimetilamino)piridina (~1 mg) en 3 ml de diclorometano se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. La mezcla de reacción se diluyó con 10 ml de diclorometano, se lavó con ácido clorhídrico acuoso 1N, agua y salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró bajo presión reducida. Los productos se purificaron por cromatografía en gel de sílice utilizando acetato de etilo o una mezcla de acetato de etilo con metanol al 20% como eluyente para dar los siguientes productos del título, compuestos de la presente invención como aceites.
- 10 2-[1-[(2,5-diclorofenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 144); ^1H RMN (CDCl_3) δ 1,7-2,24 (m, 8H), 2,7-3,0 (m, 6H), 3,2-3,3 (m, 2H), 3,8-4,0 (m, 3H), 4,5-4,7 (m, 1H), 5,62-6,05 (m, 1H), 7,05-7,3 (m, 7H), 7,85 (d, 1H).
- 15 2-[1-[(2-metoxifenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 145); ^1H RMN (CDCl_3) δ 1,5-2,24 (m, 8H), 2,7-2,9 (m, 5H), 3,05-3,1 (m, 2H), 3,62-4,01 (m, 7H), 4,58-4,65 (m, 1H), 5,62-6,05 (m, 1H), 6,82-7,27 (m, 8H), 7,82 (d, 1H).
- 20 2-[1-[(2-metoxi-5-metilfenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 146); ^1H RMN (CDCl_3) δ 1,5-2,2 (m, 11H), 2,7-2,9 (m, 6H), 3,05-3,22 (m, 2H), 3,6-4,0 (m, 6H), 4,57-4,72 (m, 1H), 5,6-6,04 (m, 1H), 6,76-7,22 (m, 7H), 7,82 (d, 1H).
- 20 2-[1-[(2-cloro-5-(trifluorometil)fenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 147); ^1H RMN (CDCl_3) δ 1,6-2,0 (m, 5H), 2,1-2,2 (m, 3H), 2,7-3,0 (m, 6H), 3,22-3,35 (m, 2H), 3,85-4,0 (m, 3H), 4,5-4,7 (m, 1H), 5,6-6,05 (m, 1H), 7,05-7,6 (m, 7H), 7,83 (d, 1H).
- 25 2-[1-[(5-bromo-2-metoxifenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 148); ^1H RMN (CDCl_3) δ 1,6-2,25 (m, 9H), 2,7-2,9 (m, 5H), 3,15-3,28 (m, 2H), 3,6-3,7 (m, 2H), 3,8 (m, 3H), 3,9-4,0 (m, 1H), 4,5-4,7 (m, 1H), 5,62-6,07 (m, 1H), 6,7-6,72 (m, 1H), 7,1-7,35 (m, 6H), 7,82 (d, 1H).
- 25 N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 149); ^1H RMN (CDCl_3) δ 1,6-2,1 (m, 5H), 2,1-2,3 (m, 3H), 2,32 (m, 3H), 2,7-3,0 (m, 6H), 3,2-3,35 (m, 2H), 3,95-4,1 (m, 1H), 4,35-4,6 (m, 1H), 4,96-5,02 (m, 2H), 5,6-6,1 (m, 1H), 6,32 (s, 1H), 7,05-7,25 (m, 4H), 7,85 (m, 1H).
- 30 2-[1-[(3,5-dimetil-1H-pirazol-1-il)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 150); ^1H RMN (CDCl_3) δ 1,7-2,2 (m, 14H), 2,7-2,9 (m, 5H), 3,2-3,3 (m, 2H), 3,95-4,6 (m, 3H), 5,05 (m, 2H), 5,85 (s, 1H), 5,65-6,05 (m, 1H), 7,12-7,3 (m, 4H), 7,85 (m, 1H).
- 35 2-[1-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 132); ^1H RMN (CDCl_3) δ 1,6-2,3 (m, 8H), 2,7-2,9 (m, 7H), 3,1-3,3 (m, 2H), 3,63-3,65 (m, 2H), 3,8-3,9 (m, 1H), 4,4,55-4,77 (m, 1H), 5,62-6,07 (m, 1H), 6,92-7,22 (m, 7H), 7,82-7,85 (m, 1H).
- 35 EJEMPLO 7
- Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-piranol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1-fenilpropil]-4-oxazolcarboxamida (Compuesto 152)
- Etapa A: Preparación de 4-[[[1-(hidroximetil)-2-metoxi-2-oxoetil]amino]carbonil]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo
- 40 Una mezcla de 1,4-piperidinacarboxilato hidrógeno de 1-(1,1-dimetiletilo) (5,5 g, 24 mmol), hidrocloreto de 1-[3-(dimetilamino)propil]-3-etilcarbodiimida (5,08 g, 26,5 mmol), y N-metilmorfolina (2,75 ml, 25 mmol) en 100 ml de diclorometano se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos. Se añadió hidrocloreto de éster de metilo DL-Serina (3,89 g, 25 mmol), y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. La mezcla de reacción se dividió entre ácido clorhídrico acuoso 1N y diclorometano, y la capa orgánica se lavó con ácido clorhídrico acuoso 1N, agua y salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró bajo presión reducida para dar 6,58 g del compuesto del título.
- 45 ^1H RMN (CDCl_3) 81,45 (s, 9H), 1,62-1,75 (m, 3H), 1,9 (m, 2H), 2,38 (t, 1H), 2,7-2,8 (m, 3H), 3,8 (s, 3H), 3,9-4,0 (m, 2H), 4,08 (br s, 2H), 4,68 (m, 1H), 6,5 (m, 1H).
- Etapa B: Preparación de 4-[4,5-dihidro-4-(metoxicarbonil)-2-oxazolil]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo
- A una solución de 4-[[[1-(hidroximetil)-2-metoxi-2-oxoetil]amino]carbonil]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo (es decir el producto del Ejemplo 7, Etapa A) (6,58 g, 19,92 mmol) en 70 ml de acetonitrilo seco y 20 ml de diclorometano

seco se añadió trifenilfosfina (7,8 g, 29,87 mmol) y después 4,12 g (31,87 mmol) de N,N-diisopropiletilamina. La mezcla de reacción se agitó hasta que fuera homogénea, y se añadieron en gotas 4,59 g (29,87 mmol) de tetracloruro de carbono durante 5 minutos. La mezcla de reacción se agitó durante 2,5 horas a temperatura ambiente, se enfrió hasta 0 °C y se diluyó con 170 ml de acetato de etilo seguido por 50 ml de solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio. La mezcla se agitó durante 10 minutos, se vertió en 120 ml de agua, y la capa orgánica se separó, se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO₄ y se concentró bajo presión reducida para dar un aceite amarillo. El aceite se purificó por cromatografía en gel de sílice utilizando 75-100 % de acetato de etilo en hexanos como eluyente para dar 2,95 g del compuesto del título como un aceite que contenía trazas de trifenilfosfina.

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,43 (s, 9H), 1,6-176 (m, 2H), 1,86-1,91 (m, 2H), 2,47-2,55 (m, 1H), 2,80-2,86 (m, 2H), 3,8 (s, 3H), 4,02 (br s, 2H), 4,38-4,50 (m, 2H), 4,71-4,75 (m, 1H).

Etapas C: Preparación de 4-[4-(metoxicarbonil)-2-oxazolil]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo

A una solución de 4-[4,5-dihidro-4-(metoxicarbonil)-2-oxazolil]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo (es decir el producto del Ejemplo 7, Etapa B) (2,89 g, 9,26 mmol) en 100 ml de diclorometano a 0 °C se añadieron 1,52 ml (10,18 mmol) de 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno (DBU), y la mezcla de reacción se agitó durante 10 minutos a 0 °C. Se añadió en gotas bromotriclorometano (1 ml, 10,18 mmol) durante 7 minutos, y la mezcla de reacción se agitó durante 6 horas a 0 °C. La mezcla se lavó con cloruro de amonio acuoso saturado (2 x 50 ml, la fase acuosa se extrajo con acetato de etilo (2 x 25 ml), y las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron bajo presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice utilizando 25-75 % de acetato de etilo en hexanos como eluyente para dar 1,41 g del compuesto del título como cristales blancos.

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,46 (s, 9H), 1,77-1,85 (m, 2H), 2,00-2,05 (m, 2H), 2,85-2,92 (m, 2H), 2,99-3,02 (m, 1H), 3,9 (s, 3H), 4,08-4,15 (m, 2H), 8,18 (s, 1H).

Etapas D: Preparación de 4-(4-carboxi-2-oxazolil)-1-piperidina-carboxilato de 1-(1,1-dimetiletilo)

Se disolvió 4-[4-(metoxicarbonil)-2-oxazolil]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo (es decir el producto del Ejemplo 7, Etapa C) (1,41 g, 4,55 mmol) en 12 ml de tetrahidrofurano, y se añadieron 8 ml de agua. La mezcla de reacción se enfrió hasta 0 °C con agitación enérgica. Se añadió en gotas una solución acuosa de hidróxido de sodio 1N (9,1 ml), y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla se diluyó con solución saturada de cloruro de sodio (10 ml), se añadieron 30 ml de éter dietílico y la fase acuosa se acidificó hasta pH 3-4 mediante la adición en gotas de solución de ácido cítrico al 20%. El sólido precipitado se filtró y se secó para dar 1,21 g del compuesto del título.

¹H RMN (DMSO-d₆) δ 1,4 (s, 9H), 1,55-1,60 (m, 2H), 1,92-2,00 (m, 2H), 2,90-2,99 (m, 2H), 3,00-3,1 (m, 1H), 3,9-4,0 (m, 2H), 8,45 (s, 1H).

Etapas E: Preparación de 4-[4-[[metil[(1R)-1-fenilpropil]amino]-carbonil]-2-oxazolil]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo

Una mezcla de 4-(4-carboxi-2-oxazolil)-1-piperidinacarboxilato de 1-(1,1-dimetiletilo) (es decir el producto del Ejemplo 7, Etapa D) (600 mg, 2,02 mmol), hidrócloruro de 1-[3-(dimetilamino)propil]-3-etilcarbodiimida (425 mg, 2,22 mmol) y N-metilmorfolina (224 mg, 2,22 mmol) en 4 ml de diclorometano se agitó durante 15 minutos a temperatura ambiente. A la mezcla de reacción se añadieron 392,5 mg (2,63 mmol) de (αR)-α-etil-N-metilbencenometanamina y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. La mezcla de reacción se vertió en 4 ml de ácido clorhídrico acuoso 1N, y la capa orgánica se lavó con ácido clorhídrico acuoso 1N, agua y salmuera, se secó (MgSO₄) y se concentró bajo presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice utilizando 25-75 % de acetato de etilo en hexanos como eluyente para dar 209 mg del compuesto del título como un aceite.

¹H RMN (CDCl₃) δ 0,95-1,02 (m, 3H), 1,42 (s, 9H), 1,72-1,86 (m, 2H), 1,90-2,11 (m, 4H), 2,9-3,0 (m, 4H), 4,0-4,1 (m, 2H), 5,9-6,2 (m, 1H), 7,2-7,4 (m, 5H), 8,1 (s, 1H).

Etapas F: Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1-fenilpropil]-4-oxazolcarboxamida

4-[4-[[metil[(1R)-1-fenilpropil]amino]carbonil]-2-oxazolil]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo (es decir el producto del Ejemplo 7, Etapa E) (209 mg, 0,49 mmol) se disolvió en 3 ml de una mezcla de diclorometano y metanol (1:1), y se añadieron 1,23 ml (4,9 mmol) de HCl 1N en dioxano. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas. Los disolventes se evaporaron bajo presión reducida, y el residuo se disolvió en 5 ml de metanol y se concentró bajo presión reducida (este procedimiento se repitió 3 veces) para dar el hidrócloruro de amina. A una solución de ácido 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acético (89,5 mg, 0,43 mmol) y trietilamina (87 mg, 0,86 mmol) en 2 ml de

acetonitrilo seco se añadió una suspensión de hexafluorofosfato de O-benzotriazol-1-il-N,N',N'-tetrametiluronio (178,25 mg, 0,47 mmol) en 2 ml de acetonitrilo y después una mezcla de 140 mg (0,43 mmol) del hidrocloreto de amina en 2 ml de acetonitrilo. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas y se concentró bajo presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice utilizando 25-75 % de acetato de etilo en hexanos para dar 84 mg del producto del título, un compuesto de la presente invención como un aceite.

^1H RMN (CDCl_3) δ 0,90-1,04 (m, 3H), 1,71-1,89 (m, 2H), 1,90-2,19 (m, 4H), 2,28-2,35 (m, 3H), 2,72 (s, 2H), 3,00-3,2 (m, 3H), 3,30-3,36 (t, 1H), 3,87-4,35 (m, 2H), 4,98 (s, 2H), 5,92-6,12 (m, 1H), 6,3 (s, 1H), 7,25-7,4 (m, 5H), 8,08-8,15 (br s, 1H).

EJEMPLO 8

Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-oxazolcarboxamida (Compuesto 151)

Etapas A: Preparación de 4-[4-[[metil[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]amino]carbonil]-2-oxazolil]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo

Una mezcla de 1-(1,1-dimetiletil) 4-(4-carboxi-2-oxazolil)-1-piperidinacarboxilato (600 mg, 2,02 mmol), hidrocloreto de 1-[3-(dimetilamino)propil]-3-etilcarbodiimida (425,57 mg, 2,22 mmol) y N-metilmorfolina (224,55 mg, 2,22 mmol) en 4 ml de diclorometano se agitó durante 15 minutos a temperatura ambiente. A la mezcla de reacción se añadió 424 mg (2,63 mmol) de (1R)-1,2,3,4-tetrahidro-N-metil-1-naftalenamina y la mezcla de reacción se agitó durante 16 horas. La mezcla de reacción se concentró bajo presión reducida, y el residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice utilizando 25-75 % de acetato de etilo en hexanos como eluyente para dar 360 mg del compuesto del título como un aceite.

^1H RMN (CDCl_3) δ 1,42 (s, 9H), 1,68-2,26 (m, 9H), 2,72-3,01 (m, 7H), 4,0-4,1 (m, 2H), 6,0-6,1 (m, 1H), 7,10-7,18 (m, 4H), 8,12-8,14 (m, 1H).

Etapas B: Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-oxazolcarboxamida

4-[4-[[metil[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]amino]carbonil]-2-oxazolil]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo (es decir el producto del Ejemplo 8, Etapa A) (317 mg, 0,72 mmol) se disolvió en 3 ml de una mezcla de diclorometano y metanol (1:1), y se añadieron 1,8 ml (7,2 mmol) de HCl 1N en dioxano. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas. Los disolventes se evaporaron bajo presión reducida, y el residuo se disolvió en 5 ml de metanol y se evaporó (esta secuencia se repitió 3 veces) dando el hidrocloreto de amina. Una mezcla de ácido 5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-ilacético (179 mg, 0,86 mmol), hidrocloreto de 1-[3-(dimetilamino)propil]-3-etilcarbodiimida (191,7 mg, 1,00 mmol), y 1-metilmorfolina (354 mg, 3,5 mmol) en 3 ml de diclorometano seco se agitó 15 minutos a temperatura ambiente, y se añadió una solución de hidrocloreto de amina en 2 ml de diclorometano seco. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas y se concentró bajo presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice utilizando 75 % acetato de etilo en hexanos como eluyente para dar 79 mg del producto del título, un compuesto de la presente invención como un aceite.

^1H RMN (CDCl_3) δ 1,70-2,00 (m, 5H), 2,01-2,32 (m, 6H), 2,72-3,2 (m, 7H), 3,28-3,40 (m, 1H), 3,85-4,4 (m, 2H), 4,96-5,00 (m, 2H), 5,97-6,1 (m, 1H), 6,29-6,31 (m, 1H), 7,1-7,2 (m, 4H), 8,13-8,18 (m, 1H).

EJEMPLO 9

Preparación de 2-[1-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-oxazolcarboxamida (Compuesto 153)

Etapas A: Preparación de 1-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-4-piperidina-carboxilato de metilo

Una solución de 2,86 g (20 mmol) de isonipecotato de metilo y 2,53 g (2,5 mmol) de trietilamina en 10 ml de diclorometano seco se enfrió hasta 0 °C, y se añadió en gotas una solución de 4,02 g (22 mmol) de cloruro de 2,5-dimetilfenilacetil en 5 ml de diclorometano. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas y después se vertió en 20 ml de agua. La capa orgánica se lavó con agua y salmuera, se secó (MgSO_4) y se concentró bajo presión reducida. El residuo se cristalizó a partir de una mezcla de acetato de etilo y hexano para dar 4,95 g (87,5 % de rendimiento) del compuesto como cristales blancos.

^1H RMN (CDCl_3) δ 1,5-1,7 (m, 2H), 1,78-1,98 (m, 2H), 2,22 (s, 3H), 2,28 (s, 3H), 2,50-2,58 (m, 1H), 2,85-3,10 (m, 2H), 3,65 (s, 2H), 3,70 (s, 3H), 3,71-3,98 (m, 1H), 4,45-4,52 (m, 1H), 6,90-7,08 (m, 3H).

Etapa B: Preparación de ácido 1-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-4-piperidinacarboxilílico

1-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-4-piperidinacarboxilato de metilo (es decir el producto del Ejemplo 9, Etapa A) (4,95 g, 17,1 mmol) se disolvió en 20 ml de tetrahidrofurano, y se añadieron 15 ml de agua. Con agitación enérgica la mezcla de reacción se enfrió hasta 0 °C, y se añadieron en gotas 5 ml de una solución acuosa de hidróxido de sodio 1N. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora, se diluyó con 20 ml de salmuera, se lavó con éter dietílico (3 x 20 ml), y la fase acuosa se acidificó con ácido clorhídrico acuoso 1N hasta pH 3-4. El precipitado se recolectó y se secó para dar 4,08 g del compuesto del título.

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,2 (m, 2H), 1,8 (m, 2H), 2,16 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,5 (m, 1H), 2,75 (m, 1H), 3,1 (m, 1H), 3,62 (m, 2H), 3,8 (m, 1H), 4,25 (m, 1H), 6,8-7,1 (m, 3H), 12,1 (s, 1H).

Etapa C: Preparación de éster de metilo N-[[1-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-4-piperidinil]carbonil]-DL-serina

Una mezcla de ácido 1-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-4-piperidinacarboxilílico (es decir el producto del Ejemplo 9, Etapa B) (1,44 g, 5,23 mmol), hidrocloreto de 1-[3-(dimetilamino)propil]-3-etilcarbodiimida (1,1g, 5,75 mmol), y N-metilmorfolina (529 mg, 5,23 mmol) en 5 ml de diclorometano se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos. Se añadió hidrocloreto de éster de metil DL-Serina (814 mg, 5,23 mmol) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. La reacción se dividió entre ácido clorhídrico acuoso 1N (10 ml) y diclorometano (10 ml), y la capa orgánica se lavó con ácido clorhídrico acuoso 1N, agua y salmuera, se secó sobre MgSO₄ y se concentró bajo presión reducida para dar 1,61 g del compuesto del título.

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,6-1,92 (m, 4H), 2,12 (s, 3H), 2,26 (s, 3H), 2,38-2,45 (m, 1H), 2,7-2,8 (m, 2H), 3,0-3,3 (m, 2H), 3,63 (s, 2H), 3,72 (s, 2H), 3,8-4,0 (m, 2H), 4,55-4,62 (m, 2H), 6,62-6,70 (m, 1H), 6,90-7,05 (m, 3H).

Etapa D: Preparación de 2-[1-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-4-piperidinil]-4,5-dihidro-4-oxazolcarboxilato de metilo

A una solución de éster de metil N-[[1-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-4-piperidinil]carbonil]-DL-serina (es decir el producto del Ejemplo 9, Etapa C) (2,59 g, 6,88 mmol) en 25 ml de acetonitrilo seco y 7 ml de diclorometano seco se añadió trifenilfosfina (2,71 g, 10,32 mmol) y después N,N-diisopropiletilamina (1,6 g, 12,38 mmol). La mezcla de reacción se agitó hasta que fuera homogénea, y se añadió en gotas tetracloreto de carbono (1,59 g, 10,32 mmol) durante 5 minutos. La mezcla de reacción se agitó durante 2,5 horas a temperatura ambiente, se enfrió hasta 0 °C y se diluyó con 50 ml de acetato de etilo seguido por 15 ml de solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio. La mezcla se agitó durante 10 minutos, se vertió en 40 ml de agua, y la capa orgánica se separó, se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO₄ y se concentró bajo presión reducida para dar 6 g de un aceite amarillo. El aceite se purificó por cromatografía flash sobre gel de sílice utilizando 50-100 % de acetato de etilo en hexanos para dar 900 mg del compuesto del título, también se recuperaron 360 mg de la amida de partida de la mezcla de reacción.

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,57-2,00 (m, 5H), 2,2 (s, 3H), 2,27 (s, 3H), 2,57-2,62 (m, 1H), 2,82-2,93 (m, 2H), 3,6 (s, 2H), 3,72-3,80 (s, 3H), 4,37-4,5 (m, 3H), 4,68-4,75 (m, 1H), 6,90-7,03 (m, 3H).

Etapa E: Preparación de 2-[1-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-4-piperidinil]-4-oxazolcarboxilato de metilo

A una solución de 2-[1-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-4-piperidinil]-4,5-dihidro-4-oxazolcarboxilato de metilo (es decir el producto del Ejemplo 9, Etapa D) (1,09 g, 3,04 mmol) en 25 ml de diclorometano a 0 °C se añadió 1,8-diazabicyclo [5,4,0]undec-7-eno (508 mg, 3,34 mmol). Después se añadió en gotas bromotriclorometano (662 mg, 3,34 mmol) durante 5 minutos. La mezcla de reacción se agitó durante 6 horas a 0 °C. La mezcla de reacción se lavó con cloruro de amonio acuoso saturado (2 x 50 ml), la fase acuosa se extrajo de nuevo con acetato de etilo (2 x 25 ml), y las capas orgánicas combinadas se secaron sobre MgSO₄ y se concentraron bajo presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice utilizando 50-100 % de acetato de etilo en hexanos como eluyente para dar 600 mg del compuesto del título como un aceite.

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,70-1,86 (m, 2H), 2,00-2,25 (m, 2H), 2,21 (s, 3H), 2,28 (s, 3H), 2,90-2,98 (m, 1H), 3,05-3,20 (m, 2H), 3,64 (s, 2H), 3,80-3,85 (m, 1H), 3,9 (s, 3H), 4,60-4,77 (m, 1H), 6,91-7,06 (m, 3H), 8,18 (s, 1H).

Etapa F: Preparación de ácido 2-[1-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-4-piperidinil]-4-oxazol-carboxílico

Se disolvió 2-[1-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-4-piperidinil]-4-oxazolcarboxilato de metilo (es decir el producto del Ejemplo 9, Etapa E) (665 mg, 1,87 mmol) en 5 ml de tetrahidrofurano, y se añadieron 3,3 ml de agua. La mezcla de reacción se enfrió hasta 0 °C con agitación enérgica. Se añadió en gotas una solución acuosa de hidróxido de sodio 1N (3,7 ml), y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla de reacción se diluyó con solución saturada de cloruro de sodio (4 ml), se lavó con éter dietílico, y la fase acuosa se acidificó hasta pH 3-4 mediante la adición en gotas de solución de ácido cítrico al 20%. El sólido precipitado se filtró y se secó para dar 490 mg del

compuesto del título.

^1H RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ 1,55 (m, 2H), 2,0 (m, 2H), 2,14 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 2,85 (m, 1H), 3,1-3,3 (m, 2H), 3,65 (m, 2H), 3,9 (m, 1H), 4,35 (m, 1H), 6,8-7,1 (m, 3H), 8,66 (s, 1H), 13,0 (s, 1H).

5 Etapa G: Preparación de 2-[1-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-
-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-oxazolcarboxamida

10 Una mezcla de ácido 2-[1-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-4-piperidinil]-4-oxazolcarboxílico (es decir el producto del Ejemplo 9, Etapa F) (245 mg, 0,72 mmol), hidrocloreto de 1-[3-(dimetilamino)propil]-3-etilcarbodiimida (153 mg, 80 mmol) y N-metil morfolina (88 ml) en 3 ml de diclorometano se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos. Se añadió (1R)-1,2,3,4-tetrahidro-N-metil-1-naftalenamina (129 mg, 0,80 mmol) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. La mezcla de reacción se diluyó con diclorometano, se lavó con ácido clorhídrico acuoso 1N y agua, se secó sobre MgSO_4 y se concentró bajo presión reducida. Los productos se purificaron por cromatografía en gel de sílice utilizando acetato de etilo como eluyente para dar 75 mg del producto del título, un compuesto de la presente invención como un aceite.

15 ^1H RMN (CDCl_3) δ 1,6-2,3 (m, 8H), 2,2-2,3 (m, 6H), 2,7-2,9 (m, 3H), 3,0-3,25 (m, 4H), 3,64 (m, 2H), 3,75 (m, 1H), 4,4-4,6 (m, 1H), 5,95-6,1 (m, 1H), 6,9-7,2 (m, 7H), 8,1 (m, 1H).

0 EJEMPLO 10

Preparación de 2-[1-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1-fenilpropil]-4-oxazolcarboxamida (Compuesto 154)

20 Una mezcla de ácido 2-[1-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-4-piperidinil]-4-oxazolcarboxílico (es decir el producto del Ejemplo 9, Etapa F) (245 mg, 0,72 mmol), hidrocloreto de 1-[3-(dimetilamino)propil]-3-etilcarbodiimida (153 mg, 80 mmol) y 4-metilmorfolina (88 ml) en 3 ml de diclorometano se agitaron a temperatura ambiente durante 15 minutos. Se añadió (α R)- α -etil-N-metilbencenometanamina (es decir el producto del Ejemplo 1, Etapa C) (0,80 mmol, 119 mg) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. La mezcla de reacción se diluyó con diclorometano, se lavó con ácido clorhídrico acuoso 1N y agua, se secó sobre MgSO_4 y se concentró bajo presión reducida. Los productos se purificaron por cromatografía en gel de sílice utilizando 50-100 % de acetato de etilo en hexanos como eluyente para dar 90 mg del producto del título, un compuesto de la presente invención como un aceite.

25 ^1H RMN (CDCl_3) δ 0,9-1,1 (br m, 3H), 1,6-1,9 (m, 2H), 1,9-2,2 (m, 4H), 2,22 (s, 3H), 2,26 (s, 3H), 2,72 (br s, 2H), 2,9-3,1 (m, 4H), 3,15 (m, 1H), 3,65 (s, 2H), 3,75 (br m, 1H), 4,45 (br m, 1H), 5,85-6,2 (m, 1H), 6,9-7,1 (m, 3H) 7,25-7,40 (m, 5H), 8,1 (m, 1H).

30 EJEMPLO 11

Preparación de N-[(1R)-1-(3,5-dicloro-2-piridinil)etil]etil-2-[1-[(2,5-dimetil-fenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 111)

35 A una solución de 200 mg (0,56 mmol) de ácido 2-[1-[(2,5- dimetilfenil)acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarboxílico (es decir el producto del Ejemplo 9, Etapa B) en 5 ml de acetonitrilo se añadió 0,5 ml de una solución de anhídrido cíclico de ácido 1-propanofosfónico (50 % in acetato de etilo, 0,8 mmol) y se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos. A esta mezcla se añadió 110 mg (0,54 mmol) de (R)-[1-(3,5-dicloro-piridin-2-il)-etil]-metilamina en 5 ml de acetonitrilo que contenía 0,5 ml de trietilamina. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche, se diluyó con acetato de etilo, se lavó con hidróxido de sodio acuoso 1N y salmuera, se secó (MgSO_4), se filtró y se concentró El producto crudo se purificó por cromatografía líquida de media presión en gel de sílice utilizando acetato de etilo/metanol como eluyente para proporcionar 80 mg del producto del título, un compuesto de la presente invención como un aceite viscoso.

40 ^1H RMN (CDCl_3) δ 150-1,80 (m, 3H), 2,04 (m, 1H), 2,17 (m, 1H), 2,23 (s, 3H), 2,26 (s, 3H), 2,80-3,30 (m, 6H), 3,68 (s, 2H), 3,82 (m, 1H), 4,71 (m, 1H), 6,16 (m, 1H), 6,96 (m, 2H), 7,08 (m, 1H), 7,78 (m, 2H), 8,51 (br s, 1H). EJEMPLO 12

45 Preparación de 2-[1-[(3,5-dicloro-1H-pirazol-1-il)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 238)

Etapa A: Preparación de N,N-dimetil-1H-pirazol-1-sulfonamida

A una solución de pirazol (10,0 g, 147 mmol) en diclorometano (150 ml), se añadieron trietilamina (26,6 ml, 192 mmol) y cloruro de N,N-dimetilsulfamilo (20,0 ml, 181 mmol) y la mezcla de reacción se calentó hasta reflujo durante aproximadamente 60 horas. La mezcla de reacción después se enfrió hasta temperatura ambiente y se filtró a través de

una almohadilla de gel de sílice utilizando diclorometano como eluyente. El filtrado después se concentró bajo presión reducida y se trató con éter dietílico (100 ml) dando como resultado la formación de un sólido. La suspensión se filtró, y el precipitado se lavó con éter dietílico. Los filtrados combinados se combinaron y se concentraron al vacío para dar 27,46 g del compuesto del título. Este compuesto tenía pureza suficiente para ser utilizado en reacciones posteriores.

- 5 $^1\text{H RMN (CDCl}_3\text{)}$ δ 294 (s, 6H), 6,40 (s, 1H), 7,75 (s, 1H), 7,99 (s, 1H).

Etapas B: Preparación de 3-cloro-N,N-dimetil-1H-pirazol-1-sulfonamida

- 10 Bajo una atmósfera de nitrógeno, una solución de N,N-dimetil-1H-pirazol-1-sulfonamida (5,0 g, 28 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 12, Etapa A) en tetrahidrofurano (50 ml) se enfrió hasta -78°C y después se trató con n-butilitio (solución 2 M en ciclohexano, 15,0 ml, 30 mmol) en gotas. La mezcla de reacción formó un precipitado espeso, y se continuó la agitación durante 30 minutos después de la adición. A la suspensión agitada, se añadió en gotas una solución de hexafluoroetano (7,1 g, 30 mmol) en tetrahidrofurano (20 ml). Después de 30 minutos la solución transparente resultante se calentó hasta temperatura ambiente y se desactivó con la adición de agua (70 ml). La mezcla de reacción se extrajo con diclorometano y se secó sobre MgSO_4 . La mezcla de reacción se filtró y se concentró bajo presión reducida. El producto crudo se purificó por cromatografía en gel de sílice (50 % de hexanos en diclorometano como eluyente) para dar 1,71 g de 5-cloro-N,N-dimetil-1H-pirazol-1-sulfonamida. La 5-cloro-N,N-dimetil-1H-pirazol-1-sulfonamida se calentó hasta 110°C durante 12 horas con una cantidad catalítica de pirazol para isomerizar generando el compuesto del título.

$^1\text{H RMN (CDCl}_3\text{)}$ δ 3,07 (s, 6H), 6,33 (s, 1H), 7,60 (s, 1H).

Etapas C: Preparación de 3,5-dicloro-N,N-dimetil-1H-pirazol-1-sulfonamida

- 20 Bajo una atmósfera de nitrógeno, una solución de 3-cloro-N,N-dimetil-1H-pirazol-1-sulfonamida (1,68 g, 8 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 12, Etapa B) en tetrahidrofurano (10 ml) se enfrió hasta -78°C y después se trató con una solución de n-butilitio 2 M en ciclohexano (4,5 ml, 9 mmol) en gotas. La solución formó un precipitado espeso y se permitió que se agite durante 30 minutos después de la adición. A la suspensión agitada, se añadió en gotas una solución de hexafluoroetano (2,0 g, 8,5 mmol) en tetrahidrofurano (10 ml). Después de 1,5 horas la solución transparente resultante se calentó hasta temperatura ambiente y se desactivó con la adición de agua (20 ml). La mezcla de reacción se extrajo con diclorometano y se secó sobre MgSO_4 . La solución se filtró y se concentró bajo presión reducida para dar 1,97 g del compuesto del título. Este compuesto tenía pureza suficiente para ser utilizado en reacciones posteriores.

$^1\text{H RMN (CDCl}_3\text{)}$ δ 3,10 (s, 6H), 6,28 (s, 1H).

Etapas D: Preparación de 3,5-dicloro-1H-pirazol

- 30 En un frasco de base redonda con agitador magnético, se enfrió 3,5-dicloro-N,N-dimetil-1H-pirazol-1-sulfonamida (1,97 g, 8,0 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 12, Etapa C) hasta 0°C y se trató con ácido trifluoroacético (13 ml, 17 mmol) y se agitó durante 1,5 horas. La solución se extrajo con éter dietílico. El extracto se secó sobre MgSO_4 y se concentró bajo presión reducida dando 690 mg del compuesto del título. Este compuesto tenía pureza suficiente para ser utilizado en reacciones posteriores.
- 35 $^1\text{H RMN (CDCl}_3\text{)}$ δ 2,98 (s, 1H), 6,21 (s, 1H).

Etapas E: Preparación de 3,5-dicloro-1H-pirazol-1-acetato de etilo

- 40 Una suspensión de 3,5-dicloro-1H-pirazol (690mg, 5,0mmol) (es decir el producto del Ejemplo 12, Etapa D), carbonato de potasio (3 g, 21 mmol) en N,N-dimetilformamida (10 ml) se trató con bromoacetato de etilo (1,0 ml, 9,0 mmol) y se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas. La suspensión se diluyó con acetato de etilo, se lavó con agua, y se secó sobre MgSO_4 . La mezcla de reacción después se concentró bajo presión reducida dando 1,05 g del compuesto del título. Este compuesto tenía pureza suficiente para ser utilizado en reacciones posteriores.

$^1\text{H RMN (CDCl}_3\text{)}$ δ 1,29 (t, 3H), 4,25 (q, 2H), 4,85 (s, 2H), 6,20 (m, 1H).

Etapas F: Preparación de ácido 3,5-dicloro-1H-pirazol-1-acético

- 45 Una solución de 3,5-dicloro-1H-pirazol-1-acetato de etilo (1,29 g, 5,8 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 12, Etapa E) en tetrahidrofurano (10 ml) se trató con hidróxido de sodio (5 ml, solución acuosa al 15%) en agua (3 ml), y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 1,5 horas. La mezcla de reacción después se diluyó con agua (15 ml) y se concentró bajo presión reducida. La solución acuosa se acidificó con ácido clorhídrico concentrado hasta pH 1. La mezcla de reacción después se extrajo con acetato de etilo y el extracto se secó sobre MgSO_4 . El extracto después se concentró y se recristalizó a partir de 20 % de acetato de etilo en hexanos para dar 370 mg del compuesto del título.

^1H RMN (CDCl_3) δ 4,94 (s, 2H), 6,24 (s, 1H).

Etapa G: Preparación de 2-[1-[(3,5-dicloro-1H-pirazol-1-il)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida

5 Una solución de ácido 3,5-dicloro-1H-pirazol-1-acético (70 mg, 0,36 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 12, Etapa F) en diclorometano (1 ml) y una cantidad catalítica de N,N-dimetilformamida (1 gota) se trató con cloruro de oxalilo (0,1 ml, 1,1 mmol) y se agitó a temperatura ambiente durante 20 minutos. La mezcla de reacción se concentró bajo presión reducida y se disolvió nuevamente en diclorometano (1 ml). La mezcla de reacción se añadió a una suspensión agitada de monohidrócloruro de N-metil-2-(4-piperidinil)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (es decir el producto del Ejemplo 6, Etapa C) (100 mg, 0,26 mmol), trietilamina (0,1 ml, 0,72 mmol), y carbonato de potasio (150 mg, 1 mmol) en diclorometano (2 ml). La mezcla de reacción después se calentó hasta reflujo durante 2 horas, y después se enfrió hasta temperatura ambiente. La suspensión resultante se diluyó con diclorometano (10 ml), se filtró, y se concentró al vacío. El producto crudo se purificó por cromatografía en gel de sílice utilizando 50-100 % de acetato de etilo en hexanos como eluyente para dar 80 mg del producto del título, un compuesto de la presente invención como un aceite.

15 ^1H RMN (CDCl_3) δ 1,6-2,1 (m, 5H), 2,1-2,3 (m, 3H), 2,32 (m, 3H), 2,7-3,0 (m, 6H), 3,2-3,35 (m, 2H), 3,95-4,1 (m, 1H), 4,35-4,6 (m, 1H), 4,96-5,02 (m, 2H), 5,6-6,1 (m, 1H), 6,20 (s, 1H), 7,11-7,24 (m, 4H), 7,86 (m, 1H).

EJEMPLO 13

Preparación de 2-[1-[[5-cloro-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 249)

20 Etapa A: Preparación de N,N-dimetil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-sulfonamida

A una solución de 3-trifluorometilpirazol (5,0 g, 36 mmol), trietilamina, (7,0 ml, 50 mmol) en diclorometano (40 ml) se añadió cloruro de N,N-dimetilsulfamilo (5,5 ml, 51 mmol) y la mezcla de reacción se calentó hasta reflujo durante 2 días. La mezcla de reacción se enfrió hasta temperatura ambiente y se filtró a través de una almohadilla de gel de sílice utilizando diclorometano como eluyente. La solución resultante después se concentró bajo presión reducida para dar un residuo color ámbar. El residuo se disolvió en éter dietílico y se lavó con agua. El extracto después se secó sobre MgSO_4 y se concentró bajo presión reducida dando 8,71 g del compuesto del título. Este compuesto tenía pureza suficiente para ser utilizado en reacciones posteriores.

^1H RMN (CDCl_3) δ 3,01 (s, 6H), 6,65 (s, 1H), 8,03 (s, 1H).

Etapa B: Preparación de 5-cloro-N,N-dimetil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-sulfonamida

30 Bajo una atmósfera de nitrógeno, se enfrió N,N-dimetil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-sulfonamida (4,0 g, 16 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 13, Etapa A) en tetrahidrofurano (25 ml) hasta -78°C después se trató con n-butilitio (solución 2 M en ciclohexano, 8,6 ml, 17,2 mmol) en gotas. La mezcla de reacción formó un precipitado espeso, y se continuó la agitación durante 30 minutos después de la adición. A la suspensión agitada, se añadió en gotas una solución de hexafluoroetano (4,2 g, 18 mmol) en tetrahidrofurano (15 ml). Después de 1 hora la solución transparente resultante se calentó hasta temperatura ambiente y se desactivó con la adición de agua (50 ml). La mezcla de reacción se extrajo con diclorometano y se secó sobre MgSO_4 . La mezcla de reacción se filtró y se concentró bajo presión reducida para dar 4,38 g del compuesto del título. Este compuesto tenía pureza suficiente para ser utilizado en reacciones posteriores.

^1H RMN (CDCl_3) δ 3,15 (s, 6H), 6,58 (s, 1H).

40 Etapa C: Preparación de 5-cloro-3-(trifluorometil)-1H-pirazol

En un frasco de base redonda con agitador magnético, se enfrió 5-cloro-N,N-dimetil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-sulfonamida (4,38 g, 15,8 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 13, Etapa B) hasta 0°C y se trató con ácido trifluoroacético (2,7 ml, 35 mmol). La mezcla de reacción se agitó a 0°C durante 1,5 horas. La solución resultante se diluyó con agua (15 ml) y se basificó con carbonato de sodio hasta pH 12. La mezcla de reacción se extrajo con éter dietílico. El extracto se secó sobre MgSO_4 y se concentró bajo presión reducida dando 2,1 g del compuesto del título. Este compuesto tenía pureza suficiente para ser utilizado en reacciones posteriores.

^1H RMN (CDCl_3) δ 6,57 (m, 1H).

Etapa D: Preparación de 5-cloro-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acetato de etilo

Una suspensión de 5-cloro-3-(trifluorometil)-1H-pirazol (2,1 g, 12,3 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 13, Etapa C), carbonato de potasio (3,6 g, 26 mmol) en N,N-dimetilformamida (20 ml) se trató con bromoacetato de etilo (2,1 ml, 18,8 mmol) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas. La mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo, se lavó con agua, y se secó sobre MgSO_4 . La mezcla de reacción se filtró y se concentró bajo presión reducida. El producto crudo se purificó por cromatografía en gel de sílice utilizando 0-50 % de acetato de etilo en hexanos como eluyente para dar 940 mg del compuesto del título.

^1H RMN (CDCl_3) δ 1,29 (m, 3H), 4,27 (q, 2H), 4,96 (m, 2H), 6,55 (s, 1H).

Etapa E: Preparación de ácido 5-cloro-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acético

Una solución de 5-cloro-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acetato de etilo (218 mg, 0,85 mmol) en tetrahidrofurano (1 ml) se trató con hidróxido de sodio (0,2 ml, solución acuosa al 50%) en agua (0,6 ml), y se agitó a temperatura ambiente durante 4 horas. La mezcla de reacción después se diluyó con agua (15 ml) y se concentró bajo presión reducida. La mezcla de reacción se acidificó con ácido clorhídrico concentrado hasta pH 1. La mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo, se secó sobre MgSO_4 , y se concentró para dar 140 mg del compuesto del título. Este compuesto tenía pureza suficiente para ser utilizado en reacciones posteriores.

^1H RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ 5,41 (s, 2H), 7,09 (s, 1H).

Etapa F: Preparación de 2-[1-[[5-cloro-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida

Una solución de ácido 5-cloro-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acético (140 mg, 0,61 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 13, Etapa E) en diclorometano (2 ml) y una cantidad catalítica de N,N-dimetilformamida (1 gota) se trató con cloruro de oxalilo (0,1 ml, 1,1 mmol) y se agitó a temperatura ambiente durante 20 minutos. La mezcla de reacción se concentró bajo presión reducida y se disolvió nuevamente en diclorometano (1 ml). La mezcla de reacción se añadió a una suspensión agitada de monohidrócloruro de N-metil-2-(4-piperidinil)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (es decir el producto del Ejemplo 6, Etapa C) (280 mg, 0,72 mmol), trietilamina, (0,2 ml, 1,5 mmol), y carbonato de potasio (300 mg, 2,1 mmol) en diclorometano (2 ml). La mezcla de reacción después se calentó hasta reflujo durante 4 horas, y después se enfrió hasta temperatura ambiente. La suspensión resultante se diluyó con diclorometano (10 ml), se filtró, y se concentró al vacío. El producto crudo se purificó por cromatografía en gel de sílice utilizando 50-100 % de acetato de etilo en hexanos como eluyente para dar 130 mg del producto del título, un compuesto de la presente invención como un aceite.

^1H RMN (CDCl_3) δ 1,6-2,1 (m, 5H), 2,1-2,3 (m, 3H), 2,32 (m, 3H), 2,7-3,0 (m, 6H), 3,2-3,35 (m, 2H), 3,95-4,1 (m, 1H), 4,35-4,6 (m, 1H), 4,96-5,02 (m, 2H), 5,6-6,1 (m, 1H), 6,59 (s, 1H), 7,05-7,25 (m, 4H), 7,96 (m, 1H).

EJEMPLO 14

Preparación de 2-[1-[[3,5-bis(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 210)

Etapa A: Preparación de ácido 3,5-bis-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acético

Una solución de 3,5-bis-(trifluorometil)pirazol (1,0 g, 4,90 mmol) en N,N-dimetilformamida (10 ml) a 0 °C se trató con hidruro de sodio (dispersión al 60 % en aceite, 215 mg, 5,37 mmol) y la mezcla de reacción se permitió que se agite a temperatura ambiente durante 1 hora. Después se añadió una solución de yodoacetato de etilo (2,0 g, 9,30 mmol) en N,N-dimetilformamida (10 ml) y la mezcla de reacción se calentó a 80 °C durante 24 horas. La mezcla de reacción después se enfrió hasta temperatura ambiente, se diluyó con acetato de etilo y se lavó con agua. La capa orgánica se secó con MgSO_4 , se filtró y se concentró para proporcionar 570 mg del éter crudo. El éter crudo se disolvió en tetrahidrofurano (2 ml) y se trató con hidróxido de sodio (150 mg) en agua (1,5 ml). La mezcla de reacción después se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. La mezcla resultante se diluyó con agua (10 ml), se extrajo con éter dietílico (20 ml). Las capas orgánicas se secaron con MgSO_4 , se filtraron y se concentraron al vacío para proporcionar 190 mg del compuesto del título. Este compuesto tenía pureza suficiente para ser utilizado en reacciones posteriores.

^1H RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ 5,29 (s, 2H), 7,65 (s, 1H).

^{19}F RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ -59,4, -61,4.

Etapa B: Preparación de 2-[1-[[3,5-bis(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida

Una solución de ácido 3,5-bis-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acético (190 mg, 0,73 mmol) (es decir el producto del Ejemplo

14, Etapa A) en acetato de etilo (5,0 ml) se trató con anhídrido cíclico de ácido 1- propanefosfónico (solución al 50 % en acetato de etilo, 1,0 ml, 1,6 mmol) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. La mezcla de reacción se añadió a una suspensión agitada de monohidrocloreto de N-metil-2-(4-piperidinil)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazol-carboxamida (es decir el producto del Ejemplo 6, Etapa C) (210 mg, 0,53 mmol), trietilamina (0,5 ml, 3,75 mmol) en acetato de etilo (5 ml). La mezcla de reacción después se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas. La suspensión resultante se concentró al vacío y se purificó por MPLC sobre gel de sílice utilizando acetato de etilo/ hexanos como eluyente para dar 110 mg del producto del título, un compuesto de la presente invención como un aceite.

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,60-2,31 (m, 5H), 2,67-3,06 (m, 9H), 3,20-3,45 (m, 2H), 3,62-3,92 (m, 1H), 4,26-4,60 (m, 1H), 5,08-5,23 (m, 2H), 5,60-6,10 (m, 1H), 6,93 (s, 1H), 7,07-7,30 (m, 4H), 7,86 (m, 1H).

EJEMPLO 15

Preparación de 2-[1-[(3,5-dietil-1H-pirazol-1-il)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 209)

Etapa A: Preparación de 3,5-dietil-1H-pirazol

Una solución de 3,5-heptanediona (2,4 g, 18,8 mmol) e hidrazina hidratada (1,0 g, 19,0 mmol) y ácido acético (1 gota) en agua (10 ml) se calentó hasta reflujo durante 1 hora. La mezcla de reacción después se enfrió en un baño de hielo para formar un precipitado blanco. El precipitado después se filtró, se disolvió en cloroformo y se secó sobre MgSO₄. La reacción resultante se concentró bajo presión reducida para proporcionar 2,14 g del compuesto del título. Este compuesto tenía pureza suficiente para ser utilizado en reacciones posteriores.

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,27 (t, 6H), 2,65 (q, 4H), 5,90 (s, 1H).

Etapa B: Preparación de 3,5-dietil-1H-pirazol-1-acetato de etilo

A una solución de 3,5-dietil-1H-pirazol (2,14 g, 17,2 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 15, Etapa A) en N,N-dimetilformamida (10 ml) se añadió carbonato de potasio (4,7 g) y bromoacetato de etilo (2,9 ml, 26,1 mmol). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. Los sólidos resultantes se filtraron y el filtrado se diluyó con acetato de etilo, se lavó con agua y se secó sobre MgSO₄. La mezcla de reacción se concentró bajo presión reducida para dar 2,79 g del compuesto del título.

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,27 (m, 9H), 2,57 (m, 4H), 4,22 (q, 2H), 4,78 (s, 2H), 5,93 (s, 1H).

Etapa C: Preparación de ácido 3,5-dietil-1H-pirazol-1-acético

3,5-dietil-1H-pirazol-1-acetato de etilo (2,79 g, 13,3 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 15, Etapa B) en tetrahidrofurano (10 ml) se trató con hidróxido de sodio (1,0 g) en agua (7,5 ml). La mezcla de reacción después se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. La mezcla de reacción se concentró bajo presión reducida y se lavó con éter dietílico. La capa acuosa resultante se acidificó con ácido clorhídrico concentrado para dar un precipitado blanco. El precipitado se filtró y se secó en aire para dar 690 mg del compuesto del título.

¹H RMN (DMSO-d₆) δ 1,12 (m, 6H), 2,49 (m, 4H), 4,74 (s, 2H), 5,87 (s, 1H).

Etapa D: Preparación de 2-[1-[(3,5-dietil-1H-pirazol-1-il)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida

Una solución de ácido 3,5-dietil-1H-pirazol-1-acético (135mg, 0,74 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 15, Etapa C) en acetato de etilo (5,0 ml) se trató con anhídrido cíclico de ácido 1-propanofosfónico (solución al 50% en acetato de etilo, 1,0 ml, 1,6 mmol) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. La mezcla de reacción se añadió a una suspensión agitada de monohidrocloreto de N-metil-2-(4-piperidinil)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (es decir el producto del Ejemplo 6, Etapa C) (210 mg, 0,53 mmol), trietilamina (0,5 ml, 3,75 mmol) en acetato de etilo (5 ml). La mezcla de reacción después se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas. La suspensión resultante se concentró al vacío y se purificó por MPLC sobre gel de sílice utilizando acetato de etilo/hexanos como eluyente para dar 60 mg del producto del título, un compuesto de la presente invención como un aceite.

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,10-1,30 (m, 6H), 1,50-2,30 (m, 8H), 2,45-2,65 (m, 4H), 2,70-2,95 (m, 5H), 3,10-3,30 (m, 2H), 3,90-4,15 (m, 2H), 4,40-4,60 (m, 1H), 4,70-5,00 (m, 2H), 5,60-6,10 (m, 2H), 7,05-7,50 (m, 4H), 7,87 (m, 1H).

EJEMPLO 16

Preparación de 2-[1-[[5-etil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 208)

EtapA A: Preparación de 5-etil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol

- 5 Una solución de 1,1,1-trifluoro-2,4-hexano-diona (2,4 g, 143 mmol), hidrazina hidratada (1,0 g, 19,0 mmol) y ácido acético (1 gota) en agua (10 ml) se calentó hasta reflujo durante 1 hora. La mezcla de reacción después se enfrió en un baño de hielo para formar un precipitado blanco. El precipitado después se filtró, se disolvió en cloroformo y se secó sobre MgSO_4 . La solución resultante se concentró bajo presión reducida para proporcionar 1,39 g del compuesto del título. Este compuesto tenía pureza suficiente para ser utilizado en reacciones posteriores.

^1H RMN (CDCl_3) δ 1,26 (t, 3H), 2,70 (q, 2H, 6,34 (s, 1H).

- 10 Etapa B: Preparación de 5-etil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acetato de etilo

- 15 A una solución de 5-etil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol (1,39 g, 8,5 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 16, Etapa A) en N,N-dimetilformamida (10 ml) se añadió carbonato de potasio (2,3 g) y bromoacetato de etilo (1,4 ml, 12,6 mmol). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. Los sólidos resultantes se filtraron y el filtrado se diluyó con acetato de etilo, se lavó con agua y se secó sobre MgSO_4 . La solución resultante se concentró bajo presión reducida para dar 1,34 g del compuesto del título. Este compuesto tenía pureza suficiente para ser utilizado en reacciones posteriores.

EtapA C: Preparación den ácido 5-etil-3-(trifluorometil)-1H-pirazole-1-acético

- 20 5-etil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acetato de etilo (1,34 g, 7,5 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 16, Etapa A) en tetrahidrofurano (5 ml) se trató con hidróxido de sodio (0,5 g) en agua (3,5 ml). La mezcla de reacción después se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. La mezcla de reacción se concentró bajo presión reducida y se lavó con éter dietílico. La capa acuosa resultante se acidificó con ácido clorhídrico concentrado para dar un precipitado blanco. El precipitado se filtró y se secó en aire para dar 690 mg del compuesto del título.

^1H RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ 1,20 (m, 3H), 2,60 (m, 2H), 5,06 (s, 2H), 6,54 (s, 1H).

- 25 Etapa D: Preparación de 2-[1-[[5-etil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida

- 30 Una solución de ácido 5-etil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acético (170 mg, 0,76 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 16, Etapa C) en acetato de etilo (5,0 ml) se trató con anhídrido cíclico de ácido 1-propanefosfónico (solución al 50% en acetato de etilo, 1,0 ml, 1,6 mmol) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. La mezcla de reacción se añadió a una suspensión agitada de monohidrócloruro de N-metil-2-(4-piperidinil)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (es decir el producto del Ejemplo 6 Etapa C) (219 mg, 0,56 mmol), trietilamina (0,5 ml, 3,75 mmol) en acetato de etilo (5 ml). La mezcla de reacción después se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas. La suspensión resultante se concentró al vacío y se purificó por MPLC en gel de sílice utilizando acetato de etilo/hexanos como eluyente para dar 200 mg del producto del título, un compuesto de la presente invención como un aceite.

- 35 ^1H RMN (CDCl_3) δ 1,20-1,30 (m, 3H), 1,55-2,25 (m, 8 H), 2,50-2,70 (m, 2H), 2,70-3,00 (m, 6H), 3,10-3,50 (m, 2H), 3,90-4,10 (m, 1H), 4,30-4,60 (m, 1H), 4,80-5,10 (m, 2H), 5,60-6,10 (m, 1H), 6,33 (m, 1H), 7,05-7,50 (m, 4H), 7,88 (m, 1H).

EJEMPLO 17

- 40 Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-oxazolinecarboxamida (Compuesto 246)

EtapA A: Preparación de [(1S)-1-(hidroximetil)-2-[metil[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]amino]-2-oxoetil]carbamato de 1,1-dimetiletilo

- 45 Una solución de (1R)-1,2,3,4-tetrahidro-N-metil-1-naftalenamina (0,887 g, 5,5 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 6, Etapa A) en tetrahidrofurano (15 ml) se trató con t-Boc-L-serina (1,03 g, 5 mmol), N-hidroxibenzotriazol (0,677 g, 0,5 mmol) y N,N-diisopropilcarbodiimida (0,663 g, 5,25 mmol) a 0 °C. Se permitió que la mezcla de reacción se caliente hasta temperatura ambiente y se agitó durante 16 horas. El precipitado formado se filtró y se lavó con tetrahidrofurano. El filtrado y los lavados se concentraron, y el residuo se purificó por cromatografía líquida de presión media utilizando un gradiente de 50-100 % de acetato de etilo en hexanos como eluyente para dar 1,11 g del compuesto del título.

^1H RMN (CDCl_3) δ 1,46-1,48 (m, 9H), 1,8-1,9 (m, 2H), 1,97-2,05 (m, 2H), 2,65, 2,83 (d, 3H), 2,72-2,80 (br s, 3,33-3,43 (m, 1H), 3,78-4,00 (m, 2H), 4,65-4,80 (m, 1H), 5,27-5,91 (m, 2H), 6,98-7,2 (m, 4H).

Etapa B: Preparación de monohidrocloruro de (2S)-2-amino-3-hidroxi-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]propanamida

- 5 A una solución de [(1S)-1-(hidroximetil)-2-[metil[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil] amino]-2-oxoetil]carbamato de 1,1-dimetiletilo (1,11 g, 3,19 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 17, Etapa A) en metanol (15 ml) se añadió una solución 2 M de cloruro de hidrógeno en éter (15 ml, 30 mmol), y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas. La mezcla de reacción se concentró al vacío y el residuo resultante se disolvió en metanol y se concentró al vacío nuevamente. El residuo se secó en alto vacío para dar 750 mg del compuesto del título como un sólido blanco.

^1H RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ 1,6-2,0 (m, 4H), 2,7 (s, 3H), 3,61-3,80 (m, 2H), 4,38-4,43 (d, 1H), 5,18-5,66 (m, 2H), 7,0-7,2 (m, 4H), 8,2-8,3 (br s, 3H).

Etapa C: Preparación de 1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinilcarboxilato de etilo

- 15 Una solución de 4-piperidinacarboxilato de etilo (1,57 g, 10 mmol) y trietilamina (2,09 ml, 15 mmol) en diclorometano (20 ml) se enfrió hasta 0 °C y se añadió en gotas una solución de cloruro de 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acetilo (preparada tal como se describe en el Ejemplo 19, etapa B) en 5 ml de diclorometano con agitación. Se permitió que la mezcla de reacción se caliente hasta temperatura ambiente y se agitó durante 16 horas. La mezcla de reacción se vertió en 50 ml de agua, y la capa orgánica se lavó posteriormente con agua, ácido clorhídrico acuoso 1M, agua, solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y salmuera. Las capas orgánicas separadas se secaron (MgSO_4) y se evaporaron al vacío para dar 32 g del compuesto del título.

^1H RMN (CDCl_3) δ 1,22-1,24 (t, 3H), 1,61-1,74 (m, 2H), 1,85-2,00 (m, 2H), 2,3 (s, 3H), 2,5-2,6 (m, 1H), 2,88-3,23 (m, 2H), 3,82-4,32 (m, 2H), 4,17-4,19 (q, 2H), 4,85 (s, 2H), 6,31 (s, 1H).

Etapa D: Preparación de ácido 1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinilcarboxílico

- 25 Una solución de 1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinilcarboxilato de etilo (3,6 g, 10,36 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 17, Etapa C) en metanol (10 ml) se trató con solución acuosa de hidróxido de sodio 1 M (15,54 ml, 15,54 mmol) a 0 °C. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas y después ácido clorhídrico 1 M (15,54 ml, 15,54 mmol) se añadió, y la mayor parte del metanol se evaporó al vacío dejando cristales blancos. Los cristales se filtraron y se secaron para dar 2,25 g del compuesto del título como un sólido blanco.

- 30 ^1H RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ 1,30-1,65 (m, 2H), 1,80-1,92 (m, 2H), 2,2 (s, 3H), 2,72-3,21 (m, 2H), 3,25-3,36 (m, 1H), 3,77-4,20 (m, 2H), 5,18-5,34 (m, 2H), 6,5 (s, 1H).

Etapa E: Preparación de N-[(1S)-1-(hidroximetil)-2-[metil[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]amino]-2-oxoetil]-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinacarboxamida

- 35 Una solución de de monohidrocloruro de (2S)-2-amino-3-hidroxi-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]propanamida (546,33 mg, 2,2 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 17, Etapa B) y N-metilmorfolina (222,53 mg, 2,2 mmol) en 8 ml de tetrahidrofurano se enfrió hasta 0 °C y se añadió ácido 1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinilcarboxílico (638,56 mg, 2 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 17, Etapa D) seguido por N-hidroxibenzotriazol (27 mg, 0,2 mmol) y N,N-diisopropilcarbodiimida (265 mg, 2,1 mmol). La mezcla de reacción se agitó durante 16 horas a temperatura ambiente y se filtró. El precipitado se lavó con tetrahidrofurano y el filtrado resultante y los lavados se concentraron al vacío. El residuo se disolvió en diclorometano y la solución resultante se lavó con agua, ácido clorhídrico acuoso 1M, agua, solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró al vacío. El producto resultante se purificó por cromatografía líquida de media presión sobre gel de sílice utilizando 0-20 % de metanol en acetato de etilo como eluyente para dar 600 mg del compuesto del título como un sólido blanco.

- 45 ^1H RMN (CDCl_3) δ 1,65-2,05 (m, 8H), 2,3 (s, 3H), 2,40-3,26 (m, 2H), 2,7-2,9 (m, 6H), 3,55 (s, 1H), 3,8-3,92 (m, 2H), 3,92-4,54 (m, 2H), 5,0-5,1 (m, 2H), 5,2-5,9 (m, 1H), 6,35 (s, 1H), 6,9-7,2 (m, 5H).

Etapa F: Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-oxazolinecarboxamida

- 50 Una mezcla de 207 mg (0,38 mmol) de N-[(1S)-1-(hidroximetil)-2-[metil[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]amino]-2-oxoetil]-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-pipendinecarboxamida (207 mg, 0,38 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 17, Etapa E) y hidróxido de (metoxicarbonilsulfamoi) trietilamonio, sal interna

(reactivo de Burgess) (104,86 mg, 0,44 mmol) en 2 ml de tetrahidrofurano se calentaron a 70 °C durante 2,5 horas en el tubo sellado. La mezcla de reacción se concentró al vacío y además se purificó por cromatografía líquida de presión media utilizando 75-100 % de acetato de etilo en hexanos como eluyente para dar 90 mg del compuesto del título, un compuesto de la presente invención como un aceite.

- 5 ^1H RMN (CDCl_3) δ 1,60-2,05 (m, 8H), 2,1 (s, 3H), 2,65-2,97 (m, 5H), 3,00-3,12 (m, 1H), 3,2-3,92 (m, 2H), 4,20-4,35 (m, 2H), 4,9-5,1 (m, 4H), 05,6-5,9 (m, 1H), 6,32 (s, 1H), 6,97-7,20 (m, 4H).

EJEMPLO 18

Preparación de N-metil-1-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-1H-pirazol-3-carboxamida (Compuesto 231)

- 10 Etapa A: Preparación de 4-[(metilsulfonil)oxi]-1-piperidina-carboxilato de 1,1-dimetiletilo

A una solución de 4-hidroxi-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo (4,02 g, 20 mmol) y trietilamina (4,4 ml) en 50 ml de diclorometano se añadió lentamente metanesulfonilcloruro (1,7 ml, 22 mmol) a 0 °C. La mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a 0 °C, se lavó con ácido clorhídrico acuoso 1M, se secó sobre MgSO_4 se concentró al vacío para dar 5 g del compuesto del título como un sólido blanco.

- 15 ^1H RMN (CDCl_3) δ 1,44 (s, 9H), 1,74-1,86 (m, 2H), 1,9-2,1 (m, 2H), 3,02 (s, 3H), 3,27-3,35 (m, 2H), 3,66-3,75 (m, 2H), 4,84-4,92 (m, 1H).

Etapa B: Preparación de 4-[3-(metoxycarbonil)-1H-pirazol-1-il]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo

- 20 Una suspensión de 60 9b dispersión de hidruro de sodio en aceite mineral (192 mg, 4,8 mmol) en 20 ml de N,N-dimetilformamida se enfrió hasta 0 °C, y se añadió gradualmente 3-pirazolcarboxilato de metilo (605,37 mg, 4,8 mmol) con agitación en atmósfera de nitrógeno. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 0,5 horas y se enfrió nuevamente hasta 0 °C. Una solución de 4-[(metilsulfonil)oxi]-1-piperidina-carboxilato de 1,1-dimetiletilo (1,18 g, 4 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 18, Etapa A) en 5 ml de N,N-dimetilformamida se añadió gradualmente a la mezcla de reacción. La mezcla resultante se agitó durante 5 días a 60 °C. La mezcla de reacción se vertió en agua con hielo y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó (MgSO_4), se evaporó al vacío, y se purificó por cromatografía líquida de presión media sobre gel de sílice eluyendo con 0-10 % de metanol en acetato de etilo como eluyente para dar 290 mg del compuesto del título como un sólido blanco.

- 25 ^1H RMN (CDCl_3) δ 1,46 (s, 9H), 1,88-2,00 (m, 2H), 2,12-2,20 (m, 2H), 2,80-2,92 (m, 2H), 3,92 (s, 3H), 4,24-4,33 (m, 2H), 4,34-4,31 (m, 1H), 6,82 (s, 1H), 7,44 (s, 1H).

- 30 Adicionalmente, se aislaron 370 mg de 4-[5-(metoxycarbonil)-1H-pirazol-1-il]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo eluyendo antes el compuesto del título.

^1H RMN (CDCl_3) δ 1,46 (s, 9H), 1,92-2,00 (m, 2H), 2,08-2,15 (m, 2H), 2,85-2,95 (m, 2H), 3,89 (s, 3H), 4,20-4,31 (m, 2H), 5,24-5,32 (m, 1H), 6,85 (s, 1H), 7,51 (s, 1H).

Etapa C: Preparación monohidrocloreto de 1-(4-piperidinil)-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo

- 35 A una solución de 4-[3-(metoxycarbonil)-1H-pirazol-1-il]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo (300 mg, 0,97 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 18, Etapa B) en 5 ml de éter dietílico se añadió una solución 2 M de cloruro de hidrógeno en éter (4,85 ml, 9,7 mmol), y la mezcla de reacción se agitó durante 5 horas a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se evaporó al vacío, el residuo resultante se disolvió en metanol y se concentró al vacío. El residuo se secó en vacío elevado para dar 200 mg del compuesto del título como un sólido blanco.

- 40 ^1H RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ 2,1-2,3 (m, 4H), 3,0-3,1 (m, 2H), 3,31-3,41 (m, 2H), 3,8 (s, 3H), 4,56-4,68 (m, 1H), 6,8 (s, 1H), 7,96 (s, 1H), 9,10-9,58 (br s, 2H).

Etapa D: Preparación de 1-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo

- 45 Una mezcla de monohidrocloreto de 1-(4-piperidinil)-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo (220 mg, 0,9 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 18, Etapa C) y trietilamina (0,42 ml, 3 mmol) en 5 ml de diclorometano se agitó a temperatura ambiente durante aproximadamente 15 minutos hasta la completa disolución y se enfrió hasta 0 °C. Se añadió gradualmente una solución de cloruro de 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acetilo (227 mg, 1 mmol) (preparada tal como se describe en el Ejemplo 19, Etapa B), y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. La mezcla de reacción se vertió en agua, la capa orgánica se lavó con ácido clorhídrico acuoso 1M, agua, solución

acuosa saturada de bicarbonato de sodio, salmuera. La mezcla de la reacción filtrada se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró al vacío para dar 320 mg del compuesto del título.

^1H RMN (CDCl_3) δ 1,90-2,07 (m, 2H), 2,2-2,3 (m, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,79-3,36 (m, 2H), 3,93 (s, 3H), 4,10-4,71 (m, 2H), 4,25-4,52 (m, 1H), 4,94-5,04 (m, 2H), 6,35 (s, 1H), 6,85 (s, 1H), 7,22 (s, 1H).

5 Etapa E: Preparación de ácido 1-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-1H-pirazol-3-carboxílico

Una solución de 1-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-1H-pirazol-3-carboxilato de metilo (320 mg, 0,8 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 18, Etapa D) en 8 ml de metanol se enfrió hasta 0 °C y se añadió gradualmente solución acuosa de hidróxido de sodio 1M (1,6 ml, 1,6 mmol). La mezcla de reacción se agitó a 50 °C durante 16 horas, y se añadió ácido clorhídrico acuoso 1M (1,6 ml, 1,6 mmol) seguido por 5 ml de solución acuosa saturada de cloruro de sodio. La mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo, y el extracto se secó sobre sulfato de magnesio y se evaporó al vacío para dar 270 mg del compuesto del título como un sólido vítreo.

^1H RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ 1,80-2,19 (m, 4H), 2,2 (s, 3H), 2,8-3,3 (m, 2H), 3,98-4,48 (m, 2H), 4,5-4,6 (m, 1H), 5,23-5,4 (m, 2H), 6,5 (s, 1H), 6,7 (s, 1H), 7,9 (s, 1H), 12,6 (s, 1H).

15 Etapa F: Preparación de N-metil-1-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-1H-pirazol-3-carboxamida

Una mezcla de ácido 1-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-1H-pirazol-3-carboxílico (270 mg, 0,7 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 18, Etapa E), hidrocloreto de N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida (EDC) (147,61 mg, 0,77 mmol) y N-metilmorfolina (0,088 ml, 0,8 mmol) en 5 ml de diclorometano se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos. Se añadió (1R)-1,2,3,4-tetrahidro-N-metil-1-naftalenamina (124,16 mg, 0,77 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 6, Etapa A) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. La mezcla de reacción se vertió en agua, y la capa orgánica se lavó posteriormente con agua, ácido clorhídrico acuoso 1M, agua, solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio, salmuera. La mezcla de reacción filtrada se secó sobre sulfato de magnesio y se evaporó al vacío. El producto crudo se purificó por cromatografía líquida de presión media sobre gel de sílice utilizando 75-100 % de acetato de etilo en hexanos como eluyente para dar 55 mg del compuesto del título, un compuesto de la presente invención como un aceite.

^1H RMN (CDCl_3) δ 1,68-2,10 (m, 6H), 2,11-2,27 (s, 3H), 2,33-2,35 (d, 3H), 2,74-3,00 (m, 5H), 3,22-3,4 (m, 1H), 4,00-4,18 (m, 1H), 4,30-4,66 (m, 2H), 4,93-5,07 (m, 2H), 5,88-6,12 (m, 1H), 6,29-6,38 (m, 1H), 6,74-6,81 (d, 1H), 7,1-7,3 (m, 4H), 7,40-7,42 (d, 1H).

EJEMPLO 19

30 N-[(1R)-2,3-dihidro-1H-inden-1-il]-N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 178)

Etapa A: Preparación de monohidrocloreto de 2-(4-piperidinil)-4-tiazolcarboxilato de etilo

Una solución de 4-[4-(etoxicarbonil)-2-tiazolil]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletillo (11,1g, 32,7 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 1, Etapa A) en 100 ml de éter dietílico se trató con una solución de cloruro de hidrógeno 2 M en éter dietílico (166 ml, 331 mmol) a 0 °C. el precipitado de reacción resultante se disolvió con 100 ml de etanol absoluto y se agitó durante toda la noche a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se evaporó al vacío, se disolvió nuevamente en etanol y se evaporó nuevamente para dar un sólido. El sólido resultante se colocó bajo un elevado vacío durante varias horas para dar 10,38 g del compuesto del título como un polvo blanco higroscópico.

^1H RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ 1,30 (t, 3H), 1,9 (m, 2H), 2,2 (m, 2H), 3,0 (m, 2H), 3,35 (m, 2H), 3,4 (m, 1H), 4,3 (q, 2H), 8,9-9,3 (b, 2H).

Etapa B: Preparación de etil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarboxilato

Ácido 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (7,58 g, 36,4 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 2, Etapa A) se disolvió en 100 ml de diclorometano. A la mezcla de reacción, se añadió 1 gota de N,N-dimetilformamida y la mezcla de reacción se enfrió hasta 0 °C. La mezcla de reacción se trató con cloruro de oxalilo (3,5 ml, 40 mmol) en gotas y se permitió que se caliente hasta temperatura ambiente y se agitó durante 3 horas. La mezcla resultante se evaporó al vacío y se colocó bajo elevado vacío para dar 7,93g del cloruro de ácido correspondiente, cloruro de 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acetilo, como un sólido de color tostado. El cloruro ácido se disolvió en 50 ml de diclorometano y se añadió una solución de monohidrocloreto de 2-(4-piperidinil)-4-tiazolcarboxilato de etilo (10,38 g, 33,1 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 19, Etapa A) y trietilamina (23 ml, 165 mmol) en 200 ml de diclorometano a 0 °C. Se permitió que la mezcla de reacción se calentara hasta temperatura ambiente y se agitó durante toda la noche. La

mezcla de reacción se vertió en agua y se extrajo con diclorometano. El extracto se lavó con ácido clorhídrico acuoso 1M, agua, solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio, y salmuera. La mezcla filtrada se secó (MgSO_4) y se evaporó al vacío para dar 13,0 g del compuesto del título como un aceite.

5 ^1H RMN (CDCl_3) δ 1,4 (t, 3H), 1,78 (m, 2H), 2,2 (m, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,80 (m, 1H), 3,25 (m, 1H), 3,36 (m, 1H), 4,07 (m, 1H), 4,42 (q, 2H), 4,62 (m, 1H), 4,98 (m, 2H), 6,34 (s, 1H), 8,09 (s, 1H).

Etapas C: Preparación de ácido 2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarboxílico

10 Una solución de etil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarboxilato (13,0 g, 30,2 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 19, Etapa B) en 60 ml de metanol se enfrió hasta 0 °C y se trató con una solución acuosa de NaOH 1N (36,3 ml, 36,3 mmol). Se permitió que la mezcla de reacción se calentara hasta temperatura ambiente, y se agitó durante 5 horas. La mezcla de reacción se enfrió nuevamente hasta 0 °C y se trató con ácido clorhídrico acuoso 1N (36,3 ml, 36,3 mmol). El precipitado resultante se filtró, se lavó con agua y se secó en un horno al vacío a 100 °C para dar 10,95 g del compuesto del título como un sólido blanco.

^1H RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ 1,55 (m, 1H), 1,80 (m, 1H), 2,1 (m, 2H), 2,21 (s, 3H), 2,82 (m, 1H), 3,30 (m, 2H), 3,98 (m, 1H), 4,38 (m, 1H), 5,28 (m, 2H), 6,50 (s, 1H), 8,36 (s, 1H), 12,9 (br s, 1H).

15 Etapas D: Preparación de cloruro de 2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarbonilo

20 Una solución de ácido 2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarboxílico (2,55 g, 5,87 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 19, Etapa C) en 100 ml de diclorometano se enfrió hasta -10 °C y se añadió 1 gota de N,N-dimetilformamida. La mezcla de reacción se trató con una adición en gotas de una solución de cloruro de oxalilo (0,60 ml, 6,8 mmol) en 10 ml de diclorometano. La mezcla de reacción se agitó a -10 °C durante 30 minutos, se permitió que se calentara hasta temperatura ambiente y se agitó 16 horas adicionales. La mezcla homogénea resultante se evaporó al vacío y el residuo se colocó bajo vacío elevado durante varias horas para dar 2,46 g del compuesto del título como un sólido amarillo claro.

^1H RMN (CDCl_3) δ 1,80 (m, 2H), 2,2 (m, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,88 (m, 1H), 3,36 (m, 2H), 4,10 (m, 1H), 4,60 (m, 1H), 4,99 (m, 2H), 6,34 (s, 1H), 8,39 (s, 1H).

25 Etapas E: Preparación de N-[(1R)-2,3-dihidro-1H-inden-1-il]-N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarboxamida

30 Se trató cloruro de 2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarbonilo (210 mg, 0,5 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 19, Etapa D) con una solución de (1R)-2,3-dihidro-N,2-dimetil-1H-inden-1-amina (147 ml, 1,0 mmol) y trietilamina (139 ml, 1,0 mmol) en 5 ml de diclorometano. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas, se pasó a través de una columna Varian 1005 Chem Elut™ pretratada con 3 ml de ácido clorhídrico acuoso 1N. La columna se enjuagó con tres volúmenes de columna de diclorometano. La solución de diclorometano recolectada se evaporó al vacío y se purificó por cromatografía líquida de media presión sobre gel de sílice utilizando 50-100 % de acetato de etilo en 1-clorobutano como eluyente para dar 214 mg del compuesto del título, el producto de la presente invención como una espuma blanca.

35 ^1H RMN (CDCl_3) δ 1,78 (m, 3H), 2,18 (m, 2H), 2,39-3,31 (dos s, 3H), 2,45 (m, 1H), 2,7-3,2 (s y m, 6H), 3,28 (m, 2H), 4,00 (m, 1H), 4,50 (m, 1H), 4,97 (m, 2H), 5,9-6,4 (m, 2H), 7,2-7,3 (m, 4H), 7,83 (s, 1H).

EJEMPLO 20

Preparación de N-(2,3-dihidro-2-metil-1H-inden-1-il)-N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 226)

40 A una solución de 2,3-dihidro-N,2-dimetil-1H-inden-1-amina (177 mg, 1,1 mmol) y trietilamina (0,22 ml, 1,6 mmol) en 5 ml de diclorometano se añadió gradualmente cloruro de 2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarbonilo (421 mg, 1 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 19, Etapa D) a 0 °C. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas, se diluyó con 4 ml de diclorometano, y se lavó con agua, ácido clorhídrico acuoso 1N, agua, solución saturada de bicarbonato de sodio y salmuera. La mezcla de reacción filtrada se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró al vacío para dar 215 mg del compuesto del título, el producto de la presente invención como una espuma blanca.

45 ^1H RMN (CDCl_3) δ 1,56 (s, 3H), 1,70-1,86 (m, 2H), 2,11-2,27 (m, 2H), 2,3 (s, 3H), 2,62-2,75 (m, 4H), 2,87-3,00 (m, 2H), 3,09-3,18 (m, 1H), 3,2-3,4 (m, 2H), 4,00-4,55 (m, 2H), 4,90-5,05 (m, 2H), 5,93-6,20 (m, 1H), 6,30-6,35 (m, 1H), 7,20-7,33 (m, 4H), 7,8-7,9 (d, 1H).

EJEMPLO 21

Preparación de N-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 222)

- 5 A una solución de 2,3- dihidro-N,2,2-trimetil-1H-inden-1-amina (193 mg, 1,1 mmol) y trietilamina (0,19 ml, 1,38 mmol) en 5 ml de diclorometano se añadió gradualmente cloruro de 2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarbonilo (386 mg, 0,92 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 19, Etapa D) a 0 °C. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas, se diluyó con 4 ml de diclorometano, y se lavó con agua, ácido clorhídrico acuoso 1N, agua, solución saturada de bicarbonato de sodio y salmuera. La mezcla de reacción filtrada se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró al vacío para dar 300 mg del compuesto del título, el producto de la presente invención como una espuma blanca.

¹H RMN (CDCl₃) δ 0,98 (s, 2H), 1,18-1,28 (m, 4H), 1,70-1,82 (m, 2H), 2,12-2,29 (m, 2H), 2,3 (s, 3H), 2,61-2,75 (m, 4H), 2,82-2,98 (m, 2H), 3,22-3,37 (m, 2H), 3,98-4,60 (m, 2H), 4,92-5,08 (m, 2H), 5,52-5,81 (d, 1H), 6,3 (s, 1H), 7,20-7,32 (m, 4H), 7,80-7,83 (d, 1H).

EJEMPLO 22

- 15 Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-(1,2,3,4-tetrahidro-2-metil-1-naftalenil)-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 193)

- 20 A una solución de 1,2,3,4- tetrahidro-N,2-dimetil-1-naftalenamina (115 mg, 0,66 mmol) y trietilamina (0,12 ml, 0,825 mmol) en 2 ml de diclorometano se añadió gradualmente cloruro de 2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarbonilo (231 mg, 0,55 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 19, Etapa D) a 0 °C. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas, se diluyó con 4 ml de diclorometano, y se lavó con agua, ácido clorhídrico acuoso 1N, agua, solución saturada de bicarbonato de sodio y salmuera. La mezcla de reacción filtrada se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró al vacío para dar 270 mg del compuesto del título, el producto de presente invención como una espuma blanca.

- 25 ¹H RMN (CDCl₃) δ 1,06-1,10 (m, 3H), 1,61-1,83 (m, 4H), 2,08-2,24 (m, 3H), 2,32-2,35 (m, 3H), 2,72-2,82 (m, 4H), 2,86-3,00 (m, 3H), 3,20-3,38 (m, 2H), 3,93-4,08 (m, 1H), 4,47-4,59 (m, 1H), 4,91-5,06 (m, 2H), 5,82-6,15 (m, 1H), 6,32-6,35 (m, 1H), 7,10-7,54 (m, 4H), 7,79-7,90 (d, 1H).

EJEMPLO 23

Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil)-4-tiazolcarboxamida (compuesto 188)

- 30 A una solución de 1,2,3,4-tetrahidro-N-metil-1-naftalenamida (145 mg, 0,9 mmol) (preparada mediante el procedimiento que se describe en el Ejemplo 6, Etapa A) y trietilamina (0,16 ml, 1,13 mmol) en 2 ml de diclorometano se añadió gradualmente cloruro de 2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarbonilo (316 mg, 0,75 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 19, Etapa D) a 0 °C. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas, se diluyó con 4 ml de diclorometano, y se lavó con agua, ácido clorhídrico acuoso 1N, agua, solución saturada de bicarbonato de sodio y salmuera. La mezcla de reacción filtrada se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró al vacío. El producto crudo se purificó por cromatografía líquida de presión media sobre gel de sílice utilizando 60-100 % de acetato de etilo en hexanos como eluyente para dar 242 mg del compuesto del título, un compuesto de la presente invención como espuma blanca.

- 40 ¹H RMN (CDCl₃) δ 1,6-2,0 (m, 4H), 2,05-2,3 (m, 6H), 2,7-3,0 (m, 6H), 3,22-3,35 (m, 2H), 3,95-4,58 (m, 3H), 4,96-5,02 (m, 2H), 5,67-6,05 (m, 1H), 6,32 (s, 1H), 7,05-7,25 (m, 4H), 7,85 (m, 1H).

EJEMPLO 24

Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R,2S)-1,2,3,4-tetrahidro-2-metil-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida y su enantiómero (Compuesto 234)

- 45 A una solución de (1R,2S)-1,2,3,4-tetrahidro-N,2-dimetil-naftalenamina y su enantiómero (0,043 g, 0,25 mmol) (preparada mediante el procedimiento que se describe en el Ejemplo 6, Etapa A) y trietilamina (0,104 ml, 0,74 mmol) en 2 ml de diclorometano se añadió gradualmente cloruro de 2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarbonilo (85 mg, 0,2 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 19, Etapa D) a 0 °C. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas, se diluyó con 4 ml de diclorometano, y se lavó con agua, ácido clorhídrico acuoso 1 N, agua, solución saturada de bicarbonato de sodio y salmuera. La mezcla de reacción filtrada se secó sobre sulfato de sodio y se concentró al vacío. El producto crudo se

purificó por cromatografía líquida de presión media sobre gel de sílice utilizando 60-100 % de acetato de etilo en hexanos como eluyente para dar 43 mg de los compuestos del título, compuestos de la presente invención como espuma blanca.

Espectro en masa a 558 (M+1).

5 EJEMPLO 25

Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 236)

A una solución de 1,2,3,4-tetrahidro-N,2,2-trimetil-naftalenamina (0,0423 g, 0,22 mmol) (preparada mediante el procedimiento que se describe en el Ejemplo 6, Etapa A) y trietilamina (0,036 ml, 0,26 mmol) en 1 ml de diclorometano se añadió gradualmente cloruro de 2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarbonilo (316 mg, 0,75 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 19, Etapa D) a 0 °C. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas, se diluyó con 2 ml de diclorometano, y se lavó con agua, ácido clorhídrico acuoso 1N, agua, solución saturada de bicarbonato de sodio y salmuera. La mezcla de reacción filtrada se secó sobre sulfato de sodio y se concentró al vacío. El producto crudo se purificó por cromatografía líquida de presión media sobre gel de sílice utilizando 60-100 % de acetato de etilo en hexanos como eluyente para dar 70 mg del compuesto del título, un compuesto de la presente invención como espuma blanca.

¹H RMN (CDCl₃) δ 0,85 y 1,10 (dos s, total 4H), 0,94-1,65 (m, 2H), 1,02 y 1,14 (dos s, total 3H), 1,77 (m, 3H), 2,17 (m, 1H), 2,29 y 2,32 (dos s, total 3H), 2,77 y 2,86 (dos s, total 3H), 2,82 (m, 1H), 2,90 (m, 1H), 3,29 (m, 1H), 4,00 (m, 1H), 4,37 (m, 1H), 4,50 (m, 1H), 5,00 (m, 2H), 5,69 y 5,85 (s y d, total 1H), 6,34 (m, 1H), 7,19-7,42 (m, 4H), 7,79 y 7,86 (dos s, total 1H),

EJEMPLO 26

Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R,4S)-1,2,3,4-tetrahidro-4-hidroxi-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida y su enantiómero (Compuesto 191)

Etapa A: Preparación de (1S,4R)-1,2,3,4-tetrahidro-4-(metilamino)-1-naftalenol y su enantiómero

A una solución de 1,2,3,4-tetrahidro-1,4-epoxinaftaleno (2,92 g, 20 mmol) y trietilamina (0,3 ml, 2 mmol) en 40 ml de diclorometano a 0 °C se añadió 9-bromo-9-borabicyclo[3,3,1]nonano (solución 1 M en tetrahydrofurano, 30 ml, 30 mmol). La mezcla de reacción se agitó a 0 °C durante 20 minutos, y después se añadió una solución 2 M de metilamina en tetrahydrofurano (40 ml), formando un precipitado blanco. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas, se vertió en 100 ml de ácido clorhídrico acuoso 1M, y se filtró. La capa acuosa filtrada se lavó con diclorometano, se basificó con pélets de NaOH hasta pH 13, y después se extrajo con diclorometano. El extracto se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se evaporó al vacío para dar un sólido amarillo gomoso. El sólido se suspendió en éter dietílico, se filtró, se lavó con éter dietílico y se secó con aire para dar 2,15 g de los compuestos del título como polvo blanco.

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,90 (m, 2H), 2,1 (m, 1H), 2,25 (m, 1H), 2,35 (s, 3H), 3,0-4,0 (br s, 2H), 3,76 (m, 1H), 4,70 (m, 1H), 7,2-7,4 (m, 4H).

Etapa B: Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R,4S)-1,2,3,4-tetrahidro-4-hidroxi-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida y su enantiómero

A una solución de (1S,4R)-1,2,3,4-tetrahidro-4-(metilamino)-1-naftalenol y su enantiómero (283 mg, 1,6 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 26, Etapa A) y trietilamina (0,5 ml, 3,6 mmol) en 5 ml de diclorometano se añadió gradualmente cloruro de 2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarbonilo (605 mg, 1,44 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 19, Etapa D) a 0 °C. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora, se diluyó con diclorometano, y se lavó con agua, ácido clorhídrico acuoso 1N, agua, solución saturada de bicarbonato de sodio y salmuera. La mezcla de reacción filtrada se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró al vacío. El producto crudo se purificó por cromatografía líquida de presión media sobre gel de sílice utilizando 0-20 % de acetona en acetato de etilo como eluyente para dar 700 mg de los compuestos del título, compuestos de la presente invención como un polvo blancuzco.

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,6-1,9 (m, 3H), 2,0-2,3 (m, 6H), 2,31 y 2,33 (2s, 3H), 2,40 (m, 1H), 2,7-3,0 (s y m, 4H), 3,2-3,4 (m, 2H), 3,9-4,1 (m, 1H), 4,3-4,6 (m, 1H), 4,80 (m, 1H), 4,97 (m, 2H), 5,6-6,0 (m, 1H), 6,35 (m, 1H), 7,2-7,4 (m, 4H), 7,88 (s, 1H).

50 EJEMPLO 27

Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-(1,2,3,4-tetrahidro-4-oxo-1-naftalenil)-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 211)

Una mezcla de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R,4S)-1,2,3,4-tetrahidro-4-hidroxi-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida y su enantiómero (96 mg, 0,17 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 26, Etapa B) y dióxido de manganeso (400 mg, 4,6 mmol) en cloroformo (2 ml) se hicieron girar para formar un vórtex durante toda la noche a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se filtró a través de Celite® auxiliar de filtro diatomáceo, y se purificó por cromatografía líquida de media presión sobre gel de sílice utilizando 20 % de acetona en acetato de etilo como eluyente para dar 70 mg del compuesto del título, un compuesto de la presente invención como una espuma blanca.

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,6-1,9 (m, 3H), 2,0-2,7 (m, 7H), 2,7-3,4 (s y m, 7H), 3,8-4,2 (m, 1 H), 4,3-4,7 (m, 1H), 4,9-5,1 (m, 2H), 6,0-6,4 (m, 2H), 7,4 (m, 2H), 7,6 (m, 1H), 7,98 (m, 1H), 8,1 (m, 1H).

EJEMPLO 28

Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R,4R)-1,2,3,4-tetrahidro-4-hidroxi-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida y su enantiómero (compuesto 206)

Etapa A: Preparación de (1R,4R)-1,2,3,4-tetrahidro-4-(metilamino)-1-naftalenol y su enantiómero

A una solución de (1S,4R)-1,2,3,4-tetrahidro-4-(metilamino)-1-naftalenol y su enantiómero (517,6 mg, 2,92 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 26, Etapa A) en tetrahidrofurano (3 ml) se añadió trifenilfosfina (766 mg, 2,92 mmol) y ácido acético (175 mg, 2,02 mmol). La mezcla se enfrió hasta 0 °C y se añadió gradualmente azodicarboxilato de dietilo (0,541 ml, 3,4 mmol). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas, y se concentró al vacío. El residuo resultante se diluyó con éter dietílico y se permitió que repose a temperatura ambiente durante 16 horas. El precipitado formado se filtró, el filtrado se lavó con solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró bajo presión reducida. El residuo de reacción se diluyó con éter dietílico y se extrajo con ácido clorhídrico acuoso 1N. El extracto acuoso se basificó con solución acuosa al 50% de hidróxido de sodio hasta pH 9 e inmediatamente se extrajo con éter dietílico. El extracto orgánico se secó (MgSO₄) y se concentró para dar 390 mg de acetatos invertidos, acetato de (1R,4R)-1,2,3,4-tetrahidro-4-(metilamino)-1-naftalenilo y su enantiómero. El acetato y su enantiómero se agitaron durante 6 horas a temperatura ambiente con 2 g de resina Bio- Rad AG1-X2 (OH⁻). La resina se filtró, el filtrado se evaporó al vacío y el residuo resultante se diluyó con éter dietílico y se extrajo con ácido clorhídrico acuoso 1N. El extracto ácido se basificó con 50 % solución acuosa de hidróxido de sodio y se extrajo con diclorometano. El extracto orgánico se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró para dar 70 mg de los compuestos del título como un sólido.

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,73-1,86 (m, 2H), 2,1-2,3 (m, 2H), 3,68-3,72 (m, 1H), 4,78-4,81 (m, 1H), 7,23-7,46 (m, 4H).

Etapa B: Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R,4R)-1,2,3,4-tetrahidro-4-hidroxi-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida y su enantiómero

A una solución de (1R,4R)-1,2,3,4-tetrahidro-4-(metilamino)-1-naftalenol y su enantiómero (70 mg, 0,39 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 28, Etapa A) y trietilamina (0,082 ml, 0,59 mmol) en 2 ml de diclorometano se añadió gradualmente cloruro de 2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarbonilo (181 mg, 0,43 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 19, Etapa D) a 0 °C. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas, se diluyó con 5 ml de diclorometano, y se lavó con agua, ácido clorhídrico acuoso 1N, agua, solución saturada de bicarbonato de sodio y salmuera. La mezcla de reacción filtrada se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró al vacío. El producto crudo se purificó por cromatografía líquida de presión media sobre gel de sílice utilizando 0-20 % de acetona en acetato de etilo como eluyente para dar 160 mg de los compuestos del título, compuestos de la presente invención como una espuma blanca.

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,6-2,3 (m, 11H), 2,78-3,03 (m, 4H), 3,20-3,36 (m, 2H), 3,88-4,61 (m, 2H), 4,80-5,05 (m, 3H), 5,78-6,12 (m, 1H), 6,32 (s, 1H), 7,18-7,36 (m, 4H), 7,60-7,66 (m, 1H), 7,91-7,95 (m, 1H).

EJEMPLO 29

Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 289)

Una mezcla de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 149) (273 mg, 0,5 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 6, Etapa D) y 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3-ditia-2,4-difosfetano-2,4-disulfuro (202 mg, 0,5 mmol) (reactivo de

Lawesson) en 5 ml de tolueno se calentó a 100°C durante 3 días. La mezcla de reacción se concentró al vacío, y el residuo resultante se disolvió en 10 ml de diclorometano y se lavó con solución acuosa 1 M de carbonato de potasio y se secó sobre sulfato de magnesio. El residuo filtrado se concentró al vacío y se purificó por cromatografía líquida de media presión sobre gel de sílice utilizando 50-100 % de acetato de etilo en hexanos como eluyente para dar 70 mg del compuesto del título, un compuesto de la presente invención como una espuma blanca.

$^1\text{H RMN}$ (CDCl_3) δ 1,54-2,40 (m, 11H), 2,70-2,93 (m, 4H), 3,20-3,33 (m, 4H), 3,90-4,60 (m, 2H), 4,92-5,45 (m, 3H), 6,31 (s, 1H), 7,00-7,22 (m, 4H), 7,72 (s, 1H).

EJEMPLO 30

Preparación de N-metil-2-[4-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-1-piperazinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 220)

Etapas A: Preparación de 4-[4-(etoxicarbonil)-2-tiazolil]-1-piperazinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo

1-piperazinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo (1,86 g, 10 mmol), 2-cloro-5-tiazolcarboxilato de metilo (1,92 g, 10,0 mmol), diazabicycloundeceno (1,5 ml, 10 mmol) y una cantidad catalítica de yoduro de potasio (2 mg) se disolvieron en 10 ml de dimetilsulfóxido seco y se calentó hasta 80°C durante 16 horas. La solución caliente se añadió en gotas con agitación a 200 ml de agua fría. La mezcla de reacción se extrajo con éter dietílico. El extracto resultante se lavó con agua y salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró bajo presión reducida para dar 3,23 g de un aceite amarillo que se solidificó en reposo. El sólido se recrystalizó a partir de éter dietílico/ hexanos para dar 1,0 g del compuesto del título como cristales amarillo claro. Este compuesto tenía pureza suficiente para ser utilizado en reacciones posteriores.

$^1\text{H RMN}$ (CDCl_3) δ 1,37 (t, 3H), 1,48 (s, 9H), 3,53 (s, 8H), 4,38 (q, 2H), 7,47 (s, 1H).

Etapas B: Preparación de monohidrocloreto de 2-(1-piperazinil)-4-tiazolcarboxilato de etilo

Una solución de 4-[4-(etoxicarbonil)-2-tiazolil]-1-piperazinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo (1,0 g, 3,4 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 30, Etapa A) en 10 ml de diclorometano se trató con cloruro de hidrógeno 2 M en éter dietílico (10 ml) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. La mezcla resultante se evaporó al vacío para dar 1,0 g del compuesto del título como un sólido blanco. Este compuesto tenía pureza suficiente para ser utilizado en reacciones posteriores.

$^1\text{H RMN}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ 1,27 (t, 3H), 3,20 (br s, 4H), 3,70 (m, 4H), 4,22 (q, 2H), 7,81 (s, 1H), 9,55 (br s, 2H).

Etapas C: Preparación de etil- 2-[4-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-1-piperazinil]-4-tiazolcarboxilato

Cloruro de 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acetilo (1,05 g, 2,5 mmol) (preparada tal como se describe en el Ejemplo 19, etapa B) se disolvió en 10 ml de diclorometano y se añadió a una mezcla de monohidrocloreto de 2-(1-piperazinil)-4-tiazolcarboxilato (1,0 g, 3,0 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 30, Etapa B) y carbonato de potasio anhidro en polvo (2,2 g, 15,9 mmol) en 20 ml de diclorometano a 0 °C. Se permitió que la mezcla de reacción se calentara hasta temperatura ambiente y se agitó durante 3 horas. Después se añadió trietilamina (2 ml) a la mezcla de reacción, y se continuó la agitación durante 30 minutos adicionales. La mezcla de reacción se diluyó con diclorometano, se lavó con ácido clorhídrico acuoso 1N, agua, solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y salmuera, y se secó sobre sulfato de magnesio. El residuo filtrado se evaporó al vacío para dar 1,0 g de una espuma blanca. La espuma resultante se suspendió en 1-clorobutano y se filtró para dar 0,83 g del compuesto del título como un sólido blanco.

$^1\text{H RMN}$ (CDCl_3) δ 1,38 (t, 3H), 2,33 (s, 3H), 3,5-3,8 (m, 8H), 4,36 (q, 2H), 5,00 (s, 2H), 6,34 (s, 1H), 7,51 (s, 1H).

Etapas D: Preparación de ácido 2-[4-[[5-metil- 3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-1-piperazinil]-4-tiazolcarboxílico

Una solución de etil-2-[4-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-1-piperazinil]-4-tiazolcarboxilato (0,83 g, 1,93 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 30, Etapa C) en una mezcla de metanol (10 ml) y tetrahidrofurano (10 ml) se trató con a solución acuosa de NaOH 1N (4,0 ml, 4,0 mmol). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas, después se trató con solución acuosa de ácido clorhídrico 1N (4,5 ml, 4,5 mmol). La mezcla resultante se concentró al vacío y la suspensión resultante se diluyó con diclorometano y se filtró para dar un sólido. El sólido resultante se lavó con diclorometano y éter dietílico, y se secó con aire para dar 0,64 g del compuesto del título como un sólido blanco.

$^1\text{H RMN}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ 2,21 (s, 3H), 3,4-3,7 (m, 8H), 5,32 (m, 2H), 6,51 (s, 1H), 7,69 (s, 1H), 12,7 (br s, 1H).

Etapas E: Preparación de N-metil-2-[4-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-1-piperazinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida

Ácido 2-[4-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-1-piperazinil]-4-tiazolcarboxílico (200 mg, 0,5 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 30, Etapa D) se suspendió en 5 ml de diclorometano seco y se trató con trietilamina (150 ml, 1,08 mmol) para dar una solución homogénea. A esta mezcla de reacción se añadió hexafluorofosfato de O-benzotriazol-1-il-N, N,N',N'-tetrametiluronio (HBTU, 210 mg, 0,55 mmol) seguido por

5

(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-N-metil-1-naftalenamina (106 mg, 0,60 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 6, Etapa A). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas, se pasó a través de una columna CE1010 de Varian Chem Elut™ pretratada con 5 ml de solución acuosa de ácido cítrico al 20 %. La columna se enjuagó con tres volúmenes de columna de diclorometano, se concentró y se purificó por cromatografía en gel de sílice eluyendo con acetato de etilo para dar 223 mg del producto del título, el compuesto de la presente invención como espuma blanca.

10

EJEMPLO 31

Preparación de N-metil-2-[1,2,3,6-tetrahidro-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piridinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 218) y N-metil-2-[1,2,3,4-tetrahidro-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piridinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 315)

15

Etapa A: Preparación de 4-bromo-4-[4-(etoxicarbonil)-2-tiazolil]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo

Una mezcla de 4-[4-(etoxicarbonil)-2-tiazolil]-1-piperazinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo (3,4 g, 10 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 30, Etapa A), N-bromosuccinimida (1,96 g, 11 mmol) y 2,2'-azobisisobutironitrilo (AIBN, 40 mg, 0,24 mmol) en 40 ml de tetracloruro de carbono se sometió a reflujo durante 1 hora. La mezcla de reacción después se enfrió, se filtró, se concentró al vacío, y se purificó por cromatografía líquida de presión media sobre gel de sílice utilizando 0-20 % de acetato de etilo en 1-clorobutano como eluyente para dar 1,9 g del compuesto del título como un aceite.

20

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,40 (t, 3H), 1,46 (s, 9H), 2,3-2,5 (m, 4H), 3,35 (m, 2H), 4,05 (m, 2H), 4,2 (m, 2H), 4,41 (q, 2H), 8,20 (s, 1H).

25

Etapa B: Preparación de 4-[4-(etoxicarbonil)-2-tiazolil]-3,6-dihidro-1(2H)-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo

Una mezcla de 4-bromo-4-[4-(etoxicarbonil)-2-tiazolil]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo (19 g, 4,5 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 31, Etapa A) y carbonato de potasio anhidro (1,0 g, 7,2 mmol) se calentaron en 20 ml de acetonitrilo a 80 °C durante toda la noche. La mezcla de reacción se enfrió, se filtró, se concentró al vacío, y se purificó por cromatografía líquida de presión media sobre gel de sílice utilizando 0-20% de acetato de etilo en 1-clorobutano como eluyente para dar 1,1 g del compuesto del título como un aceite amarillo.

30

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,41(t,3H),1,47(s,9H),2,75(m,2H),3,65(m,2H),4,12(m,2H),4,42(q,2H),6,62(m,1H),8,07(s,1H).

Etapa C: Preparación de monohidrocloreto de 2-(1,2,3,6-tetrahidro-4-piridinil)-4-tiazolcarboxilato de etilo

Una mezcla de 4-[4-(etoxicarbonil)-2-tiazolil]-3,6-dihidro-1(2H)-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo (1,1 g, 3,25 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 31, Etapa B) en 50 ml de diclorometano se trató con 10 ml de una solución 2 M de HCl en éter dietílico. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas y se concentró al vacío para dar 1,0 g del compuesto del título como un sólido naranja.

35

¹H RMN (DMSO-d₆) δ 1,31 (t, 3H), 2,80 (m, 2H), 3,33 (m, 2H), 3,80 (m, 2H), 4,33 (q, 2H), 6,70 (m, 1H), 8,50 (s, 1H), 9,45 (br s, 2H).

40

Etapa D: Preparación de 2-[1,2,3,6-tetrahidro-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piridinil]-4-tiazolcarboxilato de etilo

Cloruro de 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acetilo (1,05 g, 2,5 mmol) (preparado tal como se describe en el ejemplo 19, etapa B) se disolvió en 10 ml de diclorometano y se añadió a una mezcla de monohidrocloreto de 2-(1,2,3,6-tetrahidro-4-piridinil)-4-tiazolcarboxilato (1,0 g, 3,3 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 31, Etapa C) y carbonato de potasio anhidro en polvo (2,2 g, 15,9 mmol) en 20 ml de diclorometano a 0 °C. Se permitió que la mezcla de reacción se calentara hasta temperatura ambiente y se agitó durante 3 horas. Después se añadió trietilamina (2 ml) a la mezcla de reacción, y la agitación continuó durante 20 minutos adicionales. La mezcla de reacción se diluyó con diclorometano, se lavó con ácido clorhídrico acuoso 1N, agua, solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y salmuera, y se secó sobre sulfato de magnesio. El residuo filtrado se evaporó al vacío para dar 1,0 g de una espuma blanca. La espuma resultante se purificó por cromatografía líquida de presión media sobre gel de sílice eluyendo con

45

50

0-50 % de acetato de etilo en 1-clorobutano para dar 0,67 g del compuesto del título como un aceite amarillo que se solidificó en reposo.

^1H RMN (CDCl_3) δ 1,42 (t, 3H), 2,32 (s, 3H), 2,8 (m, 2H), 3,75-3,90 (m, 2H), 4,30 (m, 2H), 4,42 (q, 2H), 5,00 (m, 2H), 6,34 (s, 1H), 6,62 (m, 1H), 8,06 (m, 1H).

5 Etapa E: Preparación de N-metil-2-[1,2,3,6-tetrahidro-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piridinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 218) y N-metil-2-[1,2,3,4-tetrahidro-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piridinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 315)

10 2-21[1,2,3-tetrahidro-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piridinil]-4-tiazolcarboxilato de etilo (0,67 g) (es decir el producto del Ejemplo 31, Etapa D) se disolvió en 10 ml de metanol y se trató con 2 ml de una solución acuosa de NaOH 1N. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora, y se añadió una solución de ácido clorhídrico acuoso 1N (2 ml). La mezcla de reacción se diluyó con agua y la capa acuosa resultante se extrajo con acetato de etilo. El extracto se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró al vacío para dar 0,61 g de un sólido color tostado. El sólido resultante se disolvió en 25 ml de diclorometano y se trató con 0,5 ml de cloruro de oxalilo y 5 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas, y después se concentró al vacío para dar una espuma color tostado. La espuma resultante se disolvió en 3 ml de diclorometano y la mezcla

15 resultante se añadió en gotas a una mezcla de (1R)-1,2,3,4-tetrahidro-N-metil-1-naftalenamina (350 mg, 1,97 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 6, Etapa A) y trietilamina (0,5 ml, 3,6 mmol) en 5 ml de diclorometano. La mezcla de reacción después se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora y se pasó a través de una columna Varian Chem ElutTM M CE1010 pretratada con 7 ml de ácido clorhídrico acuoso 1N. La columna se enjuagó con tres volúmenes de columna de diclorometano, se concentró al vacío y se purificó por cromatografía en gel de sílice eluyendo con acetato de etilo para dar dos compuestos isoméricos:

20

124 mg de N-metil-2-[1,2,3,4-tetrahidro-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piridinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 315) como espuma blanca; ^1H RMN (CDCl_3) δ 1,7-2,1 (m, 4H), 2,1-2,4 (m, 5H), 2,7-3,0 (m, 4H), 3,5-4,1 (m, 4H), 4,85-5,15 (m, 3H), 5,25-6,95 (m, 3H), 7,1-7,3 (m, 4H), 7,85 (m, 1H) y

25 114 mg de N-metil-2-[1,2,3,6-tetrahidro-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piridinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida (Compuesto 218) como una espuma blanca; ^1H RMN (CDCl_3) δ 1,7-2,1 (m, 3H), 2,1-2,4 (m, 4H), 2,6-3,0 (m, 7H), 3,7-3,9 (m, 2H), 4,25 (m, 2H), 5,02 (m, 2H), 5,7-6,6 (m, 3H), 7,1-7,3 (m, 4H), 7,88 (m, 1H).

30 EJEMPLO 32

Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-2H-1,2,3-triazol-4-carboxamida (Compuesto 232)

Etapa A: Preparación de 4-[4-(etoxicarbonil)-2H-1,2,3-triazol-2-il]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo

35 A una solución de 4-hidroxipiperidina-1-carboxilato de t-butilo (0,43 g, 3,3 mmol) y trifenilfosfina (1,05 g, 4,0 mmol) en tetrahidrofurano (15 ml) a 0 °C se añadió en gotas azodicarboxilato de dietilo (0,63 ml, 4,0 mmol). Después de 5 minutos se añadió 1 H-1,2,3-triazol-4-carboxilato de etilo (0,43 g, 3,0 mmol, preparado de acuerdo a D. R. Buckle, C. J. M. Rockell, J. Chem Soc., Perkin Transaction 1 1982, 2, 627-630.) en tetrahidrofurano (5 ml). La mezcla de reacción se agitó durante toda la noche a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se concentró bajo presión reducida y el residuo se purificó por cromatografía líquida de media presión (MPLC) utilizando 15 a 40 % de acetato de etilo en hexanos como eluyente para producir 0,42 g del compuesto del título como un aceite.

40

^1H RMN (CDCl_3) δ 1,41(t,3H), 1,47(s,9H), 2,13(m,4H), 2,97(m,2H), 4,19(m,2H), 4,42(q,2H), 4,69(m,1H), 8,04(s,1H).

Adicionalmente eluyendo antes el compuesto del título se aislaron 0,35 g de 1,1-dimetiletil 4-[5-(etoxicarbonil)-1H-1,2,3-triazol-1-il]-1-piperidinacarboxilato.

45 ^1H RMN (CDCl_3) δ 1,41 (t, 3H), 1,48 (s, 9H), 2,09 (m, 2H), 2,29 (m, 2H), 2,94 (m, 2H), 4,30 (m, 2H), 4,39 (q, 2H), 5,27 (m, 1H), 8,13 (s, 1H).

Etapa B: Preparación de 2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-2H-1,2,3-triazol -4-carboxilato de etilo

Se añadió ácido trifluoroacético (3 ml) a 4-[4-(etoxicarbonil)-2H-1,2,3-triazol-2-il]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo (0,41 g, 1,3 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 32, Etapa A). La mezcla de reacción se agitó durante 45 minutos. La mezcla de reacción después se concentró al vacío. La mezcla resultante se trató con bicarbonato de

50

sodio acuoso saturado y la capa acuosa se extrajo tres veces con diclorometano. El disolvente se eliminó con un evaporador rotatorio para producir 0,23 g de 4-piperidinil-2H-1,2,3-triazol-4-carboxilato de etilo como un aceite. Este compuesto tenía pureza suficiente para ser utilizado en reacciones posteriores.

- 5 A una suspensión de ácido 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acético (0,23 g, 1,1 mmol) en diclorometano (5 ml) se añadió cloruro de oxalilo (0,20 ml, 1,4 mmol) y una gota de N,N-dimetilformamida. Después de 45 minutos la mezcla de reacción se concentró al vacío y el residuo resultante se disolvió en diclorometano (10 ml). La mezcla de reacción después se añadió a una solución de 4-piperidinil-2H-1,2,3-triazol-4-carboxilato de etilo (0,23 g) y trietilamina (0,20 ml, 1,4 mmol) en diclorometano (10 ml) a 0 °C. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. La capa orgánica se lavó con bicarbonato de sodio acuoso saturado, se secó (Na₂SO₄) y el disolvente se eliminó con un evaporador rotatorio. El residuo se purificó por cromatografía líquida de media presión (MPLC) utilizando 35 a 60 % acetato de etilo en hexanos como eluyente para producir 0,35 g del compuesto del título como un sólido blanco.

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,41 (t, 3H), 2,23 (m, 4H), 2,33 (s, 3H), 3,09 (m, 1H), 3,40 (m, 1H), 4,10 (m, 1H), 4,43 (q, 2H), 4,45 (m, 1H), 4,80 (m, 1H), 5,00 (m, 2H), 6,34 (s, 1H), 8,06 (s, 1H).

- 15 Etapa C: Preparación de ácido 2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-2H-1,2,3-triazol-4-carboxílico

- 20 2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-2H-1,2,3-triazol-4-carboxilato de etilo (0,35 g, 0,82 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 32, Etapa B) se disolvió en una mezcla de metanol (5 ml) y tetrahidrofurano (2 ml). Una solución acuosa 1 N de hidróxido de sodio (1,6 ml, 1,6 mmol) se añadió a la mezcla de reacción y la mezcla se agitó durante toda la noche. La mezcla de reacción se concentró al vacío y el residuo se disolvió en agua. La capa acuosa se lavó con éter dietílico y la capa acuosa se acidificó con ácido clorhídrico concentrado hasta pH 1, y se extrajo con diclorometano y después cloroformo. Las capas orgánicas combinadas se secaron (Na₂SO₄) y se concentraron al vacío para producir 0,27 g del compuesto del título como un sólido blanco.

¹H RMN (CDCl₃) δ 2,23 (m, 4H), 2,33 (s, 3H), 3,10 (m, 1H), 3,41 (m, 1H), 4,08 (m, 1H), 4,45 (m, 1H), 4,81 (m, 1H), 5,02 (m, 2H), 6,37 (s, 1H), 8,13 (s, 1H).

- 25 Etapa D: Preparación de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-2H-1,2,3-triazol-4-carboxamida

- 30 A una suspensión de ácido 2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-2H-1,2,3-triazol-4-carboxílico (0,070 g, 0,18 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 32, Etapa C) en diclorometano (2 ml) se añadió cloruro de oxalilo (0,05 ml, 0,35 mmol) y una gota de N,N-dimetilformamida. Después de 45 minutos la mezcla de reacción se concentró al vacío y el residuo resultante se disolvió en diclorometano (10 ml). La mezcla de reacción después se añadió a una solución de (R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilamina (32 mg, 0,20 mmol) y trietilamina (0,033 ml, 0,24 mmol) en diclorometano (2 ml) a 0 °C. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. La capa orgánica se lavó con bicarbonato de sodio acuoso saturado, se secó (Na₂SO₄) y el disolvente se eliminó con un evaporador rotatorio. El residuo se purificó por cromatografía líquida de media presión (MPLC) utilizando 35-60 % de acetato de etilo en hexanos como eluyente para producir 74 mg del producto del título, un compuesto de la presente invención como un aceite.

¹H RMN (CDCl₃) δ 1,8-2,3 (m, 8H), 2,31 y 2,33 (2s, total 3H), 2,86 (m, 2H), 2,81 y 3,01 (2s, total 3H), 3,13 (m, 1H), 3,40 (m, 1H), 3,98 y 4,07 (2m, total 1H), 4,32 y 4,42 (2m, total 1H), 4,71 y 4,75 (2m, total 1H), 5,02 (m, 2H), 5,83 y 6,08 (2m, total 1H), 6,34 y 6,34 (s y d, total 1H), 7,30 (m, 4H), 8,06 y 8,11 (2s, total 1H).

40 EJEMPLO 33

Preparación de N-metil-1-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-1H-pirazol-4-carboxamida (Compuesto 233)

Etapa A: Preparación de 4-[4-(etoxicarbonil)-1H-pirazol-1-il]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo

- 45 Mediante un procedimiento análogo a aquel del Ejemplo 32 Etapa A, 4-hidroxipiperidina-1-carboxilato de t-butilo (0,79 g, 3,6 mmol) se hizo reaccionar con trifetilfosfina (1,26 g, 4,8 mmol), azodicarboxilato de dietilo (0,76 ml, 4,8 mmol) y 1H-pirazol-4-carboxilato de etilo (0,50 g, 3,6 mmol) para producir el compuesto del título (0,76 g) como un sólido blanco.

¹H RMN (acetona-d₆) δ 1,29 (t, 3H), 1,46 (s, 9H), 1,93 (m, 2H), 2,07 (m, 2H), 2,95 (m, 2H), 4,20 (m, 2H), 4,25 (q, 2H), 4,46 (m, 1H), 7,82 (s, 1H), 8,19 (s, 1H).

Etapa B: Preparación de 1-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-1H-pirazol-4-carboxilato de etilo

Mediante un procedimiento análogo a aquel del Ejemplo 32 Etapa B, 4-[4-(etoxicarbonil)-1H-pirazol-1-il]-1-piperidinacarboxilato de 1,1-dimetiletilo (0,38 g, 1,2 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 33, Etapa A) se desprotegió con ácido trifluoroacético (4 ml) para producir la correspondiente amina (0,18 g). Esta amina se hizo reaccionar con el cloruro de ácido formado a partir de ácido 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acético (0,18 g, 0,88 mmol) y cloruro de oxalilo (0,10 ml, 1,15 mmol) en presencia de trietilamina (0,16 ml, 1,15 mmol) para producir 0,24 g del compuesto del título como un sólido blanco.

^1H RMN (CDCl_3) δ 1,35 (t, 3H), 1,95 (m, 2H), 2,24 (m, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,90 (m, 1H), 3,32 (m, 1H), 4,13 (m, 1H), 4,30 (q, 2H), 4,37 (m, 1H), 4,63 (m, 1H), 4,99 (s, 2H), 6,34 (s, 1H), 7,91 (s, 1H), 7,92 (s, 1H).

Etapa C: Preparación de ácido 1-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-1H-pirazol-4-carboxílico

Mediante un procedimiento análogo a aquel del Ejemplo 32 Etapa C, 2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-2H-1,2,3-triazol-4-carboxilato de etilo (0,24 g, 0,58 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 33, Etapa B) se hidrolizó con hidróxido de sodio acuoso 1N (1,2 ml, 1,2 mmol) para producir 0,125 g del compuesto del título como un sólido blanco.

^1H RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ 1,82 (m, 1H), 2,07 (m, 3H), 2,21 (s, 3H), 2,83 (m, 1H), 3,26 (m, 1H), 4,00 (d, 1H), 4,39 (d, 1H), 4,52 (m, 1H), 5,29 (m, 2H), 6,50 (s, 1H), 7,82 y 7,90 (dos s, total 1H), 8,30 y 8,42 (dos s, total 1H).

Etapa D: Preparación de N-metil-1-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-1H-pirazol-4-carboxamida

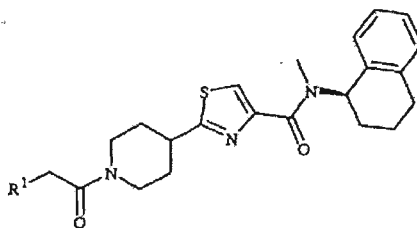
Mediante un procedimiento análogo a aquel del Ejemplo 32, Etapa D, ácido 1-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il] acetil]-4-piperidinil]-1H-pirazol-4-carboxílico (0,081 g, 0,21 mmol) (es decir el producto del Ejemplo 33, Etapa C) se hizo reaccionar con cloruro de oxalilo (0,05 ml) y el producto resultante se hizo reaccionar con (R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilamina (0,038 g, 0,23 mmol) y trietilamina (0,038 ml, 0,27 mmol) para producir 0,073 g del compuesto del título, un compuesto de la presente invención como un aceite después de la purificación por cromatografía líquida de presión media.

^1H RMN (CDCl_3) δ 1,8-2,3 (m, 8H), 2,33 y 2,34 (dos s, total 3H), 2,82 (m, 3H), 2,78 y 2,92 (dos s, total 3H), 3,31 (m, 1H), 4,00 (m, 1H), 4,37 (m, 1H), 4,64 (m, 1H), 5,00 (m, 2H), 5,36 y 6,02 (dos m, total 1H), 6,34 (s, 1H), 7,19 (m, 4H), 7,68 y 7,80 (dos s, total 1H), 7,80 y 7,93 (dos s, total 1H).

Mediante los procedimientos que se describen en la presente memoria, junto con los procedimientos conocidos en el arte, pueden prepararse los siguientes compuestos de las Tablas 1A a 10. Se utilizan las siguientes abreviaturas en las Tablas: t significa terciario, s significa secundario, n significa normal, i significa iso, c significa ciclo, Ac significa acetilo, Me significa metilo, Et significa etilo, Pr significa propilo, i-Pr significa isopropilo, c-Pr significa ciclopropilo, Bu significa butilo, Pen significa pentilo, Hex significa hexilo, CN significa ciano, Un guión (-) indica ningún sustituyente.

La invención incluye pero no se limita a las siguientes especies ilustrativas.

TABLA 1A

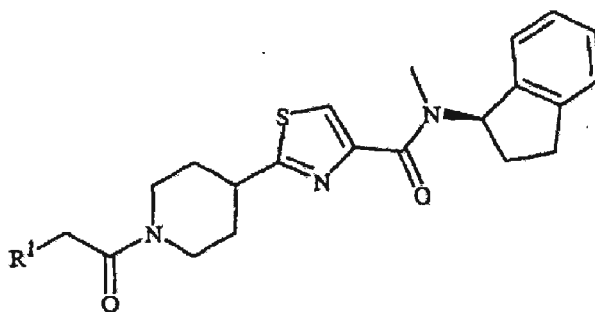


<u>R1</u>	<u>R1</u>
fenilo	3-cianofenilo
2-metilfenilo	3-nitrofenilo
2-metoxifenilo	2,5-diclorofenilo
2-clorofenilo	5-bromo-2-clorofenilo
2-bromofenilo	2-cloro-5-yodofenilo
2-etilfenilo	2-cloro-5-metilfenilo
2-etoxifenilo	2-cloro-5-etilfenilo
2-(metiltio)fenilo	2-cloro-5-propilfenilo
2-(etiltio)fenilo	2-cloro-5-isopropilfenilo
2-(trifluorometoxi)fenilo	2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo
3-clorofenilo	2-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
3-bromofenilo	2-cloro-5-(pentafluoroetil)fenilo
3-yodofenilo	2-cloro-5-cianofenilo
3-metilfenilo	2-cloro-5-nitrofenilo
3-etilfenil 3-etilfenilo	2-bromo-5-clorofenilo
3-propilfenilo	2,5-dibromofenilo
3-isopropilfenilo	2-bromo-5-yodofenilo
3-(trifluorometil)fenilo	2-bromo-5-metilfenilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-bromo-5-etilfenilo
3-(pentafluoroetil)fenilo	2-bromo-5-propilfenilo
2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo	2-bromo-5-isopropilfenilo
2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2,5-dietilfenilo
2-bromo-5-(pentafluoroetil)fenilo	2-etil-5-propilfenilo
2-bromo-5-cianofenilo	2-etil-5-isopropilfenilo
2-bromo-5-nitrofenilo	2-etil-5-(trifluorometil)fenilo
5-cloro-2-metilfenilo	2-etil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
5-bromo-2-metilfenilo	2-etil-5-(pentafluoroetil)fenilo
5-yodo-2-metilfenilo	5-ciano-2-etilfenilo
2,5-dimetilfenilo	2-etil-5-nitrofenilo
5-etil-2-metilfenilo	3-metilpirazol-1-ilo
2-metil-5-propilfenilo	3-cloropirazol-1-ilo
5-isopropil-2-metilfenilo	3-bromopirazol-1-ilo
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	3-yodopirazol-1-ilo
2-metil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	3-etilpirazol-1-ilo
2-metil-5-(pentafluoroetil)fenilo	3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-ciano-2-metilfenilo	3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
2-metil-5-nitrofenilo	3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
5-cloro-2-metoxifenilo	3-cianopirazol-1-ilo
5-bromo-2-metoxifenilo	3-nitropirazol-1-ilo
5-yodo-2-metoxifenilo	3,5-dimetilpirazol-1-ilo
2-metoxi-5-metilfenilo	3-cloro-5-metilpirazol-1-ilo
5-etil-2-metoxifenilo	3-bromo-5-metilpirazol-1-ilo
2-metoxi-5-propilfenilo	3-yodo-5-metilpirazol-1-ilo
5-isopropil-2-metoxifenilo	3-etil-5-metilpirazol-1-ilo
2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo	5-metil-3-propilpirazol-1-ilo
2-metoxi-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	3-isopropil-5-metilpirazol-1-ilo
2-metoxi-5-(pentafluoroetil)fenilo	5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-ciano-2-metoxifenilo	5-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
2-metoxi-5-nitrofenilo	5-metil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
5-cloro-2-etilfenilo	3-ciano-5-metilpirazol-1-ilo

5-bromo-2-etilfenilo	5-metil-3-nitropirazol-1-ilo
2-etil-5-yodofenilo	5-cloro-3-metilpirazol-1-ilo
2-etil-5-metilfenilo	3,5-dicloropirazol-1-ilo
5-cloro-3-yodopirazol-1-ilo	5-cloro-3-bromopirazol-1-ilo
5-cloro-3-etilpirazol-1-ilo	3-ciano-5-etilpirazol-1-ilo
5-cloro-3-propilpirazol-1-ilo	5-etil-3-nitropirazol-1-ilo
5-cloro-3-isopropilpirazol-1-ilo	5-butil-2-metilfenilo
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	5-hexil-2-metilfenilo
5-cloro-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	5-allyl-2-metilfenilo
5-cloro-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	2-metil-5-(4-metil-3-pentenil)fenilo
5-cloro-3-cianopirazol-1-ilo	2-metil-5-propargylfenilo
5-cloro-3-nitropirazol-1-ilo	2-metil-5-(3-metilpropargyl)fenilo
5-bromo-3-metilpirazol-1-ilo	5-ciclopropil-2-metilfenilo
5-bromo-3-cloropirazol-1-ilo	5-ciclohexil-2-metilfenilo
3,5-dibromopirazol-1-ilo	2-metil-5-(pentafluoroisopropil)fenilo
5-bromo-3-yodopirazol-1-ilo	5-(3,3-dicloro-2-propen-1-il)-2-metilfenilo
5-bromo-3-etilpirazol-1-ilo	2-metil-5-(4,4,4-trifluoro-2-butin-1-il)fenilo
5-bromo-3-propilpirazol-1-ilo	5-(2,2-diclorociclopropan-1-il)-2-metilfenilo
5-bromo-3-isopropilpirazol-1-ilo	2-metil-5-(trifluorometoxi)fenilo
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2-cloro-5-(isobutiltio)fenilo
5-bromo-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	2-cloro-5-(etilsulfonil)fenilo
5-bromo-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	2-cloro-5-(trifluorometiltio)fenilo
5-bromo-3-cianopirazol-1-ilo	2-cloro-5-(trifluorometilsulfonil)fenilo
5-bromo-3-nitropirazol-1-ilo	2-cloro-5-(metilamino)fenilo
5-metoxi-3-metilpirazol-1-ilo	2-cloro-5-(tert-butilamino)fenilo
3-cloro-5-metoxipirazol-1-ilo	2-cloro-5-(dimetilamino)fenilo
5-etil-3-metilpirazol-1-ilo	2-cloro-5-9dietilamino)fenilo
3-cloro-5-etilpirazol-1-ilo	2-cloro-5-(ciclopropilamino)fenilo
3-bromo-5-etilpirazol-1-ilo	3-(metoximetil)fenilo
5-etil-3-yodopirazol-1-ilo	2-cloro-5-(etoximetil)fenilo
3,5-dietilpirazol-1-ilo	2-cloro-5-(hyroximetil)fenilo
5-etil-3-propilpirazol-1-ilo	2-cloro-5-(metoxicarbonil)fenilo
5-etil-3-isopropilpirazol-1-ilo	2-cloro-5-(etilcarbonil)fenilo
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2-cloro-5-(metilcarboniloxi)fenilo
5-etil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	2-cloro-5-(metylaminocarbonil)fenilo
5-etil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-il	2-cloro-5-(dimetilaminocarbonil)fenilo
3,5-dimetil-2-tienilo	2-metil-5-(trimetilsilyl)fenilo
3,5-dicloro-2-tienilo	2,5-dimetil-4-tiazolilo
3,5-dimetil-2-furilo	3-bromo-4-isotiazolilo
1-metil-2-pirrolilo	3-bromo-4-isooxazolilo
4-metil-2-trifluorometil-5-tiazolilo	1-metil-4-imidazolilo
4--trifluorometil-2-tiazolilo	5-trifluorometil-3-(1,2,4-oxadiazolilo)
4-trifluorometil-2-oxazolilo	5-trifluorometil-3-(1,2,4-tiadiazolilo)
4-metil-2-trifluorometil-5-oxazolilo	2-bromo-1-(1,3,4-triazolilo)
4-bromo-5-isotiazolilo	5-trifluorometil-3-(1,2,4-triazolilo)
4-bromo-5-isoxazolilo	2-bromo-1-imidazolilo
1-metil-5-pirazolilo	3,6-dimetil-2-piridilo
1-metil-5-imidazolilo	2,5-dimetil-3-piridilo
1-metil-4-trifluorometil-2-imidazolilo	2,5-dimetil-4-piridilo
4-metil-3-(1,3,4-triazolilo)	3,6-dicloro-2-piridilo
2-metil-3-(1,2,4-triazolilo)	2,5-dicloro-3-piridilo

5-trifluorometil-2-(1,3,4-tiadiazolilo) 5-trifluorometil-2-(1,3,4-oxadiazolilo) 3-trifluorometil-5-(1,2,4-tiadiazolilo) 3-trifluorometil-5-(1,2,4-oxadiazolilo) 3-trifluorometil-1-(1,2,4-hiazolilo) 2,5-dimetil-1-pirrolilo 2,5-dimetil-3-furilo 2,5-dimetil-3-tienilo 2,5-dicloro-3-tienilo 1,4-dimetil-3-pirrolilo 1,4-dimetil-3-pirazolilo 1,3-dimetil-4-pirazolilo 2,5-dimetil-4-oxazolilo	2,5-dicloro-4-piridilo 4-bromo-3-piridazinilo 4-trifluorometil-2-pirimidinilo 3,6-dimetil-2-pirazinilo 2,5-dimetil-4-pirimidinilo 4-metoksi-5-pirimidinilo 3,6-dimetil-4-piridazinilo 5-trifluorometil-3-(1,2,4-triazinilo) 5-metoksi-6-(1,2,4-triazinilo) 4-trifluorometil-2-(1,3,5-triazinilo) 3,6-dimetil-5-(1,2,4-triazinilo) 3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo 1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo 1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo
---	---

TABLA 1B

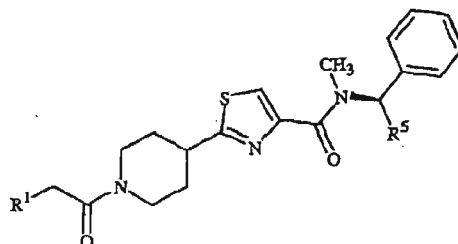


<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-motoxifenilo	2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo
3-bromofenilo	2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
3-yodofenilo	2-bromo-5-(pentafluoroetil)fenilo
3-(trifluorometil)fenilo	2-bromo-5-cianofenilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-bromo-5-nitrofenilo
3-(pentafluoroetil)fenilo	5-cloro-2-metilfenilo
3-cianofenilo	5-bromo-2-metilfenilo
3-nitrofenilo	5-yodo-2-metilfenilo
2,5-diclorofenilo	2,5-dimetilfenilo

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
5-bromo-2-clorofenilo	5-etil-2-metilfenilo
2-cloro-5-yodofenilo	2-metil-5-propilfenilo
2-cloro-5-metilfenilo	5-isopropil-2-metilfenilo
2-cloro-5-etilfenilo	2-metil-5-(trifluorometil)fenilo
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	2-metil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-metil-5-(pentafluoroetil)fenilo
2-cloro-5-(pentafluoroetil)fenilo	5-ciano-2-metilfenilo
2-cloro-5-cianofenilo	2-metil-5-nitrofenilo
2-cloro-5-nitrofenilo	5-cloro-2-metoxifenilo
2-bromo-5-clorofenilo	5-bromo-2-metoxifenilo
2,5-dibromofenilo	5-yodo-2-metoxifenilo
2-bromo-5-yodofenilo	2-metoxi-5-metilfenilo
2-bromo-5-metilfenilo	5-etil-2-metoxifenilo
2-bromo-5-etilfenilo	2-metoxi-5-propilfenilo
2-bromo-5-propilfenilo	2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo
2-metoxi-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	5-cloro-3-metilpirazol-1-ilo
2-metoxi-5-(pentafluoroetil)fenilo	3,5-dicloropirazol-1-ilo
5-ciano-2-metoxifenilo	5-chlo-3-bromomopirazol-1-ilo
2-metoxi-5-nitrofenilo	5-cloro-3-yodopirazol-1-ilo
5-cloro-2-etilfenilo	5-cloro-3-etilpirazol-1-ilo
5-bromo-2-etilfenilo	5-cloro-3-propilpirazol-1-ilo
2-etil-5-yodofenilo	5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
2-thyl-5-metilfenilo	5-cloro-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
2,5-dietilfenilo	5-cloro-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
2-etil-5-propilfenilo	5-cloro-3-cianopirazol-1-ilo
2-etil-5-(trifluorometil)fenilo	5-cloro-3-nitropirazol-1-ilo
2-etil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	5-bromo-3-metilpirazol-1-ilo
2-etil-5-(pentafluoroetil)fenilo	5-bromo-3-cloropirazol-1-ilo
5-ciano-2-etilfenilo	3,5-dibromopirazol-1-ilo
2-etil-5-nitrofenilo	5-bromo-3-yodopirazol-1-ilo
3-cloropirazol-1-ilo	5-bromo-3-etilpirazol-1-ilo
3-bromopirazol-1-ilo	5-bromo-3-propilpirazol-1-ilo
3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
3-cianopirazol-1-1-ilo	5-etil-3-metilpirazol-1-ilo
3-nitropirazol-1-ilo	3-cloro-5-etilpirazol-1-ilo
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	3-bromo-5-etilpirazol-1-ilo
3-cloro-5-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-yodopirazol-1-ilo
3-bromo-5-metilpirazol-1-ilo	3,5-dietilpirazol-1-ilo
3-yodo-5-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-propilpirazol-1-ilo
3-etil-5-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-metil-3-propilpirazol-1-ilo	5-etil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	5-etil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
5-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	3,5-dimetil-2-tienilo
5-metil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	3,5-dicloro-2-tienilo
3-ciano-5-metilpirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-tienilo
5-metil-3-nitropirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-tienilo
3,6-dimetil-2-piridilo	2,5-dicloro-4-piridilo
2,5-dimetil-3-piridilo	3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2,5-dimetil-4-piridilo	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo
3,6-dicloro-2-piridilo	1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo
2,5-dicloro-3-piridilo	

TABLA 1C



<u>R¹</u>	<u>R^o</u>
2-metoxifenilo	Et
3-bromofenilo	Et
3-yodofenilo	Et
3-(trifluorometil)fenilo	Et
3-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	Et
3-(pentafluorometil)fenilo	Et
3-cianofenilo	Et
3-nitrofenilo	Et
2,5-diclorofenilo	Et
5-bromo-2-clorofenilo	Et
2-cloro-5-yodofenilo	Et
2-cloro-5-metilfenilo	Et
2-cloro-5-etilfenilo	Et
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	Et
2-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	Et
2-cloro-5-(pentafluoroetil)fenilo	Et
2-cloro-5-cianofenilo	Et
2-cloro-nitrofenilo	Et
2-bromo-5-clorofenilo	Et
2,5-dibromofenilo	Et
2-bromo-5-yodofenilo	Et
2-bromo-5-metilfenilo	Et
2-bromo-5-etilfenilo	Et
2-bromo-5-propilfenilo	Et
2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo	Et
2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	Et
2-bromo-5-(pentafluoroetil)fenilo	Et
2-bromo-5-cianofenilo	Et
2-bromo-5-nitrofenilo	Et
5-cloro-2-metilfenilo	Et
5-bromo-2-metilfenilo	Et
5-yodo-2-metilfenilo	Et

<u>R¹</u>	<u>R⁵</u>
2,5-dimetilfenilo	Et
5-etil-2-metilfenilo	Et
2-metil-5-propilfenilo	Et
5-isopropil-2-metilfenilo	Et
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	Et
2-metil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	Et
2-metil-5-(pentafluoroetil)fenilo	Et
5-ciano-2-metilfenilo	Et
2-metil-5-nitrofenilo	Et
5-cloro-2-metoxifenilo	Et
5-bromo-2-metoxifenilo	Et
5-yodo-2-metoxifenilo	Et
2-metoksi-5-metilfenilo	Et
5-etil-2-metoxifenilo	Et
2-metoksi-5-propilfenilo	Et
2-metoksi-5-(trifluorometil)fenilo	Et
2-metoksi-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	Et
2-metoksi-5-(pentafluoroetil)fenilo	Et
5-ciano-2-metoxifenilo	Et
2-metoksi-5-nitrofenilo	Et
5-cloro-2-etilfenilo	Et
5-bromo-2-etilfenilo	Et
2-etil-5-yodofenilo	Et
2-etil-5-metilfenilo	Et
2,5-dietilfenilo	Et
2-etil-5-propilfenilo	Et
2-etil-5-(trifluorometil)fenilo	Et
2-etil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	Et
2-etil-5-(pentafluoroetil)fenilo	Et
5-ciano-2-etilfenilo	Et
2-etil-5-nitrofenilo	Et
3-cloropirazol-1-ilo	Et
3-bromopirazol-1-ilo	Et
3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	Et
3-(2,2,2-trifluoroetil)-pirazol-1-ilo	Et
3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	Et
3-cianopirazol-1-ilo	Et
3-nitropirazol-1-ilo	Et
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	Et
3-cloro-5-metilpirazol-1-ilo	Et
3-bromo-5-metilpirazol-1-ilo	Et
3-yodo-5-metilpirazol-1-ilo	Et
3-etil-5-metilpirazol-1-ilo	Et
5-metil-3-propilpirazol-1-ilo	Et
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	Et
5-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	Et
5-metil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	Et
3-ciano-5-metilpirazol-1-ilo	Et
5-metil-3-nitropirazol-1-ilo	Et
5-cloro-3-metilpirazol-1-ilo	Et

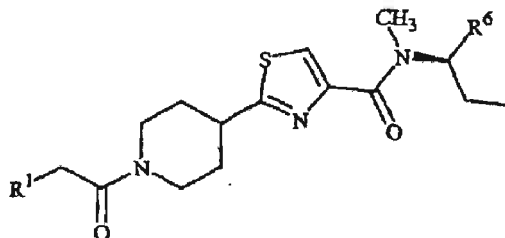
<u>R¹</u>	<u>R^o</u>
3,5-dicloropirazol-1-ilo	Et
5-cloro-3-bromopirazol-1-ilo	Et
5-cloro-3-yodopirazol-1-ilo	Et
5-cloro-3-etilpirazol-1-ilo	Et
5-cloro-3-propilpirazol-1-ilo	Et
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	Et
5-cloro-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	Et
5-cloro-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	Et
5-cloro-3-cianopirazol-1-ilo	Bt
5-cloro-3-nitropirazol-1-ilo	Et
5-bromo-3-metilpirazol-1-ilo	Et
5-bromo-3-cloropirazol-1-ilo	Et
3,5-dibromopirazol-1-ilo	Et
5-bromo-3-yodopirazol-1-ilo	Et
5-bromo-3-etilpirazol-1-ilo	Et
5-bromo-3-propilpirazol-1-ilo	Et
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	Et
5-bromo-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	Et
5-bromo-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	Et
5-etil-3-metilpirazol-1-ilo	Et
3-cloro-5-etilpirazol-1-ilo	Et
3-bromo-5-etilpirazol-1-ilo	Et
5-etil-3-yodopirazol-1-ilo	Et
3,5-dietilpirazol-1-ilo	Et
5-etil-3-propilpirazol-1-ilo	Et
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	Et
5-etil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	Et
5-etil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	Et
3,5-dimetil-2-tienilo	Et
3,5-dicloro-2-tienilo	Et
2,5-dimetil-3-tienilo	Et
2,5-dicloro-3-tienilo	Et
3,6-dimetil-2-piridilo	Et
2,5-dimetil-3-piridilo	Et
2,5-dimetil-4-piridilo	Et
3,6-dicloro-2-piridilo	Et
2,5-dicloro-3-piridilo	Et
2,5-dicloro-4-piridilo	Et
2-metoxifenilo	Me
2,5-diclorofenilo	Me
5 bromo-2-clorofenilo	Me
2-cloro-5-metilfenilo	Me
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	Me
2,5-dibromofenilo	Me
2-bromo-5-metilfenilo	Me
2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo	Me
5-cloro-2-metilfenilo	Me
5-bromo-2-metilfenilo	Me
2,5-dimetilfenilo	Me
5-etil-2-metilfenilo	Me

<u>R¹</u>	<u>R⁵</u>
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	Me
5-bromo-2-metoxifenilo	Me
2-metossi-5-metilfenilo	Me
2-metossi-5-(trifluorometil)fenilo	Me
3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	Me
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	Me
3-etil-5-metilpirazol-1-ilo	Me
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	Me
3,5-dicloropirazol-1-ilo	Me
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	Me
3,5-di-bromopirazol-1-ilo	Me
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	Me
3,5-dietilpirazol-1-ilo	Me
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	Me
2-metoxifenilo	n-Pr
2,5-diclorofenilo	n-Pr
5-bromo-2-clorofenilo	n-Pr
2-cloro-5-metilfenilo	n-Pr
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	n-Pr
2,5-dibromofenilo	n-Pr
2-bromo-5-metilfenilo	n-Pr
2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo	n-Pr
5-cloro-2-metilfenilo	n-Pr
5-bromo-2-metilfenilo	n-Pr
2,5-dimetilfenilo	n-Pr
5-etil-2-metilfenilo	n-Pr
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	n-Pr
5-bromo-2-metoxifenilo	n-Pr
2-metossi-5-metilfenilo	n-Pr
2-metossi-5-(trifluorometil)fenilo	n-Pr
3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	n-Pr
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	n-Pr
3-etil-5-metilpirazol-1-ilo	n-Pr
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	n-Pr
3,5-dicloropirazol-1-ilo	n-Pr
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	n-Pr
3,5-dibromopirazol-1-ilo	n-Pr
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	n-Pr
3,5-dietilpirazol-1-ilo	n-Pr
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	n-Pr
2-metoxifenilo	CN
2,5-diclorofenilo	CN
5-bromo-2-clorofenilo	CN
2-cloro-5-metilfenilo	CN
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	CN
2,5-dibromofenilo	CN
2-bromo-5-metilfenilo	CN
2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo	CN
5-cloro-2-metilfenilo	CN
5-bromo-2-metilfenilo	CN

<u>R¹</u>	<u>R^o</u>
2,5-dimetilfenilo	CN
5-etil-2-metilfenilo	CN
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	CN
5-bromo-2-metoxifenilo	CN
2-metoxi-5-metilfenilo	CN
2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo	CN
3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	CN
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	CN
3-etil-5-metilpirazol-1-ilo	CN
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	CN
3,5-dichloropirazol-1-ilo	CN
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	CN
3,5-dibromopirazol-1-ilo	CN
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	CN
3,5-dietilpirazol-1-ilo	CN
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	CN
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	i-Pr
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	n-Bu
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	i-Bu
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	n-Pen
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	n-Hex
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	etenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	etinilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-metil-3-penten-1-ilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	c-Pr
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	c-Bu
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	c-Pen
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	c-Hex
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	trifluorometilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2,2,2-trifluoroetilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	3,3-dicloro-2-propen-1-ilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	etenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	propinilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	metiletinilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	trifluorometiletinilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2,2-diclorocicloprop-1-ilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	nitro
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	metoximetilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	metoxietilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1-metoxietilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2-metoxietilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	hidroximetilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	acetilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	isobutirilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	metoxicarbonilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	etoxicarbonilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	metilaminocarbonilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	dimetilaminocarbonilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	trimetilsitilo
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	Et

<u>R¹</u>	<u>R⁵</u>
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-il	Et
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-il	Et

TABLA 1D



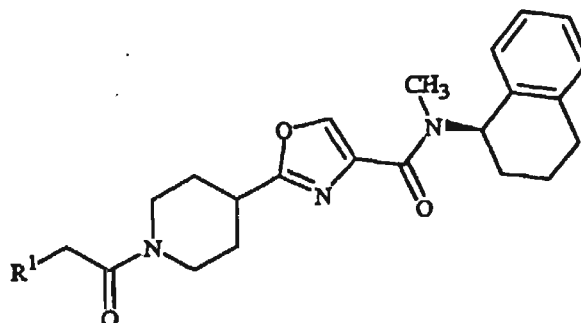
<u>R¹</u>	<u>R⁶</u>
2-metoxifenilo	2-metilfenilo
2,5-diclorofenilo	2-metilfenilo
5-bromo-2-clorofenilo	2-metilfenilo
2-cloro-5-metilfenilo	2-metilfenilo
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	2-metilfenilo
2,5-dibromofenilo	2-metilfenilo
2-bromo-5-metilfenilo	2-metilfenilo
2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo	2-metilfenilo
5-cloro-2-metilfenilo	2-metilfenilo
5-bromo-2-metilfenilo	2-metilfenilo
2,5-dimetilfenilo	2-metilfenilo
5-etil-2-metilfenilo	2-metilfenilo
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	2-metilfenilo
5-bromo-2-metoxifenilo	2-metilfenilo
2-metoxi-5-metilfenilo	2-metilfenilo
2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo	2-metilfenilo
3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2-metilfenilo
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	2-metilfenilo
3-etil-5-metilpirazol-1-ilo	2-metilfenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2-metilfenilo
3,5-dicloropirazol-1-ilo	2-metilfenilo
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2-metilfenilo
3,5-dibromopirazol-1-ilo	2-metilfenilo
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2-metilfenilo
3,5-dietilpirazol-1-ilo	2-metilfenilo
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2-metilfenilo
2-metoxifenilo	4-metilfenilo
2,5-diclorofenilo	4-metilfenilo
5-bromo-2-clorofenilo	4-metilfenilo
2-cloro-5-metilfenilo	4-metilfenilo
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	4-metilfenilo
2,5-dibromofenilo	4-metilfenilo
2-bromo-5-metilfenilo	4-metilfenilo
2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo	4-metilfenilo
5-cloro-2-metilfenilo	4-metilfenilo

<u>R¹</u>	<u>R⁶</u>
5-bromo-2-metilfenilo	4-metilfenilo
2,5-dimetilfenilo	4-metilfenilo
5-etil-2-metilfenilo	4-metilfenilo
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	4-metilfenilo
5-bromo-2-metoxifenilo	4-metilfenilo
2-metoxi-5-metilfenilo	4-metilfenilo
2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo	4-metilfenilo
3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-metilfenilo
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	4-metilfenilo
3-etil-5-metilpirazol-1-ilo	4-metilfenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-metilfenilo
3,5-dicloropirazol-1-ilo	4-metilfenilo
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-metilfenilo
3,5-dibromopirazol-1-ilo	4-metilfenilo
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-metilfenilo
3,5-dietilpirazol-1-ilo	4-metilfenilo
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-metilfenilo
2-metoxifenilo	4-clorofenilo
2,5-diclorofenilo	4-clorofenilo
5-bromo-2-clorofenilo	4-clorofenilo
2-cloro-5-metilfenilo	4-clorofenilo
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	4-clorofenilo
2,5-dibromofenilo	4-clorofenilo
2-bromo-5-metilfenilo	4-clorofenilo
2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo	4-clorofenilo
5-cloro-2-metilfenilo	4-clorofenilo
5-bromo-2-metilfenilo	4-clorofenilo
2,5-dimetilfenilo	4-clorofenilo
5-etil-2-metilfenilo	4-clorofenilo
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	4-clorofenilo
5-bromo-2-metoxifenilo	4-clorofenilo
2-metoxi-5-metilfenilo	4-clorofenilo
2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo	4-clorofenilo
3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-clorofenilo
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	4-clorofenilo
3-etil-5-metilpirazol-1-ilo	4-clorofenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-clorofenilo
3,5-dicloropirazol-1-ilo	4-clorofenilo
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-clorofenilo
3,5-dibromopirazol-1-ilo	4-clorofenilo
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-clorofenilo
3,5-dietilpirazol-1-ilo	4-clorofenilo
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-clorofenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2-etilfenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-t-butilfenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-allylfenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-etinilfenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-ciclopropilfenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-(trifluorometil)fenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-(2-cloroetil)fenilo

<u>R¹</u>	<u>R^b</u>
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-bromoetilfenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-(2,2-diclorocicloprop-1-il)fenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2-fluorofenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	3-fluorofenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-fluorofenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2-clorofenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-bromofenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-hidroxifenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-aminofenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-cianofenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-nitrofenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-metoxifenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-(trifluorometoksi)fenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-(metiltio)fenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-(metilsulfonil)fenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-(metilsulfonil)fenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-(trifluorometiltio)fenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-(trifluorometilsulfonil)fenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-(metilamino)fenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-(dimetilamino)fenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-(ciclopropilamino)fenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2-(metoximetil)fenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	3,4-(dimetoksi)fenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-acetilfenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-(metoxicarbonil)fenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-(acetiloksi)fenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-(metilaminocarbonil)fenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-(dimetilaminocarbonil)fenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-(trimetilsilyl)fenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2,6-difluorofenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2,4,6-trifluorofenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2,3-dimetilfenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2,3-diclorofenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1-naftalenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2-tienilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2-furilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1-metil-2-pirrolilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	5-tiazolilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2-oxazolilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2-tiazolilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	5-oxazolilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	5-isotiazolilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	5-isoxazolilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1-metil-5-pirazolilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1-metil-5-imidazolilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1-metil-2-imidazolilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-metil-1,2,4-triazolil-3-ilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1-metil-1,2,3-triazolil-5-ilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1,3,4-oxadiazol-2-ilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1,3,4-tiadiazol-2-ilo

R^1	R^6
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1,2,4-oxadiazol-2-ilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1,2,4-tiadiazol-2-ilo

TABLA 2A

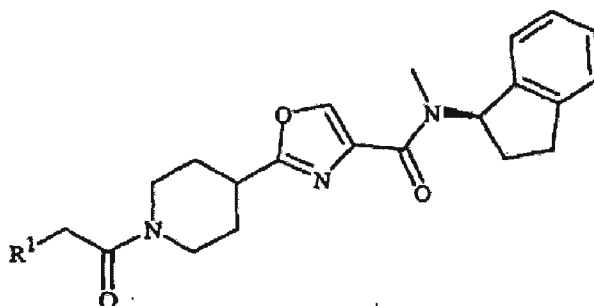


R^1	R^1
2-metoxifenilo	2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo
3-bromofenilo	2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
3-yodofenilo	2-bromo-5-(pentafluoroetil)fenilo
3-(trifluorometil)fenilo	2-bromo-5-cianofenilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-bromo-5-nitrofenilo
3-(pentafluoroetil)fenilo	5-cloro-2-metilfenilo
3-cianofenilo	5-bromo-2-metilfenilo
3-nitrofenilo	5-yodo-2-metilfenilo
2,5-diclorofenilo	2,5-dimetilfenilo
5-bromo-2-clorofenilo	5-etil-2-metilfenilo
2-cloro-5-yodofenilo	2-metil-5-propilfenilo
2-cloro-5-metilfenilo	5-isopropil-2-metilfenilo
2-cloro-5-etilfenilo	2-metil-5-(trifluorometil)fenilo
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	2-metil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-metil-5-(pentafluoroetil)fenilo
2-cloro-5-(pentafluoroetil)fenilo	5-ciano-2-metilfenilo
2-cloro-5-cianofenilo	2-metil-5-nitrofenilo
2-cloro-5-nitrofenilo	5-cloro-2-metoxifenilo
2-bromo-5-clorofenilo	5-bromo-2-metoxifenilo
2,5-dibromofenilo	5-yodo-2-metoxifenilo
2-bromo-5-yodofenilo	2-metoxi-5-metilfenilo
2-bromo-5-metilfenilo	5-etil-2-metoxifenilo
2-bromo-5-etilfenilo	2-metoxi-5-propilfenilo
2-bromo-5-propilfenilo	2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	3-tienilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	3-furilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1-metil-3-pirrolilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1-metil-3-pirazolilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1-metil-4-pirazolilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-oxazolilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-tiazolilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-isotiazolilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-isoxazolilo

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1-metil-4-imidazolilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1,2,4-oxadiazol-3-ilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1,2,4-tiadiazol-3-ilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1-metil-1,2,4-triazolil-3-ilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2-Piridilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	3,5-dicloro-2-piridilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	3-piridilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-piridilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	3-pirazinilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2-pirimidinilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2-piridazinilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-pirimidinilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	5-pirimidinilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	4-pirazinilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1,2,4-triazin-6-ilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1,2,4-triazin-3-ilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1,3,5-triazin-2-ilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1,2,4-triazin-5-ilo
2-metoksi-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	5-cloro-3-metilpirazol-1-ilo
2-metoksi-5-(pentafluoroetil)fenilo	3,5-dicloropirazol-1-ilo
5-ciano-2-metoxifenilo	5-cloro-3-bromopirazol-1-ilo
2-metoksi-5-nitrofenilo	5-cloro-3-yodopirazol-1-ilo
5-cloro-2-etilfenilo	5-cloro-3-etilpirazol-1-ilo
5-bromo-2-etilfenilo	5-cloro-3-propilpirazol-1-ilo
2-etil-5-yodofenilo	5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
2-etil-5-metilfenilo	5-cloro-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
2,5-dietilfenilo	5-cloro-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
2-etil-5-propilfenilo	5-cloro-3-cianopirazol-1-ilo
2-etil-5-(trifluorometil)fenilo	5-cloro-3-nitropirazol-1-ilo
2-etil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	5-bromo-3-metilpirazol-1-ilo
2-etil-5-(pentafluoroetil)fenilo	5-bromo-3-cloropirazol-1-ilo
5-ciano-2-etilfenilo	3,5-dibromopirazol-1-ilo
2-etil-5-nitrofenilo	5-bromo-3-yodopirazol-1-ilo
3-cloropirazol-1-ilo	5-bromo-3-etilpirazol-1-ilo
3-bromopirazol-1-ilo	5-bromo-3-propilpirazol-1-ilo
3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
3-cianopirazol-1-ilo	5-etil-3-metilpirazol-1-ilo
3-nitropirazol-1-ilo	3-cloro-5-etilpirazol-1-ilo
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	3-bromo-5-etilpirazol-1-ilo
3-cloro-5-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-yodopirazol-1-ilo
3-bromo-5-metilpirazol-1-ilo	3,5-dietilpirazol-1-ilo
3-yodo-5-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-propilpirazol-1-ilo
3-etil-5-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-metil-3-propilpirazol-1-ilo	5-etil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	5-etil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
5-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	3,5-dimetil-2-tienilo
5-metil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	3,5-dicloro-2-tienilo
3-ciano-5-metilpirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-tienilo

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
5-metil-3-nitropirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-tienilo
3,6-dimetil-2-piridilo	2,5-dicloro-4-piridilo
2,5-dimetil-3-piridilo	3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
2,5-dimetil-4-piridilo	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo
3,6-dicloro-2-piridilo	1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo
2,5-dicloro-3-piridilo	

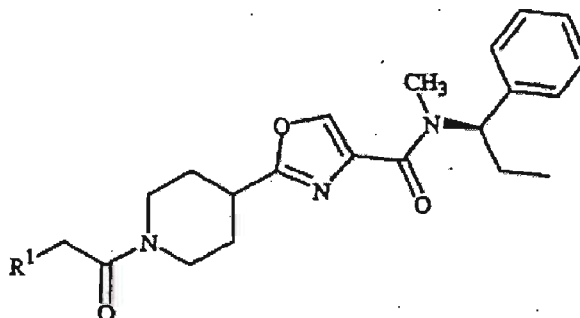
TABLA 2B



<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-metoxifenilo	2-bromo-5-clorofenilo
3-bromofenilo	2,5-dibromofenilo
3-yodofenilo	2-bromo-5-yodofenilo
3-(trifluorometil)fenilo	2-bromo-5-metilfenilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-bromo-5-etilfenilo
3-(pentafluoroetil)fenilo	2-bromo-5-propilfenilo
3-cianofenilo	2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo
3-nitrofenilo	2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2,5-diclorofenilo	2-bromo-5-(pentafluoroetil)fenilo
5-bromo-2-clorofenilo	2-bromo-5-cianofenilo
2-cloro-5-yodofenilo	2-bromo-5-nitrofenilo
2-cloro-5-metilfenilo	5-cloro-2-metilfenilo
2-cloro-5-etilfenilo	5-bromo-2-metilfenilo
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	5-yodo-2-metilfenilo
2-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2,5-dimetilfenilo
2-cloro-5-(pentafluoroetil)fenilo	5-etil-2-metilfenilo
2-cloro-5-cianofenilo	2-metil-5-propilfenilo
2-cloro-5-nitrofenilo	5-isopropil-2-metilfenilo
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	3-nitropirazol-1-ilo
2-metil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	3,5-dimetilpirazol-1-ilo
2-metil-5-(pentafluoroetil)fenilo	3-cloro-5-metilpirazol-1-ilo
5-ciano-2-metilfenilo	3-bromo-5-metilpirazol-1-ilo
2-metil-5-nitrofenilo	3-yodo-5-metilpirazol-1-ilo
5-cloro-2-metoxifenilo	3-etil-5-metilpirazol-1-ilo
5-bromo-2-metoxifenilo	5-metil-3-propilpirazol-1-ilo
5-yodo-2-metoxifenilo	5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
2-metoxi-5-metilfenilo	5-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
5-etil-2-metoxifenilo	5-metil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
2-metoxi-5-propilfenilo	3-ciano-5-metilpirazol-1-ilo

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo	5-metil-3-nitopirazol-1-ilo
2-metoxi-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	5-cloro-3-metilpirazol-1-ilo
2-metoxi-5-(pentafluoroetil)fenilo	3,5-dicloropirazol-1-ilo
5-ciano-2-metoxifenilo	5-cloro-3-bromopirazol-1-ilo
2-metoxi-5-nitrofenilo	5-cloro-3-yodopirazol-1-ilo
5-cloro-2-etilfenilo	5-cloro-3-etilpirazol-1-ilo
5-bromo-2-etilfenilo	5-cloro-3-propilpirazol-1-ilo
2-etil-5-yodofenilo	5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
2-etil-5-metilfenilo	5-cloro-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
2,5-dietilfenilo	5-cloro-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
2-etil-5-propilfenilo	5-cloro-3-cianopirazol-1-ilo
2-etil-5-(trifluorometil)fenilo	5-cloro-3-nitopirazol-1-ilo
2-etil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	5-bromo-3-metilpirazol-1-ilo
2-etil-5-(pentafluoroetil)fenilo	5-bromo-3-cloropirazol-1-ilo
5-ciano-2-etilfenilo	3,5-dibromopirazol-1-ilo
2-etil-5-nitrofenilo	5-bromo-3-yodopirazol-1-ilo
3-cloropirazol-1-ilo	5-bromo-3-etilpirazol-1-ilo
3-bromopirazol-1-ilo	5-bromo-3-propilpirazol-1-ilo
3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
3-cianopirazol-1-ilo	5-etil-3-metilpirazol-1-ilo
3-cloro-5-etilpirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-tienil
3-bromo-5-etilpirazol-1-ilo	3,6-dimetil-2-piridinilo
5-etil-3-yodopirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-piridinilo
3,5-dietilpirazol-1-ilo	2,5-dimetil-4-piridinilo
5-etil-3-propilpirazol-1-ilo	3,6-dicloro-2-piridinilo
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-piridinilo
5-etil-3-(2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	2,5-dicloro-4-piridinilo
5-etil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
3,5-dimetil-2-tienilo	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo
3,5-dicloro-2-tienilo	1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo
2,5-dimetil-3-tienilo	

TABLA 2C

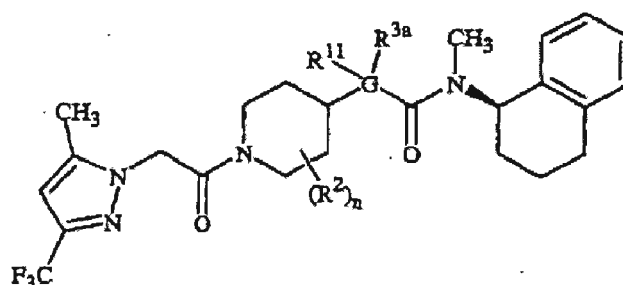


<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-metoxifenilo	2,5-dimetilfenilo
3-bromofenilo	

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
3-yodofenilo	2-metil-5-propilfenilo
3-(difluorometil)fenilo	5-isopropil-2-metilfenilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-metil-5-(trifluorometil)fenilo
3-(pentafluoroetil)fenilo	2-metil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
3-cianofenilo	2-metil-5-(pentafluoroetil)fenilo
3-nitrofenilo	5-ciano-2-metilfenilo
2,5-diclorofenilo	2-metil-5-nitrofenilo
5-bromo-2-clorofenilo	5-cloro-2-metoxifenilo
2-cloro-5-yodofenilo	5-bromo-2-metoxifenilo
2-cloro-5-metilfenilo	5-yodo-2-metoxifenilo
2-cloro-5-etilfenilo	2-metoxi-5-metilfenilo
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	5-etil-2-metoxifenilo
2-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-metoxi-5-propilfenilo
2-cloro-5-(pentafluoroetil)fenilo	2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo
2-cloro-5-cianofenilo	2-metoxi-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2-cloro-5-nitrofenilo	2-metoxi-5-(pentafluoroetil)fenilo
2-bromo-5-clorofenilo	5-ciano-2-metoxifenilo
2,5-bromofenilo	2-metoxi-5-nitrofenilo
2-bromo-5-yodofenilo	5-cloro-2-etilfenilo
2-bromo-5-metilfenilo	5-bromo-2-etilfenilo
2-bromo-5-etilfenilo	2-etil-5-yodofenilo
2-bromo-5-propilfenilo	2-etil-5-metilfenilo
2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo	2,5-dietilfenilo
2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-etil-5-propilfenilo
2-bromo-5-(pentafluoroetil)fenilo	2-etil-5-(trifluorometil)fenilo
2-bromo-5-cianofenilo	2-etil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2-bromo-5-nitrofenilo	2-etil-5-(pentafluoroetil)fenilo
5-cloro-2-metilfenilo	5-ciano-2-etilfenilo
5-bromo-2-metilfenilo	2-etil-5-nitrofenilo
5-yodo-2-metilfenilo	3-cloropirazol-1-ilo
3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	3-bromopirazol-1-ilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-yodopirazol-1-ilo
3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-etilpirazol-1-ilo
3-cianopirazol-1-ilo	5-bromo-3-propilpirazol-1-ilo
3-nitropirazol-1-ilo	5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	5-bromo-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
3-cloro-5-metilpirazol-1-ilo	5-bromo-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
3-bromo-5-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-metilpirazol-1-ilo
3-yodo-5-metilpirazol-1-ilo	3-cloro-5-etilpirazol-1-ilo
3-etil-5-metilpirazol-1-ilo	3-bromo-5-etilpirazol-1-ilo
5-metil-3-propilpirazol-1-ilo	5-etil-3-yodopirazol-1-ilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	3,5-dietilpirazol-1-ilo
5-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	5-etil-3-propilpirazol-1-ilo
5-metil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
3-ciano-5-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
5-metil-3-nitropirazol-1-ilo	5-etil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
5-cloro-3-metilpirazol-1-ilo	3,5-dimetil-2-tienilo
3,5-dicloropirazol-1-ilo	3,5-dicloro-2-tienilo
5-cloro-3-bromopirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-tienilo
5-cloro-3-yodopirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-tienilo

R1	R1
5-cloro-3-etilpirazol-1-ilo	3,6-dimetil-2-piridinilo
5-dicloro-3-propilpirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-piridinilo
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2,5-dimetil-4-piridinilo
5-cloro-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	3,6-dicloro-2-piridinilo
5-cloro-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-piridinilo
5-cloro-3-cianopirazol-1-ilo	2,5-dicloro-4-piridinilo
5-cloro-3-nitropirazol-1-ilo	3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-bromo-3-metilpirazol-1-ilo	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo
5-bromo-3-cloropirazol-1-ilo	1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo
3,5-dibromopirazol-1-ilo	

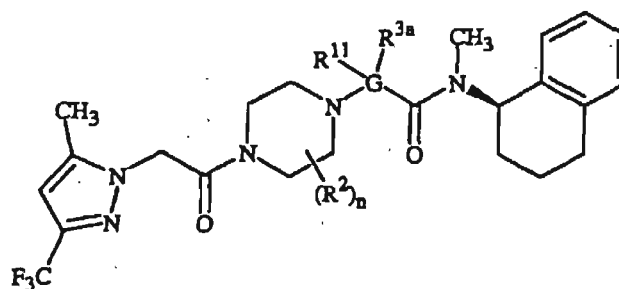
TABLA 3A



$(R^2)_n$	G	R^{3a}	R^{11}	$(R^2)_n$	G	R^{3a}	R^{11}
H	G-1	H	-	H	G-15	H	-
H	G-2	H	-	H	G-16	H	H
H	G-3	H	H	H	G-17	H	-
H	G-4	H	-	H	G-18	H	-
H	G-5	H	-	H	G-19	H	H
H	G-6	H	H	H	G-20	H	-
H	G-7	H	-	H	G-21	H	-
H	G-8	H	-	H	G-22	H	H
H	G-9	H	H	H	G-23	H	-
H	G-10	H	-	H	G-24	H	-
H	G-11	H	-	H	G-25	H	-
H	G-12	H	H	H	G-26	H	-
H	G-13	H	H	H	G-27	H	-
H	G-14	H	-	H	G-28	H	-
H	G-29	H	-	H	G-52	H	-
H	G-30	H	-	H	G-53	H	-
H	G-31	H	-	H	G-54	H	H
H	G-32	H	-	H	G-55	H	-
H	G-33	H	-	H	G-2	Me	-
H	G-34	H	-	H	C-2	Cl	-
H	G-35	H	-	H	G-2	F	-
H	G-36	H	-	H	G-2	CF ₃	-
H	G-37	H	-	H	G-14	n-Pr	-
H	G-38	H	-	H	G-3	H	Me
H	G-39	H	H	H	G-3	H	n-Pr
H	G-40	H	-	H	G-26	5-Me	-

$(R^2)_n$	G	R^{3a}	R^{11}	$(R^2)_n$	G	R^{3a}	R^{11}
H	G-41	H	-	2-Me	G-1	H	-
H	G-42	H	H	3-Me	G-1	H	-
H	G-43	H	H	2,6-di-Me	G-1	H	-
H	G-44	H	-	3,5-di-Me	G-1	H	-
H	G-45	H	-	3-n-Bu	G-1	H	-
H	G-46	H	-	4-MeO	G-1	H	-
H	G-47	H	-	4-OH	G-1	H	-
H	G-48	H	H	4-Cl	G-1	H	-
H	G-49	H	-	4-Br	G-1	H	-
H	G-50	H	-	4-CN	G-1	H	-
H	G-51	H	H				-

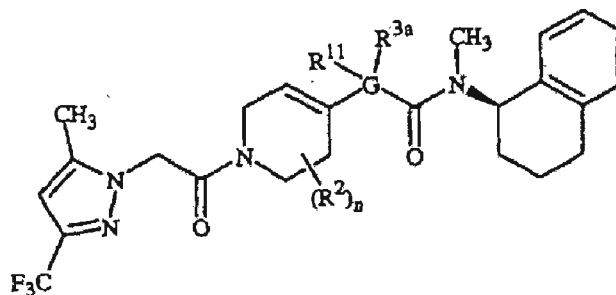
TABLA 3B



$(R^2)_n$	G	R^{3a}	R^{11}	$(R^2)_n$	G	R^{3a}	R^{11}
H	G-1	H	-	H	G-4	-	-
H	G-2	H	-	H	G-5	H	-
H	G-3	H	H	H	G-6	H	H
H	G-7	H	-	H	G-41	H	-
H	G-8	H	-	H	G-42	H	H
H	G-9	H	H	H	G-43	H	H
H	G-10	H	-	H	G-44	H	-
H	G-11	H	-	H	G-45	H	-
H	G-12	H	H	H	G-46	H	-
H	G-13	H	H	H	G-47	H	-
H	G-14	H	-	H	G-48	H	H
H	G-15	H	-	H	G-49	H	-
H	G-16	H	H	H	G-50	H	-
H	G-17	H	-	H	G-51	H	H
H	G-18	H	-	H	G-52	H	-
H	G-19	H	H	H	G-53	H	-
H	G-20	H	-	H	G-54	H	H
H	G-21	H	-	H	G-2	H	-
H	G-22	H	H	H	G-2	Me	-
H	G-23	H	-	H	G-2	Cl	-
H	G-24	H	-	H	G-2	F	-
H	G-31	H	-	H	G-14	CF ₃	-
H	G-32	H	-	H	G-3	n-Pr	Me
H	G-33	H	-	H	G-3	H	n-Pr
H	G-34	H	-	2-Me	G-1	H	-

$(R^2)_n$	G	R^{3a}	R^{11}	$(R^2)_n$	G	R^{3a}	R^{11}
H	G-35	H	-	3-Me	G-1	H	-
H	G-37	H	-	2,6-di-Me	G-1	H	-
H	G-38	H	-	3,5-di-Me	G-1	H	-
H	G-39	H	H	3-n-Bu	G-1	H	-
H	G-40	H	-				

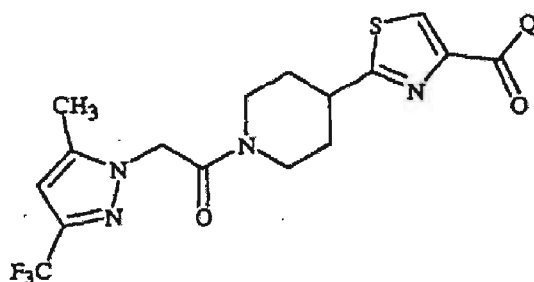
TABLA 3C



$(R^2)_n$	G	R^{3a}	R^{11}	$(R^2)_n$	G	R^{3a}	R^{11}
H	G-1	H	-	H	G-39	H	H
H	G-2	H	-	H	G-40	H	-
H	G-3	H	H	H	G-41	H	-
H	G-4	H	-	H	G-42	H	H
H	G-5	H	-	H	G-43	H	H
H	G-6	H	H	H	G-44	H	-
H	G-7	H	-	H	G-45	H	-
H	G-8	H	-	H	G-46	H	-
H	G-9	H	H	H	G-47	H	-
H	G-10	H	-	H	G-48	H	H
H	G-11	H	-	H	G-49	H	-
H	G-12	H	H	H	G-50	H	-
H	G-13	H	H	H	G-51	H	H
H	G-14	H	-	H	G-52	H	-
H	G-15	H	-	H	G-53	H	-
H	G-16	H	H	H	G-54	H	H
H	G-17	H	-	H	G-2	Me	-
H	G-18	H	-	H	G-2	Cl	-
H	G-19	H	H	H	G-2	F	-
H	G-20	H	-	H	G-2	CF ₃	-
H	G-21	H	-	H	G-14	n-Pr	-
H	G-22	H	H	H	G-3	H	Me
H	G-23	H	-	H	G-3	H	n-Pr
H	G-24	H	-	2-Me	G-1	H	-
H	G-31	H	-	3-Me	G-1	H	-
H	G-32	H	-	2,6-di-Me	G-1	H	-
H	G-33	H	-	3,5-di-Me	G-1	H	-
H	G-34	H	-	3-n-Bu	G-1	H	-
H	G-35	H	-	5-Me	G-1	H	-
H	G-37	H	-	6-Me	G-1	H	-

$(R^2)_n$	$\underline{G}$	$\underline{R^{3a}}$	$\underline{R^{11}}$	$(R^2)_n$	$\underline{G}$	$\underline{R^{3a}}$	$\underline{R^{11}}$
H	G-38		-				

TABLA 4*



$\underline{Q}$	$\underline{Q^a}$	$\underline{R^5}$	$(R^5)_m$	$(R^9)_l$	$\underline{R^{10}}$	$\underline{R^{15}}$	$(R^{16})_m / \underline{R^{16a}}$
Q-2	Me	-	H	H	-	H	-
Q-3	Me	-	H	H	-	H	-
Q-4	Me	-	H	H	-	H	-
Q-5	Me	-	H	H	H	H	-
Q-6	Me	-	H	H	-	H	-
Q-7	Me	-	H	H	-	H	-
Q-8	Me	-	H	H	-	H	-
Q-9	Me	-	H	H	-	H	-
Q-10	Me	-	H	H	-	H	-
Q-11	Me	-	H	H	H	H	-
Q-12	Me	-	H	H	-	H	-
Q-13	Me	-	H	H	-	H	-
Q-14	Me	-	H	H	-	H	-
Q-15	Me	-	H	H	H	H	-
Q-2	Me	-	2-Me	H	-	H	-
Q-2	Me	-	2,2-di-Me	H	-	H	-
Q-2	Me	-	2-Et	H	-	H	-
Q-2	Me	-	H	6-Me	-	H	-
Q-2	Me	-	H	6-Cl	-	H	-
Q-2	Me	-	H	6-OMe	-	H	-
Q-2	Me	-	H	6-Br	-	H	-
Q-2	Me	-	H	6-F	-	H	-
Q-2	Me	-	H	5-OMe	-	H	-
Q-2	Me	-	H	7-OMe	-	H	-
Q-3	Me	-	3-Me	H	-	H	-
Q-4	Me	-	3-Me	H	-	H	-
Q-5	Me	-	H	H	Me	H	-
Q-5	Me	-	H	H	n-Pr	H	-
Q-6	Me	-	H	3-Cl	-	H	-
Q-7	Me	-	H	2-Cl	-	H	-
Q-8	Me	-	2-Me	H	-	H	-
Q-8	Me	-	2,2-di-Me	H	-	H	-
Q-8	Me	-	2-Et	H	-	H	-
Q-8	Me	-	2-n-Pr	H	-	H	-
Q-8	Me	-	3,3-di-Me	H	-	H	-

<u>Q</u>	<u>Q^a</u>	<u>R^b</u>	<u>(R⁸)_m</u>	<u>(R⁹)_i</u>	<u>R¹⁰</u>	<u>R¹⁵</u>	<u>(R¹⁶)_m/R^{16a}</u>
Q-8	Me	-	H	5-Me	-	H	-
Q-8	Me	-	H	5-Cl	-	H	-
Q-8	Me	-	H	5-OMe	-	H	-
Q-8	Me	-	H	5-Br	-	H	-
Q-9	Me	-	2-Me	H	-	H	-
Q-10	Me	-	2-Me	H	-	H	-
Q-11	Me	-	H	H	Me	H	-
Q-13	Me	-	H	2-Me	-	H	-
Q-14	Me	-	H	2-Me	-	H	-
Q-14	Me	-	H	2-Cl	-	H	-
Q-15	Me	-	H	H	Me	H	-
Q-16	Me	-	H	H	-	H	-
Q-17	Me	-	H	H	-	H	-
Q-18	Me	-	H	H	Me	H	-
Q-19	Me	-	H	H	-	H	-
Q-20	Me	-	H	H	-	H	-
Q-21	Me	-	H	H	Me	H	-
Q-22	Me	-	H	H	-	H	-
Q-23	Me	-	H	H	-	H	-
Q-24	Me	-	H	H	-	H	-
Q-25	Me	-	H	H	-	H	-
Q-26	Me	-	H	H	-	H	-
Q-27	Me	-	H	H	-	H	-
Q-28	Me	-	H	H	-	H	-
Q-29	Me	-	H	H	-	H	-
Q-30	Me	-	H	H	-	H	-
Q-31	Me	-	H	H	-	H	-
Q-32	Me	-	H	H	-	H	-
Q-33	Me	-	H	H	Me	H	-
Q-34	Me	-	H	H	-	H	-
Q-35	Me	-	H	H	-	H	-
Q-36	Me	-	H	H	Me	H	-
Q-37	Me	-	H	H	-	H	-
Q-38	Me	-	H	H	-	H	-
Q-39	Me	-	H	H	Me	H	-
Q-40	Me	-	H	H	-	H	-
Q-41	Me	-	H	H	-	H	-
Q-42	Me	-	H	H	-	H	-
Q-43	Me	-	H	H	-	H	-
Q-44	Me	-	H	H	-	H	-
Q-45	Me	-	H	H	-	H	-
Q-46	Me	-	H	H	-	H	-
Q-47	Me	-	H	H	-	H	-
Q-48	Me	-	H	H	-	H	-
Q-49	Me	-	H	H	-	H	-
Q-50	Me	-	H	H	-	H	-
Q-51	Me	-	H	H	-	H	-
Q-52	Me	-	H	H	-	H	-
Q-53	Me	-	H	H	-	H	-
Q-54	Me	-	H	H	-	H	-

<u>Q</u>	<u>Q^a</u>	<u>R^o</u>	<u>(R^o)_m</u>	<u>(R^o)_j</u>	<u>R¹⁰</u>	<u>R^{1o}</u>	<u>(R^{1o})_m/R^{16a}</u>
Q-55	Me	-	H	H	-	H	-
Q-56	Me	-	H	H	-	H	-
Q-57	Me	-	H	H	-	H	-
Q-58	-	-	H	H	-	H	-
Q-59	-	-	H	H	-	H	-
Q-60	-	-	H	H	-	H	-
Q-61	-	-	H	H	-	H	-
Q-62	-	-	H	H	-	H	-
Q-63	-	-	H	H	-	H	-
Q-64	-	-	H	H	-	H	-
Q-65	-	-	H	H	-	H	-
Q-66	-	-	H	H	-	H	-
Q-67	-	-	H	H	-	H	-
Q-68	-	-	H	H	-	H	-
Q-69	-	-	H	H	-	H	-
Q-70	-	Et	-	H	-	H	-
Q-71	-	Et	-	H	-	H	-
Q-72	-	Et	-	H	-	H	-
Q-73	Me	-	-	H	-	H	-
Q-74	Me	-	-	H	-	H	-
Q-75	Me	Me	-	H	-	Me	-
Q-76	-	-	-	-	-	-	3-Ph
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-Ph
Q-78	-	-	-	-	-	-	4-Ph
Q-79	-	-	-	-	-	-	H
Q-80	-	-	-	-	-	-	4-Ph
Q-81	-	-	-	-	-	-	2-Me
Q-82	-	-	-	-	-	-	H
Q-83	Me	-	-	-	-	H	2-Ph
Q-84	Me	-	-	-	-	H	2-Ph
Q-85	Me	-	-	-	-	H	2-Ph
Q-2	Me	-	4-Me	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4,4-di-Me	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-Et	H	-	H	-
Q-2	Me	-	2-OH	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-OH	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-OMe	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-SMe	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-SOMe	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-SO ₂ Me	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-OCF ₃	H	-	H	-
Q-2	Me	-	2-CF ₃	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-NH ₂	H	-	H	-
Q-2	Me	-	2-n-Bu	H	-	H	-
Q-2	Me	-	2-propenil	H	-	H	-
Q-2	Me	-	2-propynil	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-Cl	H	-	H	-
Q-2	Me	-	2-CN	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-CN	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-O-t-Bu	H	-	H	-

<u>Q</u>	<u>Q^a</u>	<u>R^b</u>	<u>(R^g)_m</u>	<u>(R^g)_j</u>	<u>R¹⁰</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>(R^{1b})_m/R^{1ba}</u>
Q-2	Me	-	4-NHMe	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-N(Me)Me	H	-	H	-
Q-2	Me	-	2-MoOMe	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-CH ₂ OH	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-Ac	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-COOMe	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-OAc	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-O(C=O)-n-Bu	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-OBt	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-O(C=O)Et	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-SAc	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-CONHMe	H	-	H	-
Q-2	Me	-	4-CONMe ₂	H	-	H	-
Q-2	H	-	2-Me	H	-	H	-
Q-2	H	-	2,2-di-Me	H	-	H	-
Q-2	H	-	4-Me	H	-	H	-
Q-2	H	-	4,4-di-Me	H	-	H	-
Q-2	H	-	4-OH	H	-	H	-
Q-2	H	-	4-OMe	H	-	H	-
Q-2	H	-	4-OAc	H	-	H	-
Q-2	Me	-	2-Me	H	-	Me	-
Q-2	Me	-	2,2-di-Me	H	-	Me	-
Q-2	Me	-	4-Me	H	-	Me	-
Q-2	Me	-	4,4-di-Me	H	-	Me	-
Q-2	Me	-	4-OH	H	-	Me	-
Q-2	Me	-	4-OMe	H	-	Me	-
Q-2	Me	-	4-OAc	H	-	Me	-
Q-2	Et	-	H	H	-	H	-
Q-2	Pr	-	H	H	-	H	-
Q-2	2-propenilo	-	H	H	-	H	-
Q-2	2-propinilo	-	H	H	-	H	-
Q-2	c-propilo	-	H	H	-	H	-
Q-2	CF ₃	-	H	H	-	H	-
Q-2	CN	-	H	H	-	H	-
Q-2	OH	-	H	H	-	H	-
Q-2	OMe	-	H	H	-	H	-
Q-2	CH ₂ OMe	-	H	H	-	H	-
Q-2	CH ₂ OH	-	H	H	-	H	-
Q-2	Ac	-	H	H	-	H	-
Q-2	COEt	-	H	H	-	H	-
Q-2	CO ₂ Me	-	H	H	-	H	-
Q-2	CONHMe	-	H	H	-	H	-
Q-2	CON(Me) ₂	-	H	H	-	H	-
Q-8	Me	-	3-Me	H	-	H	-
Q-8	Me	-	3,3-di-Me	H	-	H	-
Q-8	Me	-	3-OH	H	-	H	-
Q-8	Me	-	3-OMe	H	-	H	-
Q-8	Me	-	3-OAc	H	-	H	-
Q-8	Me	-	2-Et	H	-	H	-
Q-8	H	-	H	H	-	H	-

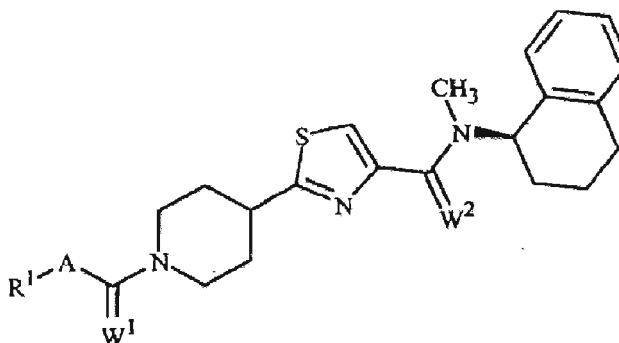
<u>Q</u>	<u>Q^a</u>	<u>R^b</u>	<u>(R⁸)_m</u>	<u>(R⁹)_i</u>	<u>R¹⁰</u>	<u>R¹⁵</u>	<u>(R¹⁵)_m/R^{16a}</u>
Q-14	Me	-	2-Me	H	-	H	-
Q-14	Me	-	2,2-di-Me	H	-	H	-
Q-14	Me	-	3-Me	H	-	H	-
Q-14	Me	-	3,3-di-Me	H	-	H	-
Q-14	Me	-	3-OH	H	-	H	-
Q-14	Me	-	3-OMe	H	-	H	-
Q-14	Me	-	3-OAc	H	-	H	-
Q-14	Me	-	2-Et	H	-	H	-
Q-14	Me	-	H	H	-	H	-
Q-23	Me	-	2-Me	H	-	H	-
Q-23	Me	-	2,2-di-Me	H	-	H	-
Q-23	Me	-	3-Me	H	-	H	-
Q-23	Me	-	3,3-di-Me	H	-	H	-
Q-23	H	-	H	H	-	H	-
Q-41	Me	-	2-Me	H	-	H	-
Q-41	Me	-	2,2-di-Me	H	-	H	-
Q-41	H	-	H	H	-	H	-
Q-70	-	Me	-	H	-	Me	-
Q-71	-	Me	-	H	-	Me	-
Q-78	-	-	-	-	-	-	H
Q-78	-	-	-	-	-	-	4-Me
Q-78	-	-	-	-	-	-	4-Et
Q-78	-	-	-	-	-	-	4-i-Pr
Q-78	-	-	-	-	-	-	4-t-Bu
Q-78	-	-	-	-	-	-	4-propen-2-il
Q-78	-	-	-	-	-	-	4-propyn-2-il
Q-78	-	-	-	-	-	-	4-c-propil
Q-78	-	-	-	-	-	-	4-c-hexil
Q-78	-	-	-	-	-	-	4-CF ₃
Q-78	-	-	-	-	-	-	4-CH ₂ CF ₃
Q-78	-	-	-	-	-	-	4-SO ₂ Me
Q-78	-	-	-	-	-	-	4-CH ₂ OH
Q-78	-	-	-	-	-	-	4-Ac
Q-78	-	-	-	-	-	-	4-COEt
Q-78	-	-	-	-	-	-	4-COO-t-Bu
Q-78	-	-	-	-	-	-	4-benzyl
Q-78	-	-	-	-	-	-	4-(4-Cl-Ph)
Q-77	-	-	-	-	-	-	H
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-Me
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-t-Bu
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-OH
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-OMe
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-OPr
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-Br
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-Cl
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-NH ₂
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-NHMe
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-N(Et) ₂
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-CN
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-NO ₂

$\underline{Q}$	$\underline{Q}^a$	$\underline{R}^o$	$(\underline{R}^8)_m$	$(\underline{R}^9)_l$	$\underline{R}^{10}$	$\underline{R}^{15}$	$(\underline{R}^{16})_m/\underline{R}^{16a}$
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-OCF ₃
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-SMe
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-SO-n-Bu
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-SCHF ₂
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-NHMe
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-N(Me) ₂
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-MeOMe
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-CO ₂ Me
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-OAc
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-CONHMe
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-trimethylsilo
Q-77	-	-	-	-	-	-	3-Ph
Q-77	-	-	-	-	-	-	3-Me
Q-77	-	-	-	-	-	-	2-Ph
Q-75	Me	Et	-	H	-	Et	-
Q-75	Me	Et	-	H	-	Me	-
Q-75	Me	Me	-	H	-	i-Pr	-

Notas:

* las definiciones de R^5 , R^{10} , R^{15} , $(R^{16})_m$, R^{16a} , Q^a , $(R^8)_m$ y $(R^9)_j$ en los compuestos de la Tabla 4 se muestran en la reivindicación 1 a menos que se indique lo contrario.

TABLA 5

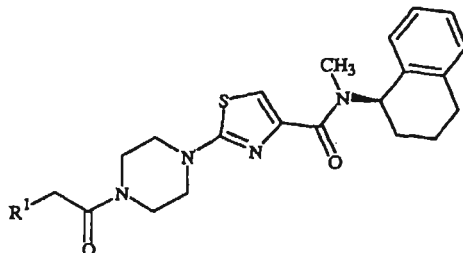


5

<u>R¹</u>	<u>A</u>	<u>W¹</u>	<u>W²</u>
2-metoxifenilo	NH	O	O
2,5-diclorofenilo	NH	O	O
5-bromo-2-clorofenilo	NH	O	O
2-cloro-5-metilfenilo	NH	O	O
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	NH	O	O
2,5-dibromofenilo	NH	O	O
2-bromo-5-metilfenilo	NH	O	O
2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo	NH	O	O
5-cloro-2-metilfenilo	NH	O	O
5-bromo-2-metilfenilo	NH	O	O
2,5-dimetilfenilo	NH	O	O
5-etil-2-metilfenilo	NH	O	O
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	NH	O	O
5-bromo-2-metoxifenilo	NH	O	O

<u>R¹</u>	<u>A</u>	<u>W¹</u>	<u>W²</u>
2-metoxi-5-metilfenilo	NH	O	O
2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo	NH	O	O
3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	NH	O	O
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	NH	O	O
3-etil-5-metilpirazol-1-ilo	NH	O	O
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	NH	O	O
3,5-dicloropirazol-1-ilo	NH	O	O
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	NH	O	O
3,5-dibromopirazol-1-ilo	NH	O	O
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	NH	O	O
3,5-dietilpirazol-1-ilo	NH	O	O
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	NH	O	O
2-metoxifenilo	NH	S	O
2,5-diclorofenilo	NH	S	O
5-bromo-2-clorofenilo	NH	S	O
2-cloro-5-metilfenilo	NH	S	O
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	NH	S	O
2,5-dibromofenilo	NH	S	O
2-bromo-5-metilfenilo	NH	S	O
2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo	NH	S	O
5-cloro-2-metilfenilo	NH	S	O
5-bromo-2-metilfenilo	NH	S	O
2,5-dimetilfenilo	NH	S	O
5-etil-2-metilfenilo	NH	S	O
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	NH	S	O
5-bromo-2-metoxifenilo	NH	S	O
2-metoxi-5-metilfenilo	NH	S	O
2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo	NH	S	O
3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	NH	S	O
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	NH	S	O
3-etil-5-metilpirazol-1-ilo	NH	S	O
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	NH	S	O
3,5-dicloropirazol-1-ilo	NH	S	O
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	NH	S	O
3,5-dibromopirazol-1-ilo	NH	S	O
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	NH	S	O
3,5-dietilpirazol-1-ilo	NH	S	O
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	NH	S	O
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	CH ₂	S	S
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	CH ₂	O	S
3,5-dicloropirazol-1-ilo	CH ₂	O	S
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	CH ₂	O	S
3,5-dietilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	S
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	CH ₂	O	S
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	CH ₂	O	S
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	CH ₂	O	S
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	CH ₂	O	S

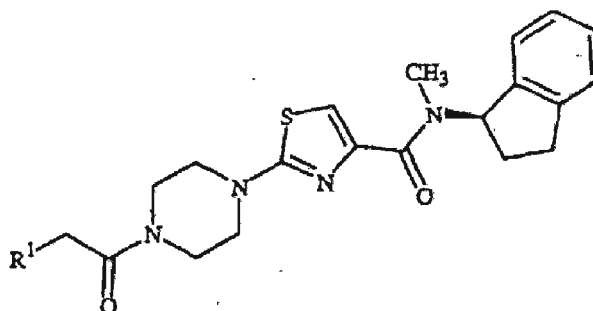
TABLA 6A



R^1	R^1
2-metoxifenilo	3-nitrofenilo
3-bromofenilo	2,5-diclorofenilo
3-yodofenilo	5-bromo-2-clorofenilo
3-(trifluorometil)fenilo	2-cloro-5-yodofenilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-cloro-5-metilfenilo
3-(pentafluoroetil)fenilo	2-cloro-5-etilfenilo
3-cianofenilo	2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo
2-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo
2-cloro-5-(pentafluoroetil)fenilo	2-metoxi-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2-cloro-5-cianofenilo	2-metoxi-5-(pentafluoroetil)fenilo
2-cloro-2-nitrofenilo	5-ciano-2-metoxifenilo
2-bromo-5-clorofenilo	2-metoxi-5-nitrofenilo
2,5-dibromofenilo	5-cloro-2-etilfenilo
2-bromo-5-yodofenilo	5-bromo-2-etilfenilo
2-bromo-5-metilfenilo	2-etil-5-yodofenilo
2-bromo-5-etilfenilo	2-etil-5-metilfenilo
2-bromo-5-propilfenilo	2,5-dietilfenilo
2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo	2-etil-5-propilfenilo
2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-etil-5-(trifluorometil)fenilo
2-bromo-5-(pentafluoroetil)fenilo	2-etil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2-bromo-5-cianofenilo	2-etil-5-(pentafluoroetil)fenilo
2-bromo-5-nitrofenilo	5-ciano-2-etilfenilo
5-cloro-2-metilfenilo	2-etil-5-nitrofenilo
5-bromo-2-metilfenilo	3-cloropirazol-1-ilo
5-yodo-2-metilfenilo	3-bromopirazol-1-ilo
2,5-dimetilfenilo	3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-etil-2-metilfenilo	3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
2-metil-5-propilfenilo	3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
5-isopropil-2-metilfenilo	3-cianopirazol-1-ilo
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	3-nitropirazol-1-ilo
2-metil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	3,5-dimetilpirazol-1-ilo
2-metil-5-(pentafluoroetil)fenilo	3-cloro-5-metilpirazol-1-ilo
5-ciano-2-metilfenilo	3-bromo-5-metilpirazol-1-ilo
2-metil-5-nitrofenilo	3-yodo-5-metilpirazol-1-ilo
5-cloro-2-metoxifenilo	3-etil-5-metilpirazol-1-ilo
5-bromo-2-metoxifenilo	5-metil-3-propilpirazol-1-ilo
5-yodo-2-metoxifenilo	5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
2-metoxi-5-metilfenilo	5-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
5-etil-2-metoxipbenilo	5-metil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-metoxi-5-propilfenil	3-ciano-5-metilpirazol-1-ilo
5-metil-3-nitropirazol-1-ilo	3-cloro-5-etilpirazol-1-ilo
5-cloro-3-metilpirazol-1-ilo	3-bromo-5-etilpirazol-1-ilo
3,5-dicloropirazol-1-ilo	5-etil-3-iodopirazol-1-ilo
5-cloro-3-bromopirazol-1-ilo	3,5-dietilpirazol-1-ilo
5-cloro-3-yodopirazol-1-ilo	5-etil-3-propilpirazol-1-ilo
5-cloro-3-etilpirazol-1-ilo	5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-cloro-3-propilpirazol-1-ilo	5-etil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	5-etil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
5-cloro-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	3,5-dimetil-2-tienilo
5-cloro-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	3,5-dicloro-2-tienilo
5-cloro-3-cianopirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-tienilo
5-cloro-3-nitropirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-tienilo
5-bromo-3-metilpirazol-1-ilo	3,6-dimetil-2-piridilo
5-bromo-3-cloropirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-piridilo
3,5-dibromopirazol-1-ilo	2,5-dimetil-4-piridilo
5-bromo-3-yodopirazol-1-ilo	3,6-dicloro-2-piridilo
5-bromo-3-etilpirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-piridilo
5-bromo-3-propilpirazol-1-ilo	2,5-dicloro-4-piridilo
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-bromo-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo
5-bromo-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo
5-etil-3-metilpirazol-1-ilo	

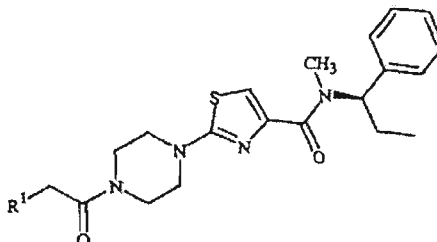
TABLA 6B



<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-metoxifenilo	3-bromofenilo
3-yodofenilo	5-isopropil-2-metilfenilo
3-(trifluorometil)fenilo	2-metil-5-(trifluorometil)fenilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-metil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
3-(pentafluoroetil)fenilo	2-metil-5-(pentafluoroetil)fenilo
3-cianofenilo	5-ciano-2-metilfenilo
3-nitrofenilo	2-metil-5-nitrofenilo
2,5-diclorofenilo	5-cloro-2-metoxifenilo
5-bromo-2-clorofenilo	5-bromo-2-metoxifenilo
2-cloro-5-yodofenilo	5-yodo-2-metoxifenilo
2-cloro-5-metilfenilo	2-metoxi-5-metilfenilo
2-cloro-5-etilfenilo	5-etil-2-metoxifenilo

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	2-metoxi-5-propilfenilo
2-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo
2-cloro-5-(pentafluoroetil)fenilo	2-metoxi-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2-cloro-5-cianofenilo	2-metoxi-5-(pentafluoroetil)fenilo
2-cloro-5-nitrofenilo	5-ciano-2-metoxifenilo
2-bromo-5-clorofenilo	2-metoxi-5-nitrofenilo
2,5-dibromofenilo	5-cloro-2-etilfenilo
2-bromo-5-yodofenilo	5-bromo-2-etilfenilo
2-bromo-5-metilfenilo	2-etil-5-yodofenilo
2-bromo-5-etilfenilo	2-etil-5-metilfenilo
2-bromo-5-propilfenilo	2,5-dietilfenilo
2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo	2-etil-5-propilfenilo
2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-etil-5-(trifluorometil)fenilo
2-bromo-5-(pentafluoroetil)fenilo	2-etil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2-bromo-5-cianofenilo	2-etil-5-(pentafluoroetil)fenilo
2-bromo-5-nitrofenilo	5-ciano-2-etilfenilo
5-cloro-2-metilfenilo	2-etil-5-nitrofenilo
5-bromo-2-metilfenilo	3-cloropirazol-1-ilo
5-yodo-2-metilfenilo	3-bromopirazol-1-ilo
2,5-dimetilfenilo	3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-etil-2-metilfenilo	3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
2-metil-5-propilfenilo	3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
3-cianopirazol-1-ilo	5-bromo-3-etilpirazol-1-ilo
3-nitropirazol-1-ilo	5-bromo-3-propilpirazol-1-ilo
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
3-cloro-5-metilpirazol-1-ilo	5-bromo-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
3-bromo-5-metilpirazol-1-ilo	5-bromo-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
3-yodo-5-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-metilpirazol-1-ilo
3-etil-5-metilpirazol-1-ilo	3-cloro-5-etilpirazol-1-ilo
5-metil-3-propilpirazol-1-ilo	3-bromo-5-etilpynzol-1-ilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	5-etil-3-yodopirazol-1-ilo
5-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	3,5-dietilpirazol-1-ilo
5-metil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	5-etil-3-propilpirazol-1-ilo
3-ciano-5-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-metil-3-nitropirazol-1-ilo	5-etil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
5-cloro-3-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
3,5-dicloropirazol-1-ilo	3,5-dimetil-2-tienilo
5-cloro-3-bromopirazol-1-ilo	3,5-dicloro-2-tienilo
5-cloro-3-yodopirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-tienilo
5-cloro-3-etilpirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-tienilo
5-cloro-3-propilpirazol-1-ilo	3,6-dimetil-2-piridilo
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-piridilo
5-cloro-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	2,5-dimetil-4-piridilo
5-cloro-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	3,6-dicloro-2-piridilo
5-cloro-3-cianopirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-piridilo
5-cloro-3-nitropirazol-1-ilo	2,5-dicloro-4-piridilo
5-bromo-3-metilpirazol-1-ilo	3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-bromo-3-cloropirazol-1-ilo	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo
3,5-dibromopirazol-1-ilo	1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo
5-bromo-3-yodopirazol-1-ilo	

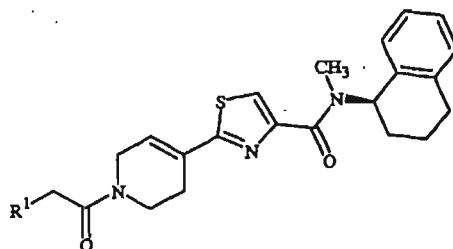
TABLA 6C



<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-metoxifenilo	2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo
3-bromofenilo	2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
3-yodofenilo	2-bromo-5-(pentafluoroetil)fenilo
3-(trifluorometil)fenilo	2-bromo-5-cianofenilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-bromo-5-nitrofenilo
3-(pentafluoroetil)fenilo	5-cloro-2-metilfenilo
3-cianofenilo	5-bromo-2-metilfenilo
3-nitrofenilo	5-yodo-2-metilfenilo
2,5-diclorofenilo	2,5-dimetilfenilo
5-bromo-2-clorofenilo	5-etil-2-metilfenilo
2-cloro-5-yodofenilo	2-metil-5-propilfenilo
2-cloro-5-metilfenilo	5-isopropil-2-metilfenilo
2-cloro-5-etilfenilo	2-metil-5-(trifluorometil)fenilo
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	2-metil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-metil-5-(pentafluoroetil)fenilo
2-cloro-5-(pentafluoroetil)fenilo	5-ciano-2-metilfenilo
2-cloro-5-cianofenilo	2-metil-5-nitrofenilo
2-cloro-5-nitrofenilo	5-cloro-2-metoxifenilo
2-bromo-5-clorofenilo	5-bromo-2-metoxifenilo
2,5-dibromofenilo	5-yodo-2-metoxifenilo
2-bromo-5-yodofenilo	2-metoxi-5-metilfenilo
2-bromo-5-metilfenilo	5-etil-2-metoxifenilo
2-bromo-5-etilfenilo	2-metoxi-5-propilfenilo
2-bromo-5-propilfenilo	2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo
2-metoxi-5-(2,2,2-trifluorometil)fenilo	5-cloro-3-metilpirazol-1-ilo
2-metoxi-5-(pentafluoroetil)fenilo	3,5-dicloropirazol-1-ilo
5-ciano-2-metoxifenilo	5-cloro-3-bromopirazol-1-ilo
2-metoxi-5-nitrofenilo	5-cloro-3-yodopirazol-1-ilo
5-cloro-2-etilfenilo	5-cloro-3-etilpirazol-1-ilo
5-bromo-2-etilfenilo	5-cloro-3-propilpirazol-1-ilo
2-etil-5-yodofenilo	5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
2-etil-5-metilfenilo	5-cloro-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
2,5-dietilfenilo	5-cloro-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
2-etil-5-propilfenilo	5-cloro-3-cianopirazol-1-ilo
2-etil-5-(trifluorometil)fenilo	5-cloro-3-nitropirazol-1-ilo
2-etil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	5-bromo-3-metilpirazol-1-ilo
2-etil-5-(pentafluoroetil)fenilo	5-bromo-3-cloropirazol-1-ilo
5-ciano-etilfenilo	3,5-dibromopirazol-1-ilo

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-etil-5-nitrofenilo	5-bromo-3-yodopirazol-1-ilo
3-cloropirazol-1-ilo	5-bromo-3-etilpirazol-1-ilo
3-bromopirazol-1-ilo	5-bromo-3-propilpirazol-1-ilo
3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
3-(pentafluoroetil)pyrezol-1-ilo	5-bromo-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
3-cianoppazol-1-ilo	5-etil-3-metilpirazol-1-ilo
3-nitropirazol-1-ilo	3-cloro-5-etilpirazol-1-ilo
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	3-bromo-5-etilpirazol-1-ilo
3-cloro-5-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-yodopirazol-1-ilo
3-bromo-5-metilpirazol-1-ilo	3,5-dietilpirazol-1-ilo
3-yodo-5-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-propilpirazol-1-ilo
3-etil-5-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-metil-3-propilpirazol-1-ilo	5-etil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	5-etil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	3,5-dimetil-2-tienilo
5-metil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	3,5-dicloro-2-tienilo
3-ciano-5-metilpirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-tienilo
5-metil-3-nitropirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-tienilo
3,6-dimetil-2-piridilo	2,5-dicloro-4-piridilo
2,5-dimetil-3-piridilo	3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
2,5-dimetil-4-piridilo	1-metil-3-(triflummetil)pirazol-5-ilo
3,6-dicloro-2-piridilo	1-metil-4-(trifluorometil)imidazo1-2-ilo
2,5-dicloro-3-piridilo	

TABLA 7A

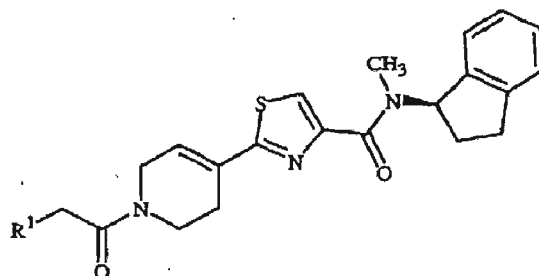


<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-metoxifenilo	2-bromo-5-clorofenilo
3-bromofenilo	2,5-dibromofenilo
3-yodofenilo	2-bromo-5-yodofenilo
3-(trifluorometil)fenilo	2-bromo-5-metilfenilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-bromo-5-etilfenilo
3-(pentafluoroetil)fenilo	2-bromo-5-propilfenilo
3-cianofenilo	2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo
3-nitrofenilo	2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2,5-diclorofenilo	2-bromo-5-(pentafluoroetil)fenilo
5-bromo-2-clorofenilo	2-bromo-5-cianofenilo
2-cloro-5-yodofenilo	2-bromo-5-nitrophenil

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-cloro-5-metilfenilo	5-cloro-2-metilfenilo
2-cloro-5-etilfenilo	5-bromo-2-metilfenilo
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	5-yodo-2-metilfenilo
2-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2,5-dimetilfenilo
2-cloro-5-(pentafluoroetil)fenilo	5-etil-2-metilfenilo
2-cloro-5-cianofenilo	2-metil-5-propilfenilo
2-cloro-5-nitrofenilo	5-isopropil-2-metilfenilo
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	3-nitropirazol-1-ilo
2-metil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	3,5-dimetilpirazol-1-ilo
2-metil-5-(pentafluoroetil)fenilo	3-cloro-5-metilpirazol-1-ilo
5-ciano-2-metilfenilo	3-bromo-5-metilpirazol-1-ilo
2-metil-5-nitrofenilo	3-yodo-5-metilpirazol-1-ilo
5-cloro-2-metoxifenilo	3-etil-5-metilpirazol-1-ilo
5-bromo-2-metoxifenilo	5-metil-3-propilpirazol-1-ilo
5-yodo-2-metoxifenilo	5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
2-metoxi-5-metilfenilo	5-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
5-etil-2-metoxifenilo	5-metil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
2-metoxi-5-propilfenilo	3-ciano-5-metilpirazol-1-ilo
2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo	5-metil-3-nitropirazol-1-ilo
2-metoxi-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	5-cloro-3-metilpirazol-1-ilo
2-metoxi-5-(pentafluoroetil)fenilo	3,5-dicloropirazol-1-ilo
5-ciano-2-metoxifenilo	5-cloro-3-bromopirazol-1-ilo
2-metoxi-5-nitrofenilo	5-cloro-3-yodopirazol-1-ilo
5-cloro-2-etilfenilo	5-cloro-3-etilpirazol-1-ilo
5-bromo-2-etilfenilo	5-cloro-3-propilpirazol-1-ilo
2-etil-5-yodofenilo	5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
2-etil-5-metilfenilo	5-cloro-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
2,5-dietilfenilo	5-cloro-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
2-etil-5-propilfenilo	5-cloro-3-cianopirazol-1-ilo
2-etil-5-(trifluorometil)fenilo	5-cloro-3-nitropirazol-1-ilo
2-etil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	5-bromo-3-metilpirazol-1-ilo
2-etil-5-(pentafluoroetil)fenilo	5-bromo-3-cloropirazol-1-ilo
5-ciano-2-etilfenilo	3,5-dibromopirazol-1-ilo
2-etil-5-nitrofenilo	5-bromo-3-yodopirazol-1-ilo
3-cloropirazol-1-ilo	5-bromo-3-etilpirazol-1-ilo
3-bromopirazol-1-ilo	5-bromo-3-propilpirazol-1-ilo
3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
3-cianopirazol-1-ilo	5-etil-3-metilpirazol-1-ilo
3-cloro-5-etilpirazol-1-ilo	2,5-cloro-3-tienilo
3-bromo-5-etilpirazol-1-ilo	3,6-dimetil-2-piridilo
5-etil-3-yodopirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-piridilo
3,5-dietilpirazol-1-ilo	2,5-dimetil-4-piridilo
5-etil-3-propilpirazol-1-ilo	3,6-dicloro-2-piridilo
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-piridilo
5-etil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	2,5-dicloro-4-piridilo
5-etil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
3,5-dimetil-2-tienilo	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo
3,5-dicloro-2-tienilo	1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo

R^1	R^1
2,5-dimetil-3-tienilo	

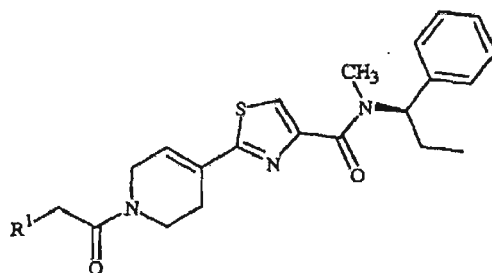
TABLA 7B



R^1	R^1
2-metoxifenilo	2-cloro-5-etilfenilo
3-bromofenilo	2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo
3-yodofenilo	2-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
3-(trifluorometil)fenilo	2-cloro-5-(pentafluoroetil)fenilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-cloro-5-cianofenilo
3-(pentafluoroetil)fenilo	2-cloro-5-nitrofenilo
3-cianofenilo	2-bromo-5-clorofenilo
3-nitrofenilo	2,5-dibromofenilo
2,5-diclorofenilo	2-bromo-5-yodofenilo
5-bromo-2-clorofenilo	2-bromo-5-metilfenilo
2-cloro-5-yodofenilo	2-bromo-5-etilfenilo
2-cloro-5-metilfenilo	2-bromo-5-propilfenilo
2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo	2-etil-5-propilfenilo
2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-etil-5-(trifluorometil)fenilo
2-bromo-5-(pentafluoroetil)fenilo	2-etil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2-bromo-5-cianofenilo	2-etil-5-(pentafluoroetil)fenilo
2-bromo-5-nitrofenilo	5-ciano-2-etilfenilo
5-cloro-2-metilfenilo	2-etil-5-nitrofenilo
5-bromo-2-metilfenilo	3-cloropirazol-1-ilo
5-yodo-2-metilfenilo	3-bromopirazol-1-ilo
2,5-dimetilfenilo	3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-etil-2-metilfenilo	3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
2-metil-5-propilfenilo	3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
5-isopropil-2-metilfenilo	3-cianopirazol-1-ilo
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	3-nitropirazol-1-ilo
2-metil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	3,5-dimetilpirazol-1-ilo
2-metil-5-(pentafluoroetil)fenilo	3-cloro-5-metilpirazol-1-ilo
5-ciano-2-metilfenilo	3-bromo-5-metilpirazol-1-ilo
2-metil-5-nitrofenilo	3-yodo-5-metilpirazol-1-ilo
5-cloro-2-metoxifenilo	3-etil-5-metilpirazol-1-ilo
5-bromo-2-metoxifenilo	5-metil-3-propilpirazol-1-ilo
5-yodo-2-metoxifenilo	5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
2-metoxi-5-metilfenilo	5-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
5-etil-2-metoxifenilo	5-metil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-metoxi-5-propilfenilo	3-ciano-5-metilpirazol-1-ilo
2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo	5-metil-3-nitropirazol-1-ilo
2-metoxi-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	5-cloro-3-metilpirazol-1-ilo
2-metoxi-5-(pentafluoroetil)fenilo	3,5-dicloropirazol-1-ilo
5-ciano-2-metoxifenilo	5-cloro-3-bromopirazol-1-ilo
2-metoxi-5-nitrofenilo	5-cloro-3-yodopirazol-1-ilo
5-cloro-2-etilfenilo	5-cloro-3-etilpirazol-1-ilo
5-bromo-2-etilfenilo	5-cloro-3-propilpirazol-1-ilo
2-etil-5-yodofenilo	5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
2-etil-5-metilfenilo	5-cloro-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
2,5-dietilfenilo	5-cloro-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
5-cloro-3-cianopirazol-1-ilo	5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-cloro-3-nitropirazol-1-ilo	5-etil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
5-bromo-3-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
5-bromo-3-cloropirazol-1-ilo	3,5-dimetil-2-tienilo
3,5-dibromopirazol-1-ilo	3,5-dicloro-2-tienilo
5-bromo-3-yodopirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-tienilo
5-bromo-3-etilpirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-tienilo
5-bromo-3-propilpirazol-1-ilo	3,6-dimetil-2-piridilo
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-piridilo
5-bromo-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	2,5-dimetil-4-piridilo
5-bromo-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	3,6-dicloro-2-piridilo
5-etil-3-metilpirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-piridilo
3-cloro-5-etilpirazol-1-ilo	2,5-dicloro-4-piridilo
3-bromo-5-etilpirazol-1-ilo	3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-etil-3-yodopirazol-1-ilo	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo
3,5-dietilpirazol-1-ilo	1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo
5-etil-3-propilpirazol-1-ilo	

TABLA 7C

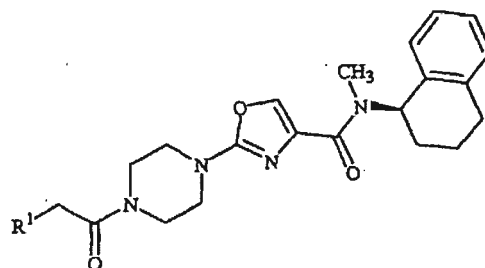


<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-metoxifenilo	3-cianofenilo
3-bromofenilo	3-nitrofenilo
3-yodofenilo	2,5-diclorofenilo
3-(trifluorometil)fenilo	5-bromo-2-clorofenilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-cloro-5-yodofenilo
3-(pentafluoroetil)fenilo	2-cloro-5-metilfenilo
2-cloro-5-etilfenilo	5-etil-2-metoxifenilo

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	2-metoxi-5-propilfenilo
2-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo
2-cloro-5-(pentafluoroetil)fenilo	2-metoxi-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2-cloro-5-cianofenilo	2-metoxi-5-(pentafluoroetil)fenilo
2-cloro-5-nitrofenilo	5-ciano-2-metoxifenilo
2-bromo-5-clorofenilo	2-metoxi-5-nitrofenilo
2,5-dibromofenilo	5-cloro-2-etilfenilo
2-bromo-5-yodofenilo	5-bromo-2-etilfenilo
2-bromo-5-metilfenilo	2-etil-5-yodofenilo
2-bromo-5-etilfenilo	2-etil-5-metilfenilo
2-bromo-5-propilfenilo	2,5-dietilfenilo
2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo	2-etil-5-propilfenilo
2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-etil-5-(trifluorometil)fenilo
2-bromo-5-(pentafluoroetil)fenilo	2-etil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2-bromo-5-cianofenilo	2-etil-5-(pentafluoroetil)fenilo
2-bromo-5-nitrofenilo	5-ciano-2-etilfenilo
5-chloro-2-metilfenilo	2-etil-5-nitrofenilo
5-bromo-2-metilfenilo	3-cloropirazol-1-ilo
5-yodo-2-metilfenilo	3-bromopirazol-1-ilo
2,5-dimetilfenilo	3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-etil-2-metilfenilo	3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
2-metil-5-propilfenilo	3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
5-isopropil-2-metilfenilo	3-cianopirazol-1-ilo
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	3-nitropirazol-1-ilo
2-metil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	3,5-dimetilpirazol-1-ilo
2-metil-5-(pentafluoroetil)fenilo	3-cloro-5-metilpirazol-1-ilo
5-ciano-2-metilfenilo	3-bromo-5-metilpirazol-1-ilo
2-metil-5-nitrofenilo	3-yodo-5-metilpirazol-1-ilo
5-cloro-2-metoxifenilo	3-etil-5-metilpirazol-1-ilo
5-bromo-2-metoxifenilo	5-metil-3-propilpirazol-1-ilo
5-yodo-2-metoxifenilo	5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
2-metoxi-5-metilfenilo	5-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
5-metil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	5-etil-3-metilpirazol-1-ilo
3-ciano-5-metilpirazol-1-ilo	3-cloro-5-etilpirazol-1-ilo
5-metil-3-nitropirazol-1-ilo	3-bromo-5-etilpirazol-1-ilo
5-cloro-3-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-yodopirazol-1-ilo
3-5-dicloropirazol-1-ilo	3-5-dietilpirazol-1-ilo
5-cloro-3-bromopirazol-1-ilo	5-etil-3-propilpirazol-1-ilo
5-cloro-3-yodopirazol-1-ilo	5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-chloro-3-etilpirazol-1-ilo	5-etil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
5-cloro-3-propilpirazol-1-ilo	5-etil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	3,5-dimetil-2-tienilo
5-cloro-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	3,5-dicloro-2-tienilo
5-chloro-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-tienilo
5-cloro-3-cianopirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-tienilo
5-cloro-3-nitropirazol-1-ilo	3,6-dimetil-2-piridilo
5-bromo-3-metilpirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-piridilo
5-bromo-3-cloropirazol-1-ilo	2,5-dimetil-4-piridilo
3,5-dibromopirazol-1-ilo	3,6-dichloro-2-piridilo
5-bromo-3-yodopirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-piridilo

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
5-bromo-3-etilpirazol-1-ilo	2,5-dicloro-4-piridil
5-bromo-3-ptopilpytezol-1-ilo	3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo
5-bromo-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo
5-bromo-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	

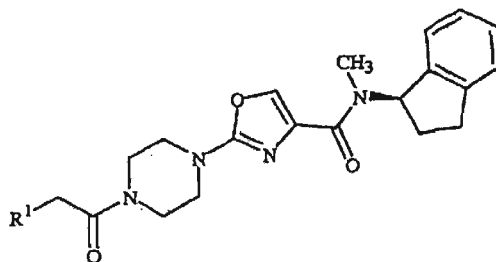
TABLE 8A



<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-metoxifenilo	5-etil-2-metilfenilo
3-bromofenilo	2-metil-5-pmpylfenilo
3-yodofenilo	5-isopropil-2-metiftenilo
3-(trifluorometil)fenilo	2-metil-5-(trifluorometil)fenilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-metil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
3-(pentafluoroetil)fenilo	2-metil-5-(pentafluoroetil)fenilo
3-cianofenilo	5-ciano-2-metilfenilo
3-nitrofenilo	2-mahyl-5-niophonil
2,5-diclorofenilo	5-cloro-2-metoxifenilo
5-bromo-2-clorofenilo	5-bromo-2-metoxifenilo
2-cloro-5-yodofenilo	5-yodo-2-metoxifenilo
2-cloro-5-metilfenilo	2-metoxi-5-mathylfenilo
2-cloro-5-etilfenilo	5-etil-2-metoxifenilo
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	2-metoxi-5-propilfenilo
2-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo
2-cloro-5-(pentafluoroetil)fenilo	2-metoxi-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2-cloro-5-cianofenilo	2-metoxi-5-(pentafluoroetil)fenilo
2-cloro-5-nitrofenilo	5-ciano-2-metoxifenilo
2-bromo-5-clorofenilo	2-metoxi-5-nitrofenilo
2,5-dibromofenilo	5-cloro-2-etilfenilo
2-bromo-5-yodofenilo	5-bromo-2-etilfenilo
2-bromo-5-metilfenilo	2-etil-5-yodofenilo
2-bromo-5-etilfenilo	2-etil-5-metilfenilo
2-bromo-5-propilfenilo	2,5-dietilfenilo
2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo	2-etil-5-propilfenilo
2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-etil-5-(trifluorometil)fenilo
2-bromo-5-(pentafluoroetil)fenilo	2-etil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2-bromo-5-cianofenilo	2-etil-5-(pentafluoroetil)fenilo
2-bromo-5-nitrofenilo	5-ciano-2-etilfenilo
5-cloro-2-metilfenilo	2-etil-5-nitrofenilo

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
5-bromo-2-metilfenilo	3-cloropirazol-1-ilo
5-yodo-2-metilfenilo	3-bromopirazol-1-ilo
2,5-dimetilfenilo	3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-yodopirazol-1-ilo
3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-etilpirazol-1-ilo
3-cianopirazol-1-ilo	5-bromo-3-propilpirazol-1-ilo
3-nitropirazol-1-ilo	5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	5-bromo-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
3-cloro-5-metilpirazol-1-ilo	5-bromo-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
3-bromo-5-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-metilpirazol-1-ilo
3-yodo-5-metilpirazol-1-ilo	3-cloro-5-etilpirazol-1-ilo
3-etil-5-metilpirazol-1-ilo	3-bromo-5-etilpirazol-1-ilo
5-metil-3-propilpirazol-1-ilo	5-etil-3-yodopirazol-1-ilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	3,5-dietilpirazol-1-ilo
5-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	5-etil-3-propilpirazol-1-ilo
5-metil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
3-ciano-5-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
5-metil-3-nitropirazol-1-ilo	5-etil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
5-cloro-3-metilpirazol-1-ilo	3,5-dimetil-2-tienilo
3,5-dicloropirazol-1-ilo	3,5-dicloro-2-tienilo
5-cloro-3-bromopirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-tienilo
5-cloro-3-yodopirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-tienilo
5-cloro-3-etilpirazol-1-ilo	3,6-dimetil-2-piridil
5-cloro-3-propilpirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-piridil
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2,5-dimetyl-4-piridilo
5-cloro-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	3,6-dicloro-2-piridilo
5-cloro-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-piridilo
5-cloro-3-cianopirazol-1-ilo	2,5-dicloro-4-piridilo
5-cloro-3-nitropirazol-1-ilo	3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-bromo-3-metilpirazol-1-ilo	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo
5-bromo-3-cloropirazol-1-ilo	1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo
3,5-dibromopirazol-1-ilo	

TABLA 8B

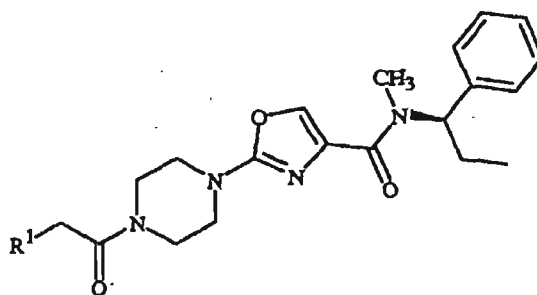


<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-metoxifenilo	2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo
3-bromofenilo	2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
3-yodofenilo	2-bromo-5-(pentafluoroetil)fenilo

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
3-(trifluorometil)fenilo	2-bromo-5-cianofenilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-bromo-5-nitrofenilo
3-(pentafluoroetil)fenilo	5-cloro-2-metilfenilo
3-cianofenilo	5-bromo-2-metilfenilo
3-nitrofenilo	5-yodo-2-metilfenilo
2,5-diclorofenilo	2,5-dimetilfenilo
5-bromo-2-clorofenilo	5-etil-2-metilfenilo
2-cloro-5-yodofenilo	2-metil-5-propilfenilo
2-cloro-5-metilfenilo	5-isopropil-2-metilfenilo
2-cloro-5-etilfenilo	2-metil-5-(trifluorometil)fenilo
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	2-metil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-metil-5-(pentafluoroetil)fenilo
2-cloro-5-(pentafluoroetil)fenilo	5-ciano-2-metilfenilo
2-cloro-5-cianofenilo	2-metil-5-nitrofenilo
2-cloro-5-nitrofenilo	5-cloro-2-metoxifenilo
2-bromo-5-clorofenilo	5-bromo-2-metoxifenilo
2,5-dibromofenilo	5-yodo-2-metoxifenilo
2-bromo-5-yodofenilo	2-metoxi-5-metilfenilo
2-bromo-5-metilfenilo	5-eti-2-metoxifenilo
2-bromo-5-etilfenilo	2-metoxi-5-propilfenilo
2-bromo-5-propilfenilo	2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo
2-metoxi-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	5-cloro-3-metilpirazol-1-ilo
2-metoxi-5-(pentafluoroetil)fenilo	3,5-dicloropirazol-1-ilo
5-cyana-2-metoxifenilo	5-cloro-3-bromopirazol-1-ilo
2-metoxi-5-nitrofenilo	5-cloro-3-yodopirazol-1-ilo
5-cloro-2-etilfenilo	5-cloro-3-etilpirazol-1-ilo
5-bromo-2-etilfenilo	5-cloro-3-propilpirazol-1-ilo
2-etil-5-yodofenilo	5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
2-etil-5-metilfenilo	5-cloro-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
2,5-dietilfenilo	5-cloro-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
2-etil-5-propilfenilo	5-cloro-3-cianopirazol-1-ilo
2-etil-5-(trifluorometil)fenilo	5-cloro-3-nitropirazol-1-ilo
2-etil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	5-bromo-3-metilpirazol-1-ilo
2-etil-5-(pentafluoroetil)fenilo	5-bromo-3-cloropirazol-1-ilo
5-ciano-2-etilfenilo	3,5-dibromopirazol-1-ilo
2-etil-5-nitrofenilo	5-bromo-3-yodopirazol-1-ilo
3-cloropirazol-1-ilo	5-bromo-3-etilpirazol-1-ilo
3-bromopirazol-1-ilo	5-bromo-3-propilpirazol-1-ilo
3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
3-cianopirazol-1-ilo	5-etil-3-metilpirazol-1-ilo
3-nitropirazol-1-ilo	3-cloro-5-etilpirazol-1-ilo
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	3-bromo-5-etilpirazol-1-ilo
3-cloro-5-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-yodopirazol-1-ilo
3-bromo-5-metilpirazol-1-ilo	3,5-dietilpirazol-1-ilo
3-yodo-5-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-propilpirazol-1-ilo
3-etil-5-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-metil-3-propilpirazol-1-ilo	5-etil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	5-etil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
5-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	3,5-dimetil-2-tienilo
5-metil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	3,5-dicloro-2-tienilo
3-ciano-5-metilpirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-tienilo
5-metil-3-nitropirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-tienilo
3,6-dimetil-2-piridilo	2,5-dicloro-4-piridilo
2,5-dimetil-3-piridilo	3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
2,5-dimetil-4-piridilo	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo
3,6-dicloro-2-piridilo	1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo
2,5-dicloro-3-piridilo	

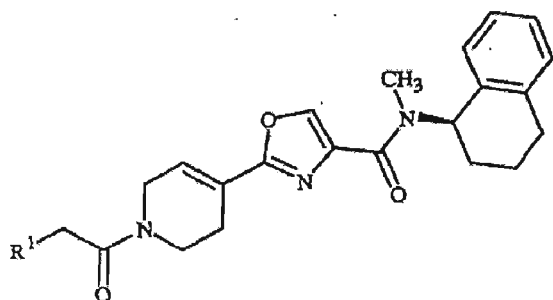
TABLA 8C



<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-metoxifenilo	2-bromo-5-clorofenilo
3-bromofenilo	2,5-dibromofenilo
3-iodafenilo	2-bromo-5-yodofenilo
3-(trifluorometil)fenilo	2-bromo-5-metilfenilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-bromo-5-etilfenilo
3-(pentafluoroetil)fenilo	2-bromo-5-propilfenilo
3-cianofenilo	2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo
3-nitrofenilo	2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2,5-diclorofenilo	2-bromo-5-(pentafluoroetil)fenilo
5-bromo-2-clorofenilo	2-bromo-5-cianofenilo
2-cloro-5-yodofenilo	2-bromo-5-nitrofenilo
2-cloro-5-metilfenilo	5-cloro-2-metilfenilo
2-cloro-5-etilfenilo	5-bromo-2-metilfenilo
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	5-yodo-2-metilfenilo
2-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2,5-dimetilfenilo
2-cloro-5-(pentafluoroetil)fenilo	5-etil-2-metilfenilo
2-cloro-5-cianofenilo	2-metil-5-propilfenilo
2-cloro-5-nitrofenilo	5-isopropil-2-metilfenilo
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	3-nitropirazol-1-ilo
2-metil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	3,5-dimetilpirazol-1-ilo
2-metil-5-(pentafluoroetil)fenilo	3-cloro-5-metilpirazol-1-ilo
5-ciano-2-metilfenilo	3-bromo-5-metilpirazol-1-ilo
2-metil-5-nitrofenilo	3-yodo-5-metilpirazol-1-ilo
5-cloro-2-metoxifenilo	3-etil-5-metilpirazol-1-ilo
5-bromo-2-metoxifenilo	5-metil-3-propilpirazol-1-ilo
5-yodo-2-metoxifenilo	5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-metoxi-5-metilfenilo	5-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
5-etil-2-metoxifenilo	5-metil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
2-metoxi-5-propilfenilo	3-ciano-5-metilpirazol-1-ilo
2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo	5-metil-3-nitropirazol-1-ilo
2-metoxi-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	5-cloro-3-metilpirazol-1-ilo
2-metoxi-5-(pentafluoroetil)fenilo	3,5-dicloropirazol-1-ilo
5-ciano-2-metoxifenilo	5-cloro-3-bromopirazol-1-ilo
2-metoxi-5-nitrofenilo	5-cloro-3-yodopirazol-1-ilo
5-cloro-2-etilfenilo	5-cloro-3-etilpirazol-1-ilo
5-bromo-2-etilfenilo	5-cloro-3-propilpirazol-1-ilo
2-etil-5-yodofenilo	5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
2-etil-5-metilfenilo	5-cloro-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
2,5-dietilfenilo	5-cloro-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
2-etil-5-propilfenilo	5-cloro-3-cianopirazol-1-ilo
2-etil-5-(trifluorometil)fenilo	5-cloro-3-nitropirazol-1-ilo
2-etil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	5-bromo-3-metilpirazol-1-ilo
2-etil-5-(pentafluoroetil)fenilo	5-bromo-3-cloropirazol-1-ilo
5-ciano-2-etilfenilo	3,5-dibromopirazol-1-ilo
2-etil-5-nitrofenilo	5-bromo-3-yodopirazol-1-ilo
3-cloropirazol-1-ilo	5-bromo-3-etilpirazol-1-ilo
3-bromopirazol-1-ilo	5-bromo-3-propilpirazol-1-ilo
3-(trifluoroetil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
3-cianopirazol-1-ilo	5-etil-3-metilpirazol-1-ilo
3-cloro-5-etilpirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-tienilo
3-bromo-5-etilpirazol-1-ilo	3,6-dimetil-2-piridilo
5-etil-3-yodopirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-piridilo
3,5-dietilpirazol-1-ilo	2,5-dimetil-4-piridilo
5-etil-3-propilpirazol-1-ilo	3,6-dicloro-2-piridilo
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-piridilo
5-etil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	2,5-dicloro-4-piridilo
5-etil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
3,5-dimetil-2-tienilo	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo
3,5-dicloro-2-tienilo	1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo
2,5-dimetil-3-tienilo	

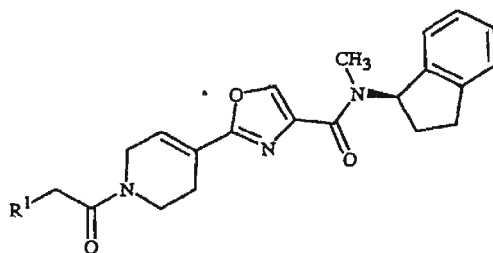
TABLA 9A



<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-metoxifenilo	2-cloro-5-etilfenilo
3-bromofenilo	2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo
3-yodofenilo	2-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
3-(trifluorometil)fenilo	2-cloro-5-(pentafluoroetil)fenilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-cloro-5-cianofenilo
3-(pentafluoroetil)fenilo	2-cloro-5-nitrofenilo
3-cianofenilo	2-bromo-5-clorofenilo
3-nitrofenilo	2,5-dibromofenilo
2,5-diclorofenilo	2-bromo-5-yodofenilo
5-bromo-2-clorofenilo	2-bromo-5-metilfenilo
2-cloro-5-yodofenilo	2-bromo-5-etilfenilo
2-cloro-5-metilfenilo	2-bromo-5-propilfenilo
2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo	2-etil-5-propilfenilo
2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-etil-5-(trifluorometil)fenilo
2-bromo-5-(pentafluoroetil)fenilo	2-etil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2-bromo-5-cianofenilo	2-etil-5-(pentafluoroetil)fenilo
2-bromo-5-nitrofenilo	5-ciano-2-etilfenilo
5-cloro-2-metilfenilo	2-etil-5-nitrofenilo
5-bromo-2-metilfenilo	3-cloropirazol-1-ilo
5-yodo-2-metilfenilo	3-bromopirazol-1-ilo
2,5-dimetilfenilo	3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-etil-2-metilfenilo	3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
2-metil-5-propilfenilo	3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
5-isopropil-2-metilfenilo	3-cianopirazol-1-ilo
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	3-nitropirazol-1-ilo
2-metil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	3,5-dimethylpirazol-1-ilo
2-metil-5-(pentafluoroetil)fenilo	3-cloro-5-metilpirazol-1-ilo
5-ciano-2-metilfenilo	3-bromo-5-metilpirazol-1-ilo
2-metil-5-nitrofenilo	3-yodo-5-metilpirazol-1-ilo
5-cloro-2-metoxifenilo	3-etil-5-metilpirazol-1-ilo
5-bromo-2-metoxifenilo	5-metil-3-propilpirazol-1-ilo
5-yodo-2-metoxifenilo	5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
2-metoxi-5-metilfenilo	5-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
5-etil-2-metoxifenilo	5-metil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
2-metoxi-5-propilfenilo	3-ciano-5-metilpirazol-1-ilo
2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo	5-metil-3-nitropirazol-1-ilo
2-metoxi-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	5-cloro-3-metilpirazol-1-ilo
2-metoxi-5-(pentafluoroetil)fenilo	3,5-dicloropirazol-1-ilo
5-ciano-2-metoxifanil	5-cloro-3-bromopirazol-1-ilo
2-metoxi-5-nitrofenilo	5-cloro-3-yodopirazol-1-ilo
5-cloro-2-etilfenilo	5-cloro-3-etilpirazol-1-ilo
5-bromo-2-etilfenilo	5-cloro-3-propirazol-1-ilo
2-etil-5-yodofenilo	5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
2-etil-5-metilfenilo	5-cloro-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
2,5-dietilfenilo	5-cloro-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
5-cloro-3-cianopirazol-1-ilo	5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-cloro-3-nitropirazol-1-ilo	5-etil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
5-bromo-3-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
5-bromo-3-cloropirazol-1-ilo	3,5-dimetil-2-tienilo
3,5-dibromopirazol-1-ilo	3,5-dicloro-2-tienilo

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
5-bromo-3-yodopirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-tienilo
5-bromo-3-etilpirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-tienilo
5-bromo-3-propirazol-1-ilo	3,6-dimetil-2-piridilo
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-piridilo
5-bromo-3-(2,2,2-trifluorometil)pirazol-1-ilo	2,5-dimetil-4-piridilo
5-bromo-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	3,6-dicloro-2-piridilo
5-etil-3-metilpirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-piridilo
3-cloro-5-etilpirazol-1-ilo	2,5-dicloro-4-piridilo
3-bromo-5-etilpirazol-1-ilo	3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-etil-3-yodopirazol-1-ilo	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo
3,5-dietilpirazol-1-ilo	1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo
5-etil-3-propilpirazol-1-ilo	

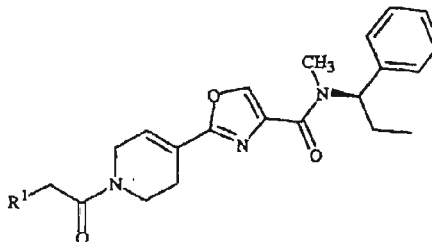
TABLA 9B



<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-metoxifenilo	3-cianofenilo
3-bromofenilo	3-nitrofenilo
3-yodofenilo	2,5-diclorofenilo
3-(trifluorometil)fenilo	5-bromo-2-clorofenilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-cloro-5-yodofenilo
3-(pentafluoroetil)fenilo	2-cloro-5-metilfenilo
2-cloro-5-etilfenilo	5-etil-2-metoxifenilo
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	2-metoxi-5-propilfenilo
2-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo
2-cloro-5-(pentafluoroetil)fenilo	2-metoxi-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2-cloro-5-cianofenilo	2-metoxi-5-(pentafluoroetil)fenilo
2-cloro-5-nitrofenilo	5-ciano-2-metoxifenilo
2-bromo-5-clorofenilo	2-metoxi-5-nitrofenilo
2,5-dibromofenilo	5-cloro-2-etilfenilo
2-bromo-5-yodofenilo	5-bromo-2-etilfenilo
2-bromo-5-metilfenilo	2-etil-5-yodofenilo
2-bromo-5-etilfenilo	2-etil-5-metilfenilo
2-bromo-5-propilfenilo	2,5-dietilfenilo
2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo	2-etil-5-propilfenilo
2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-etil-5-(trifluorometil)fenilo
2-bromo-5-(pentafluoroetil)fenilo	2-etil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2-bromo-5-cianafenilo	2-etil-5-(pentafluorometil)fenilo
2-bromo-5-nitrofenilo	5-ciano-2-etilfenilo

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
5-cloro-2-metilfenilo	2-etil-5-nitrofenilo
5-bromo-2-metilfenilo	3-cloropirazol-1-ilo
5-yodo-2-metilfenilo	3-bromopirazol-1-ilo
2,5-dimetilfenilo	3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-etil-2-metilfenilo	3-(2,2,2-trifluorometil)pirazol-1-ilo
2-metil-5-propilfenilo	3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
5-isopropil-2-metilfenilo	3-cianopirazol-1-ilo
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	3-nitropirazol-1-ilo
2-metil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	3,5-dimetilpirazol-1-ilo
2-metil-5-(pentafluoroetil)fenilo	3-cloro-5-metilpirazol-1-ilo
5-ciano-2-metilfenilo	3-bromo-5-metilpirazol-1-ilo
2-metil-5-nitrofenilo	3-yodo-5-metilpirazol-1-ilo
5-cloro-2-metoxifenilo	3-etil-5-metilpirazol-1-ilo
5-bromo-2-metoxifenilo	5-metil-3-propilpirazol-1-ilo
5-yodo-2-metoxifenilo	5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
2-metoxi-5-metilfenilo	5-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
5-metil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	5-etil-3-metilpirazol-1-ilo
3-ciano-5-metilpirazol-1-ilo	3-cloro-5-etilpirazol-1-ilo
5-metil-3-nitropirazol-1-ilo	3-bromo-5-etilpirazol-1-ilo
5-cloro-3-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-yodopirazol-1-ilo
3,5-dicloropirazol-1-ilo	3,5-dietilpirazol-1-ilo
5-cloro-3-bromopirazol-1-ilo	5-etil-3-propilpirazol-1-ilo
5-cloro-3-yodopirazol-1-ilo	5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-cloro-3-etilpirazol-1-ilo	5-etil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
5-cloro-3-propilpirazol-1-ilo	5-etil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	3,5-dimetil-2-tienil
5-cloro-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	3,5-dicloro-2-tienil
5-cloro-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-tienil
5-cloro-3-cianopirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-tienil
5-cloro-3-nitropirazol-1-ilo	3,6-dimetil-2-piridil
5-bromo-3-metilpirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-piridil
5-bromo-3-cloropirazol-1-ilo	2,5-dimetil-4-piridil
3,5-dibromopirazol-1-ilo	3,6-dicloro-2-piridil
5-bromo-3-yodopirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-piridil
5-bromo-3-etilpirazol-1-ilo	2,5-dicloro-4-piridil
5-bromo-3-propilpirazol-1-ilo	3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo
5-bromo-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo
5-bromo-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	

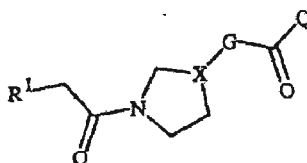
TABLE 9C



<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-metoxifenilo	5-etil-2-metilfenilo
3-bromofenilo	2-metil-5-propilfenilo
3-yodofenilo	5-isopropil-2-metilfenilo
3-(trifluorometil)fenilo	2-metil-5-(trifluorometil)fenilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-metil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
3-(pentafluoroetil)fenilo	2-metil-5-(pentafluoroetil)fenilo
3-cianofenilo	5-ciano-2-metilfenilo
3-nitrofenilo	2-metil-5-nitrofenilo
2,5-diclorofenilo	5-cloro-2-metoxifenilo
5-bromo-2-clorofenilo	5-bromo-2-metoxifenilo
2-cloro-5-yodofenilo	5-yodo-2-metoxifenilo
2-cloro-5-metilfenilo	2-metoxi-5-metilfenilo
2-cloro-5-etilfenilo	5-etil-2-metoxifenilo
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	2-metoxi-5-propilfenilo
2-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-metoxi-5-(trifluorometil)fenilo
2-cloro-5-(pentafluoroetil)fenilo	2-metoxi-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2-cloro-5-cianofenilo	2-metoxi-5-(pentafluoroetil)fenilo
2-cloro-5-nitrofenilo	5-ciano-2-metoxifenilo
2-bromo-5-clorofenilo	2-metoxi-5-nitrofenilo
2,5-dibromofenilo	5-cloro-2-etilfenilo
2-bromo-5-yodofenilo	5-bromo-2-etilfenilo
2-bromo-5-metilfenilo	2-etil-5-yodofenilo
2-bromo-5-etilfenilo	2-etil-5-metilfenilo
2-bromo-5-propilfenilo	2,5-dietilfenilo
2-bromo-5-(trifluoroetil)fenilo	2-etil-5-propilfenilo
2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo	2-etil-5-(trifluorometil)fenilo
2-bromo-5-(pentafluorometil)fenilo	2-etil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenilo
2-bromo-5-cianofenilo	2-etil-5-(pentafluoroetil)fenilo
2-bromo-5-nitrofenilo	5-ciano-2-etilfenilo
5-cloro-2-metilfenilo	2-etil-5-nitrofenilo
5-bromo-2-metilfenilo	3-cloropirazol-1-ilo
5-yodo-2-metilfenilo	3-bromopirazol-1-ilo
2,5-dimetilfenilo	3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-yodopirazol-1-ilo
3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	5-bromo-3-etilpirazol-1-ilo
3-cianopirazol-1-ilo	5-bromo-3-propilpirazol-1-ilo
3-nitropirazol-1-ilo	5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	5-bromo-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
3-cloro-5-metilpirazol-1-ilo	5-bromo-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
3-bromo-5-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-metilpirazol-1-ilo
3-yodo-5-metilpirazol-1-ilo	3-cloro-5-etilpirazol-1-ilo
3-etil-5-metilpirazol-1-ilo	3-bromo-5-etilpirazol-1-ilo
5-metil-3-propilpirazol-1-ilo	5-etil-3-yodopirazol-1-ilo
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	3,5-dietilpirazol-1-ilo
5-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	5-etil-3-propilpirazol-1-ilo
5-metil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
3-ciano-5-metilpirazol-1-ilo	5-etil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo
5-metil-3-nitropirazol-1-ilo	5-etil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo
5-cloro-3-metilpirazol-1-ilo	3,5-dimetil-2-tienilo
3,5-dicloropirazol-1-ilo	3,5-dicloro-2-tienilo
5-cloro-3-bromopirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-tienilo
5-cloro-3-yodopirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-tienilo
5-cloro-3-etilpirazol-1-ilo	3,6-dimetil-2-piridilo
5-cloro-3-propilpirazol-1-ilo	2,5-dimetil-3-piridilo
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	2,5-dimetil-4-piridilo
5-cloro-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-ilo	3,6-dicloro-2-piridilo
5-cloro-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-ilo	2,5-dicloro-3-piridilo
5-cloro-3-cianopirazol-1-ilo	2,5-dicloro-4-piridilo
5-cloro-3-nitropirazol-1-ilo	3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo
5-bromo-3-metilpirazol-1-ilo	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo
5-bromo-3-cloropirazol-1-ilo	1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo
3,5-dibromopirazol-1-ilo	

TABLA 10



<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>Q</u>
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naphtbalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-26	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-26	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-26	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-26	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tehahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	-26	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X*</u>	<u>G**</u>	<u>O</u>
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-26	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-26	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenil	X ¹	G-26	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-26	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenil	X ¹	G-26	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-26	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-26	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-26	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenil	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenil	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-indanilamino
3,5-dimethylpirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-indanilamino

<u>R¹</u>	<u>X*</u>	<u>G**</u>	<u>O</u>
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-26	(1R)-N-metil-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-26	N,2-dimetil-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-26	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-26	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-26	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-26	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-26	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-26	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-26	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-26	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-26	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-26	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-26	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-y1	X ¹	G-26	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-26	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-26	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-26	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
3,5-diobromopyrazo)-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naphthalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X*</u>	<u>G**</u>	<u>O</u>
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X1	G-27	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-27	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-27	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-27	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-27	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,S-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-y]	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-27	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-27	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-27	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-27	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-27	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	0-27	(1R)-N-metil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-27	(1R)-N-metil-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1-indanilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-27	N,2-dimetil-1-indanilamino
2,5-diclorofenil	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenil	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-27	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2,5-diclorofenil	X ¹	G-27	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2-choro-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-27	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2,5-dimetilfenil	X ¹	G-27	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-27	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2,5-diclorofenil	X ¹	G-27	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-27	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2,5-dimetilfenil	X ¹	G-27	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-27	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-oxo-1-indanilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-27	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	0-36	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	0-36	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	0-36	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-fenilpropilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-36	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-36	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-36	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-36	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-ilo	X ¹	G-36	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-36	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-36	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-36	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-36	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-36	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-36	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹ X ¹	G-36	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftaknilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-36	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-36	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	0-36	(1R)-N-metil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	0-36	(1R)-N-metil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-36	(1R)-N-metil-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-36	N,2-dimetil-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1-indanilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-timetil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-timetil-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-metil-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-36	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2,5-diclorofenil	X ¹	G-36	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-36	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2,5-dimetilfenil	X ¹	G-36	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-36	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-meetil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2,5-diclorofenil	X ¹	G-36	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-36	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2,5-dimetilfenil	X ¹	G-36	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-36	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-36	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2,5-diclorofenil	X ¹	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenil	X ¹	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-1	N,2,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-1	N,2,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-1	N,2,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-1	N,2,2-dimetil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-1	N,2,2-dimetil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-1	N,2,2-dimetil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-1	N,2,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-dimetil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-dimetil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-dimetil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo ^{X¹} G-2	X ¹	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>Q</u>
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1,7,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X*</u>	<u>G**</u>	<u>O</u>
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X1	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X1	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X1	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X1	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X1	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X1	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X1	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X1	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X1	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X1	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X1	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X1	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X1	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X1	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X1	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X1	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X1	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X1	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X1	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X1	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X1	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X1	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X1	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X1	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X1	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X1	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X1	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X1	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X1	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X1	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X1	G-2	N,2-dimthyl-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X1	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X1	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X1	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ¹	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ¹	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ¹	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ¹	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ²	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ²	G1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ²	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ²	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ²	G1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tebahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ²	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ²	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-Metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo X ²	X ²	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ²	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ²	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ²	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ²	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ²	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ²	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ²	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ²	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ²	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ²	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
2,5-diclorofenilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,1-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1,7,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-clorofenilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X*</u>	<u>G**</u>	<u>O</u>
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naphthdenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ²	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetylfenilo	X ²	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,2,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ²	G-2	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-ilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ²	G-2	N,2-dimetil-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimethyl-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ²	G-2	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ²	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ²	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ²	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ²	G-2	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ²	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ²	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2 metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ²	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil 3-oxo-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ²	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ²	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ²	G-2	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ³	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

R1	X*	G**	O
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ³	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ³	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ³	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5 metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naphmalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-ilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naphthalenilamino
2-cloro-1-(trifluorometil)fenilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ³	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ³	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenilo	X ³	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ³	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ³	G-1	N-metil-4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	O-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ³	G-1	N,2-dimetil-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ³	G-1	N,2,2-trimetil-1-indanilamino
2,5-dichlorofenilo	X ³	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ³	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ³	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ³	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>O</u>
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-hidroxi-1-indanilamino
2,5-diclorofenilo	X ³	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo	X ³	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2,5-dimetilfenilo	X ³	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenilo	X ³	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo	X ³	G-1	N-metil-3-oxo-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ³	G-1	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ⁵	G-1	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ⁶	G-1	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ⁷	G-1	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ⁸	G-1	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ⁴	G-2	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ⁵	G-2	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ⁶	G-2	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ⁷	G-2	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ⁸	G-2	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-1-fenilcicloprop-1-ilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	X ¹	G-1	N-metil-1-fenilcicloprop-1-ilamino

Notas:

* R² es H.** R^{3a} es H.

Formulación/Utilidad

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

Las formulaciones útiles incluyen composiciones líquidas y sólidas. Las composiciones líquidas incluyen soluciones (incluyendo concentrados emulsionables), suspensiones, emulsiones (incluyendo microemulsiones y/o suspoemulsiones) y similares, que opcionalmente pueden espesarse generando geles. Los tipos generales de composiciones líquidas acuosas son concentrado soluble, concentrado en suspensión, suspensión para cápsulas, emulsión concentrada, microemulsión y suspo-emulsión. Los tipos generales de composiciones líquidas no acuosas son concentrado emulsionable, concentrado microemulsionable, concentrado dispersable y dispersión en aceite.

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

Las formulaciones pulverizables se extienden típicamente en un medio adecuado antes de la pulverización. Dichas formulaciones líquidas y sólidas se formulan para diluirse fácilmente en el medio de pulverización, normalmente agua. Los volúmenes de pulverización pueden oscilar de aproximadamente uno a varios miles de litros por hectárea, pero más típicamente están en el intervalo de aproximadamente diez a varios cientos de litros por hectárea. Las formulaciones pulverizables pueden mezclarse en depósito con agua u otro medio adecuado para el tratamiento foliar mediante aplicación aérea o terrestre, o para aplicación al medio de crecimiento de la planta. Las formulaciones líquidas y secas pueden dosificarse directamente en sistemas de irrigación por goteo o dosificarse en el surco durante el plantado. Las formulaciones líquidas y sólidas pueden aplicarse sobre semillas de cultivos como tratamientos para semillas antes del plantado para proteger las raíces en desarrollo y otras partes subterráneas de la planta y/o el follaje a través de la absorción sistémica.

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

	Por ciento en peso		
	Principio activo	Diluyente	Tensioactivo
Gránulos, Comprimidos y Polvos Dispersables en Agua y Solubles en Agua	0,001-90	0-99,9999	0-15
Dispersiones, Suspensiones, Emulsiones, Disoluciones en aceite (incluyendo Concentrados Emulsionables)	1-50	40-99	0-50
Polvos finos	1-25	70-99	0-5
Gránulos y Pélets	0,001-99	5-99,999	0-15
Composiciones de Alta Resistencia	90-99	0-10	0-2

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

Diluyentes líquidos incluyen, por ejemplo, agua, *N,N*-dimetilalcanamidas (por ejemplo, *N,N*-dimetilformamida), limoneno, dimetilsulfóxido, *N*-alquilpirrolidonas (por ejemplo, *N*-metilpirrolidinona), etilenglicol, trietilenglicol, propilenglicol, dipropilenglicol, polipropilenglicol, carbonato de propileno, carbonato de butileno, parafinas (por ejemplo, aceites

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

Las composiciones sólidas y líquidas de la presente invención a menudo incluyen uno o más tensioactivos. Los tensioactivos pueden clasificarse como no iónicos, aniónicos o catiónicos. Tensioactivos no iónicos útiles para las presentes composiciones incluyen, pero no se limitan a: alcoxilatos de alcohol tales como alcoxilatos de alcohol basados en alcoholes naturales y sintéticos (que pueden ser ramificados o lineales) y preparados a partir de los alcoholes y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos; etoxilatos de amina, alcanolamidas y alcanolamidas etoxiladas; triglicéridos alcoxilados tales como aceites de soja, ricino y colza etoxilados; alcoxilatos de alquilfenol tales como etoxilatos de octilfenol, etoxilatos de nonilfenol, etoxilatos de dinonilfenol y etoxilatos de dodecilfenol (preparados a partir de los fenoles y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); polímeros de bloques preparados a partir de óxido de etileno u óxido de propileno y polímeros de bloques inversos donde los bloques terminales se preparan a partir de óxido de propileno; ácidos grasos etoxilados; ésteres y aceites grasos etoxilados; ésteres metílicos etoxilados; triestirilfenol etoxilado (incluyendo los preparados a partir de óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); ésteres de ácido graso, ésteres de glicerol, derivados basados en lanolina, ésteres de polietoxilato tales como ésteres de ácidos grasos de sorbitán polietoxilados, ésteres de ácidos grasos de sorbitol polietoxilados y ésteres de ácidos grasos de glicerol polietoxilados; otros derivados de sorbitán tales como ésteres de sorbitán; tensioactivos poliméricos tales como copolímeros aleatorios, copolímeros de bloques, resinas alquídicas de peg(polietilenglicol), polímeros de injerto o tipo peine y polímeros de estrella; polietilenglicoles (pegs); ésteres de ácidos grasos de polietilenglicol; tensioactivos basados en silicona; y derivados de azúcar tales como ésteres de sacarosa, alquilpoliglicósidos y alquilpolisacáridos.

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

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

También son útiles para las presentes composiciones mezclas de tensioactivos no iónicos y aniónicos o mezclas de tensioactivos no iónicos y catiónicos. Tensioactivos no iónicos, aniónicos y catiónicos y sus usos recomendados se describen en una variedad de referencias publicadas incluyendo McCutcheon's Emulsifiers y Detergents, annual American y International Editions publicado por McCutcheon's Division; The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely y Wood, En cyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., Nueva York, 1964; y A. S. Davidson y B. Milwidsky, Synthetic Detergents, séptima edición, John Wiley y Sons, Nueva York, 1987.

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

Será evidente que el alcance de las composiciones de la presente invención en relación con los compuestos de Fórmula 1 junto con el alcance de las composiciones de la presente invención en relación con los compuestos que tienen una fórmula correspondiente a la Fórmula 1 excepto que R¹ es 4- fluorofenil y el alcance de las composiciones de la presente invención en relación con el compuesto de 2-[1-[(2-clorofenil) acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1-feniletil]-4-tiazolcarboxamida, corresponde a un alcance de las composiciones de los compuestos que tienen una fórmula correspondiente a la Fórmula 1 tal como se describe más arriba donde la condición (a) y la condición (c) se omiten (es decir, solamente la condición (b) está vigente).

El compuesto de Fórmula 1 (o el compuesto que tiene una fórmula correspondiente a la Fórmula 1 excepto que R¹ es 4-fluorofenilo o el compuesto de 2-[1-[(2-clorofenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1-feniletil]-4- tiazolcarboxamida, según sea el caso) y cualquier otro ingrediente activo se incorporan típicamente en las presentes composiciones disolviendo el ingrediente activo en un disolvente o triturando en un diluyente líquido o seco. Las disoluciones, que incluyen los concentrados emulsionables, pueden prepararse por simple mezcla de los ingredientes. Si el disolvente de una composición líquida destinada al uso como un concentrado emulsionable es inmiscible en agua, se añade típicamente un emulsionante para emulsionar el disolvente que contiene el agente activo en la dilución con agua. Las suspensiones de ingrediente activo, con diámetros de partícula de hasta 2.000 µm, pueden molerse en húmedo usando molinos de medios para obtener partículas con diámetros promedio o por debajo de 3 µm. Las suspensiones acuosas puede convertirse en concentrados de suspensión acabados (véase, por ejemplo, el documento U.S. 3.060.084) o procesarse adicionalmente mediante secado por pulverización para formar gránulos dispersables en agua. Las formulaciones secas requieren habitualmente procedimientos de molienda en seco, que producen diámetros de partícula promedio en el intervalo de 2 a 10 µm. Los polvos de espolvoreo y los polvos pueden prepararse mediante mezcla y habitualmente molienda como con un molino de martillos o un molino de energía de fluidos. Los gránulos y los pélets pueden prepararse por pulverización del material activo sobre vehículos granulares preformados o por técnicas de aglomeración. Véase Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, 4 de diciembre de 1967, páginas 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4° Edición, McGraw-Hill, Nueva York, 1963, páginas 8-57 y subsiguientes, y WO 91/13546. Los pélets pueden prepararse tal como se describe en el documento U.S. 4.172.714. Los gránulos dispersables en agua y solubles en agua pueden prepararse como se muestra en los documentos U.S. 4.144.050, U.S. 3.920.442 y DE 3.246.493. Los comprimidos pueden prepararse como se muestra en los documentos U.S. 5.180.587, U.S. 5.232.701 y U.S. 5.208.030. Las películas pueden prepararse como se muestra en los documentos GB 2.095.558 y U.S. 3.299.566.

Para información adicional respecto a la técnica de formulación véase T.S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" en Pesticide Chemistry y Bioscience, The Food- Environment Challenge, T. Brooks y T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, páginas 120-133. Véase también U.S. 3.235.361, Col. 6, línea 16 a Col. 7, línea 19 y Ejemplos 10-41; U.S. 3.309.192, Col. 5, línea 43 a Col. 7, línea 62 y Ejemplos 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 y 169-182; U.S. 2.891.855, Col. 3, línea 66 a Col. 5, línea 17 y Ejemplos 1-4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley y Sons, Inc., Nueva York, 1961, páginas 81-96; Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; y Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

En los siguientes Ejemplos, todos los porcentajes están en peso y todas las formulaciones se preparan por las formas convencionales. Los números de compuesto se refieren a los compuestos en las Tablas de Índice A

Ejemplo A

Concentrado de Alta Potencia

Compuesto	98,5%
-----------	-------

	aerogel de sílice	0,5%	
	sílice fino amorfo sintético	1,0%	
	Ejemplo B		
	Polvo humectable		
5	Compuesto 1	65,0%	
	Dodecifenol polietilenglicol éter	2,0%	
	Ligninsulfonato sódico	4,0%	
	Silicoaluminato sódico	6,0%	
	Montmorillonita (calcinada)	23,0%	
10	Ejemplo C		
	Gránulo		
	Compuesto 1		10,0%
	Gránulos de atapulgita (bajo contenido en materia volátil, 0,71/0,30 mm; Tamices U.S.S. N° 25-50)		90,0%
	Ejemplo D		
15	Suspensión acuosa		
	Compuesto 1	25,0%	
	Atapulguita hidratada	3,0%	
	Ligninsulfonato de calcio en bruto	10,0%	
	Fosfato dihidrógeno de sodio	0,5%	
20	Agua	61,5%.	
	Ejemplo E		
	Pélet extruido		
	Compuesto 1	25,0%	
	Sulfato sódico anhidro	10,0%	
25	Ligninsulfonato de calcio en bruto	5,0%	
	Alquilnaftalenosulfonato sódico	1,0%	
	Bentonita de calcio/magnesio	59,0%	
	Ejemplo F		
	Microemulsión		
30	Compuesto 1	1,0%	
	Triacetina	30,0%	
	alquilpolliglicosida C8-C10	30,0%	
	gliceril monooleato	19,0%	
	agua	20,0%.	

Ejemplo G

Concentrado Emulsionable

Compuesto 1	10,0%
éster metílico de ácido graso C8-C10	70,0%
5 hexoleato de polioxietilensorbitol	20,0%

Las formulaciones de concentrado emulsionable son composiciones particularmente apropiadas para los compuestos de la presente invención que son sólidos amorfos que se ablandan solamente unos pocos grados más arriba de temperatura ambiente (por ejemplo, Compuesto 149).

Si bien puede utilizarse una amplia variedad de disolventes inmiscibles en agua y tensioactivos en dichas formulaciones de concentrado emulsionable, los ésteres de glicerol tal como triglicéridos caprílicos/cápricos como disolvente y mezclas de resina alquídica de peg(polietilenglicol (peg) y éster de sorbitol etoxilato como tensioactivo funcionan especialmente bien. Utilizando estos ingredientes, el concentrado emulsionable puede prepararse simplemente añadiendo el éster de sorbitol etoxilato a disolvente de triglicéridos caprílicos/cápricos, y después calentando la mezcla agitada mecánicamente hasta aproximadamente 50 °C. El compuesto de Fórmula 1 se añade a la mezcla, que se agita enérgicamente hasta que el compuesto de Formula 1 se disuelve completamente. El calentamiento se interrumpe, se añade la resina alquídica de peg, y la mezcla se agita hasta que el líquido se enfría hasta temperatura ambiente. El Ejemplo H ilustra dicha composición formulada. Esta formulación es altamente eficaz en el curado de la enfermedad oídio de la vid y tizón tardío de la papa.

Ejemplo H

Concentrado Emulsionable

Compuesto 149	10,0%
triglicérido caprílico/cáprico	70,0%
éster de sorbitol etoxilato	12,0%
resina alquídica de peg	8,0%

Los compuestos de la presente invención son útiles como agentes de control de enfermedades de plantas. Por ello, la presente invención además comprende un procedimiento para controlar enfermedades vegetales provocadas por patógenos vegetales micóticos que comprende aplicar a la planta o porción de la misma que debe ser protegida, o a la semilla de la planta o plántula que debe ser protegida, una cantidad efectiva de un compuesto de la invención o una composición funguicida que contiene dicho compuesto. Los compuestos y/o composiciones de la presente invención proporcionan control de enfermedades provocadas por un amplio espectro de patógenos vegetales micóticos en las clases Basidiomycete, Ascomycete, Oomycete y Deuteromycete. Los mismos son efectivos en el control de un amplio espectro de enfermedades vegetales, particularmente patógenos foliares de cultivos de plantas ornamentales, vegetales, de campo, cereales, y frutas. Estos patógenos incluyen: Oomycetes, incluyendo enfermedades de *Phytophthora* tal como *Phytophthora infestans*, *Phytophthora megasperma*, *Phytophthora parasitica*, *Phytophthora cinnamoni*, *Phytophthora capsici*; enfermedades de *Pythium* tal como *Pythium aphanidermatum*; y enfermedades en la familia de Peronosporaceae, tal como *Plasmopara viticola*, especie *Peronospora* (incluyendo *Peronospora tabacina* y *Peronospora parasitica*), especie *Pseudoperonospora* (incluyendo *Pseudoperonospora cubensis*), y *Bremia lactucae*; Ascomycetes, incluyendo enfermedades de *Alternaria* tal como *Alternaria solani* y *Alternaria brassicae*; enfermedades de *Guignardia* tal como *Guignardia bidwelii*; enfermedades de *Venturia* tal como *Venturia inaequalis*; enfermedades de *Septoria* tal como *Septoria nodorum* y *Septoria tritici*; enfermedades de mildiú polvoroso tal como especie *Erysiphe* (incluyendo *Erysiphe graminis* y *Erysiphe polygoni*), *Uncinula necator*, *Sphaerotheca fuliginea*, y *Podosphaera leucotricha*; *Pseudocercospora* herpotrichoides; enfermedades de *Botrytis* tal como *Botrytis cinerea*; *Monilinia fructicola*; enfermedades de *Sclerotinia* tal como *Sclerotinia sclerotiorum*; *Magnaporthe grisea*; *Phomopsis viticola*; enfermedades de *Helminthosporium* tal como *Helminthosporium tritici repens*; *Pyrenophora teres*; anthracnose diseases such tal como *Glomerella* o especie *Coletotrichum* (tal como *Coletotrichum graminicola* y *Colletotrichum orbiculare*); y *Gaeumannomyces graminis*; Basidiomycetes, incluyendo enfermedades de tizón provocadas por la especie *Puccinia* (tal como *Puccinia recondita*, *Puccinia striiformis*, *Puccinia hordei*, *Puccinia graminis*, y *Puccinia arachidis*); *Hemileia vastatrix*; y *Phakopsora pachyrhizi*; otros patógenos incluyendo la especie *Rhizoctonia* (tal como *Rhizoctonia solani*); enfermedades de *Fusarium* tal como *Fusarium roseum*, *Fusarium graminearum*, *Fusarium oxysporum*; *Verticillium dahliae*; *Sclerotium rolfsii*, *Rhynchosporium secalis*; *Cercosporidium personatum*, *Cercospora arachidicola* y *Cercospora beticola*; y otros

géneros y especies estrechamente relacionadas con estos patógenos.

Además de su actividad fungicida, las composiciones o combinaciones también tienen actividad contra bacterias tal como *Erwinia amylovora*; *Xanthomonas campestris*; *Pseudomonas syringae*; y otras especies relacionadas. Es notable el control proporcionado a la enfermedad provocada por las clases Ascomycete y Oomycete. Es particularmente notable el control proporcionado a la enfermedad provocada por la clase Oomycete.

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

Las tasas de aplicación de estos compuestos pueden estar influenciadas por muchos factores del ambiente y deben determinarse en las condiciones reales de uso. El follaje normalmente puede protegerse cuando es tratado a una tasa de menor que aproximadamente 1 g/ha a aproximadamente 5,000 g/ha del principio activo. La semilla y plántulas normalmente pueden protegerse cuando la semilla es tratada a una tasa de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 10 g por kilogramo de semilla.

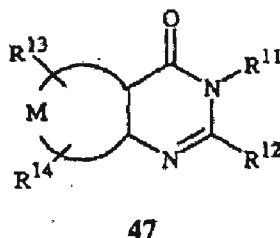
Los compuestos de la presente invención también pueden mezclarse con uno o más de otros insecticidas, fungicidas, nematocidas, bactericidas, acaricidas, reguladores del crecimiento, quimioesterilizantes, semioquímicos, repelentes, atrayentes, feromonas, estimulantes de la alimentación, otros compuestos biológicamente activos para formar un pesticida multi-componente que proporciona un espectro incluso más amplio de protección agrícola. Los ejemplos de dichos protectores agrícolas con los que los compuestos de la presente invención pueden formularse son: insecticidas tales como abamectina, acefato, azinfos-metilo, bifentrina, buprofezina, carbofurano, clorfenapir, clorpirifos, clorpirifos-metilo, ciflumentofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, deltametrina, diafenthiurona, diazinona, diflubenzurona, dimeflutrina, dimetoato, dinotefurano, esfenvalerato, fenoxycarb, fenpropatrina, fenvalerato, fipronilo, flonicamida, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, fonofos, imidacloprid, indoxacarb, isofenfos, malationa, metaflumizona, metaldehído, metamidofos, metidationa, metomilo, metopreno, metoxiclor, metoflutrina, monocrotofos, noviflumurona, oxamilo, paratión, paratión-metilo, permetrina, forato, fosadona, fosmet, fosfamidona, pirimicarb, profenofos, proflutrina, pirafuprol, piretrina, piridililo, piriprol, piriproxifeno, rotenona, espiromesifeno, espirotetramato, sulprofos, tebufenozida, teflutrina, terbufos, tetraclorvinfos, tiamectoxam, tralometrina, triclofona y triflururona; fungicidas tales como acibenzolar, aldimorf, amisulbrom, azaconazol, azoxistrobina, benalaxilo, benomilo, bentiavalicarb, bentiavalicarb-isopropilo, binomial, bifenilo, bitertanol, blastidina-S, mezcla de Bordeaux (sulfato tribásico de cobre), boscalida/nicobifeno, bromuconazol, bupirimato, butiobato, carboxina, carpropamid, captafol, captano, carbendazim, cloroneb, clorotalonilo, clozolinato, clotrimazol, oxicloruro de cobre, sales de cobre tales como sulfato de cobre e hidróxido de cobre, ciazofamid, ciflunamida, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinilo, diclofluanid, diclocimet, diclomezina, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, dimetomorf, dimoxistrobina, diniconazol, diniconazol-M, dinocap, discostrobina, ditianona, dodemorf, dodina, econazol, etaconazol, edifenfos, epoxiconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fencaramid, fenfuram, fenhexamida, fenoxanilo, fenpiclonilo, fenpropidina, fenpropimorfo, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferfurazoato, ferimzona, fluazinam, fludioxonilo, flumetover, fluopicolida, fluoxastrobina, fluquinconazol, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutolanilo, flutriafol, folpet, fosetil-aluminio, fuberidazol, furalaxilo, furametapir, hexaconazol, himexazol, guazatina, imazalilo, imibenconazol, iminotadina, iodicarb, ipconazol, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb, isoconazol, isoprotiolano, kasugamicina, kresoxim-metilo, mancozeb, mandipropamida, maneb, mapanipirina, mefenoxam, mepronilo, metalaxilo, metconazol, metasulfocarb, metiram, metominostrobin, mepanipirima, metiram, metrafenona, miconazol, miclobutanilo, neo-asozina (metanoarseniato férrico), nuarimol, octilina, ofurace, orisastrobina, oxadixilo, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxina, paclobutrazol, penconazol, penciclorona, pentiopirad, perfurazoato, ácido fosfónico, ftalida, picobenzamida, picoxistrobina, polioxina, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propamocarbhidrocloruro, propiconazol, propineb, proquinazid, protioconazol, piraclostrobina, priazofos, pirifenox, pirimetanilo, pirifenox, pirrolnitrina, piroquilon, quinconazol, quinoxifeno, quitozeno, siltiofam, simeconazol, espiroxamina, estreptomycin, azufre, tebuconazol, tecrazeno, tecloftalam, tecnazeno, tetraconazol, tiabendazol, tifulazamida, tiofanato, tiofanato-metilo, tiram, tiadinilo, tolclorfen-metilo, tolifluranid, triadimefona, triadimenol, triarimol, triazóxido, tridemorf, trimopramida, tricloclazol, trifloxistrobina, triforina, triticonazol, uniconazol, validamicina, vinclozolina, zinab, ziram y zoxamida; nematocidas tales como aldoxycarb y fenamifos; bactericidas tales como estreptomycin; acaricidas tales como amitraz, quinometionato, clorobencilato, cihexatina, dicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenpropatrina, fenpiroximato, hexitiazox, propargita, piridabeno y tebufenpirad; y agentes biológicos tales como *Bacillus thuringiensis*, *Bacillus thuringiensis* delta endotoxina, baculovirus, y bacterias entomopatógenas, virus y hongos. Las descripciones de varios compuestos comercialmente disponibles detallados más arriba pueden encontrarse en The Pesticide Manual, 12ª edición, C.D.S. Thomlin, ed., British Crop Protection Council, 2000. Para las realizaciones en las que se utilizan uno o más de estos diversos auxiliares de mezclado, la relación en peso de estos diversos auxiliares de mezclado (en total) y el compuesto de Fórmula 1 típicamente está entre aproximadamente 1:100 y

aproximadamente 3000:1. Son notables las relaciones en peso enter aproximadamente 1: 30 y aproximadamente 300: 1 (por ejemplo las relaciones enter aproximadamente 1: 1 y aproximadamente 30:1). Será evidente que incluyendo estos componentes adicionales puede expandirse el espectro de enfermedades controladas más allá del espectro controlado por el compuesto de Fórmula 1 solo.

- 5 Son notables las combinaciones de un compuesto de Fórmula 1, un compuesto que tiene una fórmula correspondiente a la Fórmula 1 excepto que R^1 es 4-fluorofenilo y/o el compuesto de 2-[1-[(2-clorofenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1-feniletil]-4-tiazolcarboxamida con al menos otro fungicida. Son particularmente notables dichas composiciones donde el otro fungicida tiene diferente sitio de acción con al menos otro fungicida. Son particularmente notables las composiciones que además del compuesto de Fórmula 1 (o el compuesto
- 10 que tiene una fórmula correspondiente a la Fórmula 1 excepto que R^1 es 4-fluorofenilo o el compuesto de 2-[1-[(2-clorofenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1-feniletil]-4-tiazolcarboxamida, según sea el caso) incluyen al menos un compuesto seleccionado del grupo que consiste en
- (1) fungicidas de alquilenobis(ditiocarbamato);
 - (2) cimoxanili;
 - 15 (3) fungicidas de fenilamida;
 - (4) fungicidas de pirimidinona;
 - (5) clorotalonilo;
 - (6) carboxamidas que actúan en el complejo II del sitio de transferencia electrónico respiratorio mitocondrial micótico;
 - 20 (7) quinoxifen;
 - (8) metrafenona;
 - (9) ciflufenamid;
 - (10) ciprodinil;
 - (11) compuestos de cobre;
 - 25 (12) fungicidas de ftalimida;
 - (13) fosetil-aluminio;
 - (14) fungicidas de benzimidazol;
 - (15) ciazofamid;
 - (16) fluazinam;
 - 30 (17) iprovalicarb;
 - (18) propamocarb;
 - (19) validomicina;
 - (20) fungicidas de diclorofenil dicarboximida;
 - (21) zoxamida;
 - 35 (22) fluopicolida;
 - (23) mandipropamid;
 - (24) amidas de ácido carboxílico que actúan en la biosíntesis de fosfolípidos y deposición de la pared celular;
 - (25) dimetomorf;
 - (26) inhibidores de la biosíntesis de esteroides distintos de DMI;

- (27) inhibidores de la biosíntesis de demetilasa en esteroles;
 (28) fungicidas del complejo bc₁; y
 sales apropiadas para uso agrícola de los compuestos de (1) a (285).
 Fungicidas de pirimidinona (grupo (4))

5 Los fungicidas de pirimidinona incluyen los compuestos de Fórmula 47



en la que

M forma un fenilo, tiofeno o anillo de piridina condensado;

R¹¹ es alquilo C₁-C₆;

10 R¹² es alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆;

R¹³ es halógeno; y

R¹⁴ es hidrógeno o halógeno.

15 Los fungicidas de pirimidinona se describen en la Publicación de Solicitud de Patente Mundial WO 94/26722, Patente Estadounidense N° 6.066.638, Patente Estadounidense N° 6.245.770, Patente Estadounidense N° 6.262.058 y Patente Estadounidense N° 6.277.858.

Son notables los fungicidas de pirimidinona seleccionados del grupo:

- 6-bromo-3-propil-2-propilo-4(3H)-quinazolinona,
 6,8-diiodo-3-propil-2-propilo-4(3H)-quinazolinona,
 6-yodo-3-propil-2-propilo-4(3H)-quinazolinona (proquinazid),
 20 6-cloro-2-propoxi-3-propiltieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona,
 6-cloro-2-propoxi-3-propiltieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona,
 7-cloro-2-propoxi-3-propiltieno[3,2-d]pirimidin-4(3H)-ona,
 6-cloro-2-propoxi-3-propiltieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona,
 6,7-cloro-2-propoxi-3-propiltieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona,
 25 3-(ciclopropilmetil)-6-yodo-2-(propiltio)pirido[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona.

Inhibidores de la biosíntesis de demetilasa en esteroles (27)

30 Los inhibidores de la biosíntesis de esteroles controlan los hongos inhibiendo las enzimas en la vía de biosíntesis de esteroles. Los fungicidas inhibidores de demetilasa tienen un sitio de acción común dentro de la vía de biosíntesis de esteroles micóticos; que es la inhibición de la demetilación en la posición 14 de lanosterol o 24-metileno dihidrolanosterol, que son precursores de los esteroides en hongos. Los compuestos que actúan en este sitio a menudo son referidos como inhibidores de demetilasa, fungicidas DMI, o DMIs. La enzima demetilasa a veces es referida mediante otros nombres en la literatura bioquímica, incluyendo citocromo P-450 (14DM). La enzima demetilasa se describe por ejemplo en J. Biol. Chem. 1992, 267, 13175-79 y referencias citadas en el mismo.

Los fungicidas DMI caen dentro de varias clases químicas: azoles (incluyendo triazoles e imidazoles), pirimidinas, piperazinas y piridinas. Los triazoles incluyen azaconazol, bromuconazol, cyproconazol, difenoconazol, diniconazol (incluyendo dinicanazol-M), epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, prothioconazol, quinconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol y uniconazol. Los imidazoles incluyen clotrimazol, econazol, imazalilo, isoconazol, miconazol, oxpoconazol, procloraz y triflumizol. Las pirimidinas incluyen fenarimol, nuarimol y triarimol. Las piperazinas incluyen triforina. Las piridinas incluyen butiobato y pirifenox. Los investigadores bioquímicos han demostrado que todos los fungicidas mencionados más arriba son fungicidas DMI tal como se describe en K. H. Kuck, et al. in *Modern Selective Fungicides - Properties, Application y Mechanism of Action*, H. Lyr (Ed.), Gustav Fischer Verlag: Nueva York, 1995, 205-258.

Fungicidas del complejo bc₁ (28)

Se sabe que los fungicidas de estrobilurina tal como fluoxastrobina, orysastrobina, picoxistrobina, pyraclostrobina y trifloxistrobina tienen un modo de acción fungicida que inhibe el complejo bc₁ en la cadena a de respiración mitocondrial (Angew. Chem. Int. Ed. 1999, 38, 1328-1349). Otros fungicidas de estrobilurina incluyen (2E)-2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluor-4-pirimidinil]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metil-etanamida, (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-(2-[[[(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-etiliden]amino]oxi]metil]fenil)etanamida, (2E)-2-metoxiimino)-N-metil-2-[2-[(E)-[1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi]imino]metil] fenil)etanamida. Otros compuestos que inhiben el complejo bc₁ en la cadena de respiración mitocondrial incluyen famoxadona y fenamidona. El complejo bc₁ a veces es referido mediante otros nombres en la literatura bioquímica, incluyendo el complejo III de la cadena de transferencia electrónica, y ubihidroquinona:citocromo c oxidoreductasa. El mismo está identificado únicamente por el número de la Comisión de Enzimas EC1,10,2,2. El complejo bc₁ se describe en, por ejemplo, J. Biol. Chem. 1989, 264, 14543-48; Methods Enzymol. 1986, 126, 253-71; y las referencias citadas en el mismo.

Otros grupos fungicidas

Los alquilenobis(ditiocarbamato)s (1) incluyen compuestos tal como mancozeb, maneb, propineb y zineb.

Las fenilamidas (3) incluyen compuestos tal como metalaxilo, benalaxilo, furalaxilo y oxadixilo.

Las carboxamidas (6) incluyen compuestos tal como boscalid, carboxin, fenfuram, flutolanilo, furametpir, mepronil, oxicarboxin, thifluzamida, pentiopirad, y N-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida (PCT Publicación de Solicitud de Patente WO 2003/010149) son conocidas por inhibir la función mitocondrial mediante la rotura del complejo II (succinato dehidrogenasa) en la cadena de transporte electrónico respiratorio.

Los compuestos de cobre (11) incluyen compuestos tal como oxiclورو de cobre, sulfato de cobre y hidróxido de cobre, incluyendo composiciones tal como mezcla de Bordeaux (sulfato e cobre tribásico).

Las ftalimidas (12) incluyen compuestos tal como folpet y captan.

Los fungicidas de benzimidazol (14) incluyen benomil y carbendazim.

Los fungicidas de diclorofenil dicarboximida (20) incluyen chlozolinato, diclozolina, iprodiona, isovalediona, miclozolina, procimidona y vinclozolina.

Los inhibidores de la biosíntesis de esteroides distintos de DMI (26) incluyen fungicidas de morfolina y piperidina. Las morfolininas y piperidininas son inhibidores de la biosíntesis de esteroides que han demostrado que inhiben las etapas en la vía de biosíntesis de esteroides en un punto más tarde que las inhibiciones logradas por la biosíntesis de esteroides DMI (27). Las morfolininas incluyen aldiform, dodorm, fenpropimorf, tridemorf y trimorfamida. Las piperidininas incluyen fenpropidina.

Será evidente que el alcance de los procedimientos para controlar las enfermedades de plantas de la presente invención relacionados con los compuestos de Fórmula 1 junto con el alcance de los procedimientos para controlar enfermedades de plantas de la presente invención relacionados con los compuestos que tienen una fórmula correspondiente a la Fórmula 1 excepto que R¹ es 4-fluorofenilo y el alcance de los procedimientos para controlar las enfermedades de plantas de la presente invención relacionados con los compuesto de 2-[1-[(2-clorofenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1-feniletil]4-tiazolocarboxamida, corresponde a un alcance de procedimientos para controlar las enfermedades de plantas con compuestos que tienen una fórmula correspondiente a la Fórmula 1 tal como se describe más arriba donde la condición (a) y la condición (c) son omitidas (es decir, solamente la condición (b) está vigente). Son notables estos procedimientos donde son controladas las enfermedades de plantas causadas por patógenos vegetales micóticos Oomycete.

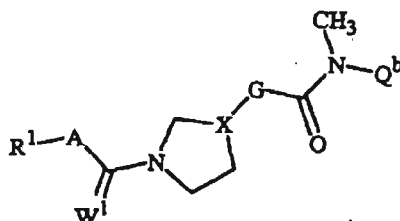
El control de enfermedades de plantas comúnmente se logra mediante la aplicación de una cantidad efectiva de un compuesto de la presente invención previo o posterior a la infección, a la parte de la planta que debe ser protegida tal como las raíces, tallos, follaje, fruta, semillas, tubérculos o bulbos,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

Las tasas de aplicación para estos compuestos pueden estar afectadas por muchos factores del ambiente y deben determinarse en las condiciones de uso reales. El follaje normalmente puede protegerse cuando es tratado a una tasa de menos que aproximadamente 1 g/ha a aproximadamente 5.000 g/ha del principio activo. La semilla y plántulas normalmente pueden protegerse cuando la semilla es tratada a una tasa de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 10 g por kilogramo de semilla.

Los siguientes ensayos demuestran la eficacia de control de los compuestos de la presente invención sobre patógenos específicos.

La protección de control de patógenos lograda por los compuestos no se limita, sin embargo, a estas especies. Véanse las Tablas de Índice A y B para las descripciones de compuestos. Las siguientes abreviaturas se utilizan en las Tablas de Índice que siguen: t significa terciario, s significa secundario, Ph significa fenilo. La abreviatura "Ej." significa "Ejemplo" y está seguido por un número que indica en qué ejemplo el compuesto es preparado. Las Tablas de Índice A y B detallan el peso molecular del ion progenitor de mayor abundancia isotópica (M+1) formado por la adición de H⁺ (peso molecular de 1) a la molécula, observado por espectrometría en masa ionización química de presión atmosférica (AP⁺).

TABLA DE ÍNDICE A



<u>Comp.</u>	<u>R¹</u>	<u>A</u>	<u>W¹</u>	<u>X</u>	<u>G(*)</u>	<u>O^b</u>	<u>AP⁺ (M+1)</u>
1	2-clorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1S)-1-feniletilo	482
2	2-clorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	482
3	fenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	448
4	4-metoxifenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	478
5	3-metoxifenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	478
6	2,4-diclorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	516
7	2,6-diclorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	516
8	2-bromofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	526
9	2-fluorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	466
10	2-trifluorometilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	516
11	2-metilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	462
12	4-metilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	462
13	4-clorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	482
14	4-trifluorometilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	516
15	3-clorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	482
16	3-trifluorometilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	516
17	2,3-diclorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	516
18	3-trifluorometilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	517
19	3-bromofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	526
20	3-nitrofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	493
21	3-yodofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	574

<u>Comp.</u>	<u>R¹</u>	<u>A</u>	<u>W1</u>	<u>X</u>	<u>G(*)</u>	<u>O^b</u>	<u>AP⁺ (M+1)</u>
22	3,5-di-CF ₃ -Ph	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	584
23	3-fluorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	466
24	3-trifluorometil-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	X1	G-1	(1R)-1-feniletilo	505
25	2-clorofenilo	CH ₂	O	X ²	G-1	(1R)-1-feniletilo	483
26	3-clorofenilo	CH ₂	O	X ²	G-1	(1R)-1-feniletilo	483
27	3-bromofenilo	CH ₂	O	X ²	G-1	(1R)-1-feniletilo	527
28	3-nitrofenilo	CH ₂	O	X ²	G-1	(1R)-1-feniletilo	494
29	3-yodofenilo	CH ₂	O	X ²	G-1	(1R)-1-feniletilo	575
30	3-trifluorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1 ^a	(1R)-1-feniletilo	550
31	3-metilsulfonilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	526
32	3-bromofenilo	CH ₂	O	X ²	G-37	(1R)-1-feniletilo	527
33	2-fluoro-3-clorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	500
34	4-fluoro-3-trifluorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	534
35	4-fluoro-3-clorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	500
36	3-metilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	462
37	3,5-difluorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	484
38	3,4-difluorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	484
39	2-cloro-5-trifluorometilfenilo	CH ₂	O	X1	G-1	(1R)-1-feniletilo	550
40	3-fluoro-5-trifluorometilfenilo	CH ₂	O	X1	G-1	(1R)-1-feniletilo	534
41	2-metoxifenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	478
42	2-fluoro-3-trifluorometilfenilo	CH ₂	O	X1	G-1	(1R)-1-feniletilo	534
43	3,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	476
44	2,5-difluorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	484
45	2-trifluorometoxifenilo	CH ₂	O	X1	G-1	(1R)-1-feniletilo	532
46	2,3-difluorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	484
47	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	476
48	3-metiltienilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	494
49	3-trifluorometoxifenilo	CH ₂	O	X1	G-1	(1R)-1-feniletilo	532
50	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ²	G-2	(1R)-1-pbeniletilo	461
51	2-cloro-5-trifluorometilfenilo	CH ₂	O	X2	G-2	(1R)-1-feniletilo	535
52	3-metilfenilo	CH ₂	O	X ²	G-2	(1R)-1-feniletilo	447
53	2-metoxifenilo	CH ₂	O	X ²	G-2	(1R)-1-feniletilo	463
54	3-bromofenilo	CH ₂	O	X ²	G-2	(1R)-1-feniletilo	511
55	3-trifluorometilfenilo	CH ₂	O	X ²	G-2	(1R)-1-feniletilo	501
56	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-(3-trifluorometilofenil)-etilo	544
57	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-(2-fluorofenil)etilo	494
58 (Ej. 1)	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X1	G-1	(1R)-1-fenilpropil	490
59	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-(4-metoxifenil)etilo	506
60	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-(4-clorofenil)etilo	510

Comp.	R ¹	A	W	X	G(*)	O ^b	AP ⁺ (M+1)
61	3-metilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1-(3,5-dicloro-2-piridinil)etilo	531
62	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-(4-metilofenil)-etilo	490
63	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-(4-bromofenil)-etilo	554
64	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-(4-fluorofenil)-etilo	494
65	3,5-dimetilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	466
66	3-trifluorometilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1-(3-piridinil)etilo	517
67	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-(3-trifluorometilofenil)-etilo	544
68	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1S)-1-feniletilo	476
69	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-(3-metoxifenil)etilo	506
70 (Ej. 5)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X1	G-1	(1R)-1-feniletilo	520
71	4-bromopirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	516
72	3-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	452
73	4-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	452
74 (Ej. 4)	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X2	G-37	(1R)-1-feniletilo	477
75	3-trifluorometilfenilo	CH ₂	O	-	G-1	1-(2-piridinil)etilo	517
76	3-trifluorometilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1-(4-piridinil)etilo	517
77	2,5-diclorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	516
78	2-etoxifenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	492
79	3-etoxifenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	492
80	2-metil-5-fluorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	481
81	2-metoxi-5-bromofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	556
82	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X1	G-1	1-fenilbutilo	504
83	piridin-3-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	449
84	piridin-4-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	449
85	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1-fenilpentilo	518
86	2-bromo-5-clorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	560
87	2,5-bis-trifluorometilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	584
88	2-tienil	CH ₂	O	X1	G-1	(1R)-1-feniletilo	454
89	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1-(2-tienil)etilo	482
90	2-metoxicarbonil-metilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	521
91	2-metiltiazol-4-ilo	CH ₂	O	X1	G-1	(1R)-1-feniletilo	469
92	2,5-dimetiltiazol-4-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	483
93	3-t-butilisoxazol-5-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	495
94	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1-(2-piridinil)etilo	477
95	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1-(3-piridinil)etilo	477
96	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1-fenil-2-metilopropan-1-ilo	504
97	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1-fenil-3-metilobutan-1-ilo	518
98	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1,2,3,4-tetrahydro-2-naftalenilo	502

Comp.	R ¹	A	W ¹	X	G(*)	O ^b	AP ⁺ (M+1)
99	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X1	G-1	1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenilo	502
100	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	indan-1-ilo	488
101	2,4-dimetilpyrrol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	465
102	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	fenil-cianometilo	487
103	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1-fenil-2-propen-1-ilo	488
104	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1-fenil-3-buten-1-ilo	502
105	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-naftaleniletilo	526
106	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-2-naftaleniletilo	526
107	3-bromofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-fenilpropil	540
108	3-trifluorometilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-fenilpropil	531
109	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1-fenil-2-metoxietilo	506
110 (Ej. 3)	2,5-diclorofenilo	CH ₂	O	X1	G-1	(1R)-1-fenilpropil	530
111 (Ej. 11)	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X1	G-1	(1R)-1-(3,5-dicloro-2-piridinil)etilo	545
112	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1-(2,5-dimetilo-3-tienil)etilo	510
113	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1-(2,5-dimetilo-3-furil)etilo	494
114	2-cloro-5-trifluorometilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-fenilpropil	564
115	2-metoxifenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-fenilpropil	492
116	3-metilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-fenilpropil	476
117 (Ej. 2)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-fenilpropil	534
118	3,5-dimetilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-fenilpropil	480
119	3-etilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	476
120	3,5-dimetiltriazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	467
121	2,4-dimetilimidazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	466
122	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	507
123	2-propil-4-trifluorometilimidazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	548
124	2-metil-5-trifluorometilfenilo	CH ₂	O	X1	G-1	(1R)-1-feniletilo	530
125	2-metboxi-5-metilfenilo	CH ₂	O	X1	G-1	(1R)-1-feniletilo	492
126	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-2	(1R)-1-feniletilo	460
127	3-isopropil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X1	G-1	(1R)-1-feniletilo (1R)-1-feniletilo	494
128	2-etil-4-metilimidazol-1-ilo	CH ₂	O	X1	G-1	(1R)-1-feniletilo	480
129	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X1	G-1	6,7,8,9-tetrahydro-5Hbenzociclohepten-5-ilo	516
130	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(R)-indan-1-ilo	488
131	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(S)-indan-1-ilo	488

Comp.	R ¹	A	W ¹	X	G(*)	O ^o	AP ⁺ (M+1)
132 (Ej. 6)	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	502
133	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1S)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	502
134	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	4,5,6,7-tetrahidro-benzo[b]thien-4-ilo	508
135	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	4,5,6,7-tetrahidro-benzo[b]furan-4-ilo	492
136	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	tiochroman-4-ilo	520
137	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	chroman-4-ilo	504
138	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	2,3-dihidro-benzofuran-3-ilo	490
139	2-isopropilimidazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-2	(1R)-1-feniletilo	480
140	3-ciclohexiltriaazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-2	(1R)-1-feniletilo	521
141	4-t-butilimidazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	494
142	3-s-butil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	508
143	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(R)-1-(3,5-dicloro-2-piridinil)etil	589
144 (Ej. 6)	2,5-diclorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	542
145 (Ej. 6)	2-metoxifenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	504
146 (Ej. 6)	2-metoxi-5-metilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	518
147 (Ej. 6)	2-cloro-5-trifluorometilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	576
148 (Ej. 6)	2-metoxi-5-bromofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	582
149 (Ej. 6)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	546
150 (Ej. 6)	3,5-dimetilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	492
151 (Ej. 8)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	530
152 (Ej. 7)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-fenilpropilo	518
153 (Ej. 9)	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-2	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	486
154 (Ej. 10)	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-2	(1R)-1-fenilpropilo	474
155	3-trifluorometilfenilo	NH	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	518
156	3-trifluorometilfenilo	NH	O	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	517
157	2-metoxifenilo	NH	O	X ¹	G-2	(1R)-1-feniletilo	464
158	3-trifluoremetilfenilo	NH	O	X ¹	G-2	(1R)-1-feniletilo	502
159	2-metoxi-5-metilfenilo	NH	S	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	509
160	3-trifluorometilfenilo	NH	S	X ¹	G-1	(1R)-1-feniletilo	533
161	2-clorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	bencilo	468
162	2-clorofenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	2-feniletilo	482

Comp.	R ¹	A	W ¹	X	G(*)	O ^b	AP ⁺ (M+1)
163	3-trifluorometilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	3-piridinilmetilo	503
164	3-metilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	3-piridilmetilo	449
165	3-metilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	2-piridilmetilo	449
166	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-ciclohexiletilo	483
167	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	bencilo	463
168	3-trifluorometilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	2-piridilmetilo	503
169	3-trifluorometilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	4-piridilmetilo	503
170	3-metilphenil	CH ₂	O	X ¹	G-1	4-piridilmetilo	449
171	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	3,4-dimetoxi-2-feniletilo	536
172	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	isotiochroman-4-il 1,2,3,4-	520
173	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	tetrahidrophenanthren-1-ilo	552
174	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	ciclohexilo	454
175	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1,1-dimetil-2-(4-fluorofenil)etilo	522
176	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	3-metilciclohex-1-ilo	468
177	2,5-dimetilfenilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	2,3-dimetilciclohex-1-ilo	482
178	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(R)-1-indan-1-ilo	533
(Ej. 19)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	chroman-4-ilo	548
179	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	tiochroman-4-ilo	564
180	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	6,7,8,9-tetrahidro-5H-benzociclohepten-5-ilo	560
181	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	4,5,6,7-tetrahidrobenzo[b]tien-4-ilo	552
182	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	4,5,6,7-benzo[b]furan-4-ilo	536
183	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	2,3-dihidro-benzofuran-3-ilo	534
184	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	isotiocroman-4-ilo	564
185	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	2-fenilciclohex-1-ilo	574
186	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1S)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	546
187	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1,2,3,4-tetrahidro-1-neaftalenilo	546
188	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	5-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	562
(Ej. 23)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	6-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	562
189	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R,4S)-1,2,3,4-tetrahidro-4-hidroxi-1-naftalenilo	562
190	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1		
191 (h)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	4-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	560
(Ej. 26)							
192 (b)							

Comp.	R ¹	A	W ¹	X	G(*)	O ^b	AP [*] (M+1)
193 (°) (Ej.22)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	2-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	560
194	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	trans-2-hidroxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	562
195	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	trans-2-acetoxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	604
196	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	5-metoxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	576
197	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	6-metoxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	576
198	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	7-metoxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	576
199	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	4,4-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	574
200 (h)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1S,2R)-2-hidroxiindan-1-ilo	548
201	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	6-cloro-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	580
202	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-11	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	530
203	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-23	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	530
204	3-metil-2-piridilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	489
205	2-piridinilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	475
206 ^h (Ej.28)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R,4R)-1,2,3,4-tetrahidro-4-hidroxi-1-naftalenilo	562
207	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	trans-2-hidroxi-indan-1-ilo	548
208 (Ej.16)	3-trifluorometil-5-etilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	560
209 (Ej.15)	3,5-dietilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1-naftale _{ale} hidro-1-naftanilo	520
210 (Ej.14)	3,5-bis-trifluorometil-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	600
211 (Ej. 27)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	4-oxo-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	560
212	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	cis-4-acetoxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	604
213	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	cis-4-metoxi-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	576
214	6-cloro-2-piridilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	509

<u>Comp.</u>	<u>R¹</u>	<u>A</u>	<u>W¹</u>	<u>X</u>	<u>G(*)</u>	<u>O^b</u>	<u>AP⁺</u> <u>(M+1)</u>
215	4,6-dimetil-2-piridilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	503
216	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-20	(1R)-1-feniletilo	505
217	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-30	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	530
218 (Ej.31)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	544
219	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1,2,3,4-tetrahidro-4-naftalenol-1-ilo	619
						metilcarbamate (aa)	547
220 (Ej.30)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ²	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	566
221	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	5-cloroidan-1-ilo	560
222 (Ej. 21)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	2,2-dimetilindan-1-ilo	546
223	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-15	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	548
224	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ²	G-7	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	531
225	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-8	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	546
226 (Ej.20)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	2-metilindan-1-ilo	560
227	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-37 (d)	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	572
228	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	trans-2-etil-1,2-dihidro-1-naftalenilo	590
229	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	3-carbometoksi-indan-1-ilo	558
230	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ²	G-1	trans-2-metil-1,2-dihidro-1-naftalenilo	529
231(Ej.18)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-26	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	530
232(Ej.32)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-36	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	529
233(Ej.33)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-27	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	560
234 ^h (Ej.24)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R,2S)-1,2,3,4-tetrahidro-2-metil-1-naftalenilo	562
235	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	3-hidroximetilindan-1-ilo	

Comp.	R ¹	A	W ¹	X	G(*)	O ^b	AP ⁺ (M+1)
236 (Ej. 25)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	2,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	574
237	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1-metil-1-feniletilo	534
238 (Ej. 12)	3,5-dicloro-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-G-1-1-naftalenilo	532
239 (*)	3-trifluorometil-5-t-butilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	588
240	3-trifluorometil-5-isopropilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	574
241	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ⁸	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil	561
242 (f)	metilpirazol-1-ilo 3-trifluorometil-5-	CH ₂	O	X ⁸	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	597
243	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1-(2-metilfenil)etilo	534
244	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	Éster metílico de ácido (αS)- α-fenilacético	564
245	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	ácido (αS)- α-fenilacético	550
246 (Ej. 17)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-49	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	532
247	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(αS)- α-fenilacetamida	549
248	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	bencilo	506
249 (Ej. 13)	3-trifluorometil-5-cloropirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	566
250	3-bifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1-(2-fluorofenil)etilo	538
251	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1-(2-clorofenil)etilo	554
252	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1-(2-bromofenil)etilo	598
253	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1-(4-clorofenil)-2,2,2-trifluorometilo	608
254 (g)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	perhidronaftalen-1-ilo	552
255	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	1-(2-metoxifenil)etilo	550
256	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-55	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	531
257	3-cloro-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	512
258	3-bromo-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X ¹	G-1	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilo	556

Comp.	R ¹	A	W ¹	X	G(*)	O ^b	AP ⁺ (M+1)
259	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	CH ₂	O	X1	G-1	2-feniletilo	520

Notas:

(*) R^{3a} es H a menos que se indique lo contrario.

(a) en la que R^{3a} es 5-Cl.

5 (b) Mezcla de cis y trans.

- (c) Mezcla de cis y trans.
 (d) R^{3a} es CH₃.
 (e) contiene 40 % de isómero 3-t-butil-5-trifluorometil-pirazol-1-ilo.
 (f) Sal de HCl.
 5 (g) Mezcla de cis y trans.
 (h) Mezcla racémica con su enantiómero
 (aa) medio 1,2,3,4-tetrahidro-4-naftalenol-1-il metilcarbamato

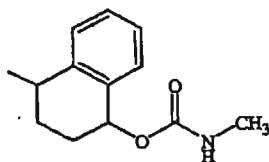
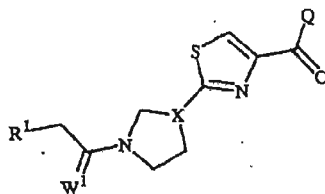


TABLA DE INDICE B



10

Comp.	R ¹	X	W ¹	Q	AP ⁺ (M+1)
260	2-clorofenilo	X ¹	O	(1S)-1-feniletilamino	468
261	2-clorofenilo	X ¹	O	(1R)-1-feniletilamino	468
262	2-clorofenilo	X ¹	O	bencilamino	454
263	2-clorofenilo	X ¹	O	1-metil-1-feniletilamino	482
264	2-clorofenilo	X ¹	O	2-feniletilamino	468
265	2-clorofenilo	X ¹	O	2-indanilamino	480
266	2-clorofenilo	X ¹	O	1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino	494
267	2-clorofenilo	X ¹	O	1,2,3,4-tetrahidroisoquinolino	481
268	2-clorofenilo	X ¹	O	4-metilpiperidino	446
269	2-clorofenilo	X ¹	O	2-(3-piridinil)pyrrolidino	495
270	3-trifluorometilfenilo	X ¹	O	(1R)-1-(4-bromofenil)etilamino	580
271	3-bromofenilo	X ¹	O	(1R)-1-(4-fluorofenil)etilamino	530
272	3-bromofenilo	X ¹	O	(1R)-1-ciclohexiletilamino	518

<u>Comp.</u>	<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>W¹</u>	<u>Q</u>	AP ⁺ (M+1)
273	3-bromofenilo	X ¹	O	(1R)-1-(4-nitrofenil)etilamino	557
274	3-bromofenilo	X ¹	O	(1R)-1-(4-metilfenil)etilamino	526
275	3-bromofenilo	X ¹	O	(1R)-1-(2-trifluorometilfenil)etilamino	580
276	3-bromofenilo	X ¹	O	(1R)-1-(2-fluorofenil)etilamino	530
277	3-bromofenilo	X ¹	O	(1R)-1-(3-trifluorometilfenil)etilamino	580
278	3-bromofenilo	X ¹	O	(1R)-1-fenilpropilamino	526
279	3-bromofenilo	X ¹	O	(1R)-1-(4-metoxifenil)etilamino	542
280	3-bromofenilo	X ¹	O	(1R)-1-(4-clorofenil)etilamino	546
281	3-bromofenilo	X ¹	O	(1R)-1-(3-metoxifenil)etilamino	542
282	3-bromofenilo	X ¹	O	α -cianobencilamino	523
283	2,5-dimetilfenilo	X ¹	O	(1R)-1-feniletilamino	463
284	2,5-dimetilfenilo	X ¹	O	(1R)-N-alil-1-feniletilamino	502
285	2,5-dimetilfenilo	X ¹	O	(1R)-N-isopropil-1-feniletilamino	504
286	2,5-dimetilfenilo	X ¹	O	(1R)-N-etil-1-feniletilamino	490
287	2,5-dimetilfenilo	X ¹	O	(1R)-N-propil-1-feniletilamino	504
288	2,5-dimetilfenilo	X ¹	O	2-(3,4-dimetoxifenil)etilamino	522
289 (Ej. 29)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X1	S	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil amino	562
290	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X1	O	2-(4-clorofenil)pyrrolidino	566
291	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ¹	O	7(1H)-oxo-2,3,8,8a-tetrahidrociclopent[ij] isoquinolino	558
292 (i)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ²	O	tetrahidro-1-naftalenilamino	575
293 (j)	3-trifluorometil-5-3-trifluorometil-5-	X ² X ²	O	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil amino	561
294	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X1	O	1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino	532
295	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X1	O	2,3-dihidro-1H-isoindolo	504
296	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X1	O	1,2,3,4-tetrahidroisoquinolino	518

Comp.	R ¹	X	W ¹	Q	AP ⁺ (M+1)
297	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ¹	O	6,7-dimetoxi-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolino	578
298	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ¹	O	1-metil-2,3-dihidro-1H-isoindolo	518
299	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ¹	O	perhidroisoquinolino	524
300	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ¹	O	perhidroquinolino	524
301	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ¹	O	(1R)-1-feniletilamino	506
302	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ¹	O	(1R)-N-etil-1-feniletilamino	534
303	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ¹	O	(1R)-N-propil-1-feniletilamino	548
304	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ¹	O	(1R)-N-feniletilamino	546
305	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ¹	O	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino	532
306	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ¹	O	(1R)-N-etil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino	560
307	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ¹	O	piperidino	470
308	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ¹	O	4-metilpiperidino	484
309	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ¹	O	4,4-dimetilpiperidino	498
310	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ¹	O	1,2,3,6-tetrahidropiridino	468
311	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ¹	O	4-fenil-1,2,3,6-tetrahidropiridino	544
312	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ¹	O	3-metilpiperidino	484
313	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ¹	O	3,3-dimetilpiperidino	498
314	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ¹	O	2-feniletilamino	506
315 ^(k) (Ej. 31)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ¹	O	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino	544
316 (l)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo	X ¹	O	(1R)-N-metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino	572

Notas:

(i) tiene sustitución de 2,6-dimetilo en los átomos de carbono adyacentes al átomo de nitrógeno unido a C (=W¹) del anillo piperazina que comprende X.

5 (j) tiene sustitución de 2-metilo en uno de los átomos de carbonos adyacentes al átomo de nitrógeno unido a C (=W¹) del anillo piperazina que comprende X.

(k) El anillo que comprende X contiene un enlace doble carbono-carbono y de ese modo es un anillo 1,2,3,4-tetrahidropiridina.

(l) tiene puente de etileno entre las posiciones 2 y 6 (en los átomos de carbono adyacentes al átomo de nitrógeno) del anillo piperidina que comprende X (para formar un sistema anular de 8-azabicyclo[3,2,1]octano).

10 Ejemplos biológicos de la invención

Protocolo general para preparar las suspensiones de ensayo para el Ensayo A- E:

15 Los Compuestos de Ensayo primero se disolvieron en acetona en una cantidad igual a 3 % del volumen final y después se suspendieron en la concentración deseada (en ppm) en acetona y agua purificada (mezcla 50/50 en volumen) que contenía 250 ppm del tensioactivo Trem[®] 014 (ésteres de alcohol polihídrico). Las suspensiones de ensayo resultantes después se utilizaron en los ensayos A-E. La pulverización de una suspensión de ensayo 200 ppm hasta el punto de escurrimiento en las plantas de ensayo fue el equivalente de una tasa de 500 g/ha.

ENSAYO A

20 La suspensión de ensayo se pulverizó hasta el punto de escurrimiento sobre plántulas de pepino. El día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Pseudoperonospora cubensis* (el agente causal de oídio de pepino) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20 °C durante 24 horas, y después se movieron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 6 días, después de lo que se realizaron las clasificaciones de enfermedad.

ENSAYO B

25 Se inocularon plántulas de vid con una suspensión de esporas de *Plasmopara viticola* (el agente causal de oídio de la vid) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20 °C durante 24 horas. Después de un corto período de secado, se pulverizó la suspensión de ensayo hasta el punto de escurrimiento sobre las plántulas de vid y después se movieron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 5 días, después de lo que se colocaron las unidades de ensayo de nuevo en

una atmósfera saturada a 20 °C durante 24 horas. Después de la remoción, se realizaron las clasificaciones de enfermedad.

ENSAYO C

- 5 La suspensión de ensayo se pulverizó hasta el punto de escurrimiento sobre plántulas de tomate. El día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Phytophthora infestans* (el agente causal de tizón tardío de tomate) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20 °C durante 24 horas, y después se movieron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 5 días, después de lo que se realizaron las clasificaciones de enfermedad.

ENSAYO D

- 10 Se inocularon plántulas de tomate con una suspensión de esporas de *Phytophthora infestans* (el agente causal de tizón tardío de tomate) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20 °C durante 17 horas. Después de un corto período de secado, se pulverizó la suspensión de ensayo hasta el punto de escurrimiento sobre las plántulas de tomate y se movieron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 4 días, después de lo que se realizaron las clasificaciones de enfermedad.

ENSAYO E

- 15 La suspensión de ensayo se pulverizó hasta el punto de escurrimiento sobre plántulas de trigo. El día siguiente las plántulas se inocularon con polvo de esporas de *Erysiphe graminis* f. sp. *Tritici* (el agente causal de mildiú polvoroso de trigo) y se incubaron en una cámara de crecimiento a 20 °C durante 7 días, después de lo que se realizaron las clasificaciones de enfermedad.
- 20 Además de los ensayos A-E, los compuestos también se pulverizaron sobre plantas de tomate inoculadas con *Botrytis cinerea* 24 horas después del tratamiento y dos grupos separados de plantas de trigo se inocularon con *Puccinia recondita* o *Septoria nodorum* 24 horas después del tratamiento. Los compuestos ensayados no fueron efectivos contra estos patógenos en la condición de estos ensayos.

Protocolo general para preparar las suspensiones de ensayo para el Ensayo P:

- 25 Los Compuestos de Ensayo primero se disolvieron en sulfóxido de dimetilo (DMSO) en una cantidad igual a 4 % del volumen final y después se suspendieron en la concentración deseada (en ppm) en acetona y agua purificada (mezcla 30/70 en volumen). Las suspensiones de ensayo resultantes después se utilizaron en el Ensayo F. la pulverización de una suspensión de ensayo 250 ppm sobre las plantas de ensayo fue el equivalente de una tasa de 250 g/ha.

ENSAYO F

- 30 Una suspensión de ensayo se pulverizó sobre plántulas de pepino. El día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Pseudoperonospora cubensis* (el agente causal de oídio de pepino) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20 °C durante 24 horas, y después se movieron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 6 días, después de lo que se realizaron las clasificaciones de enfermedad.
- 35 Los resultados para los Ensayos A-P se proporcionan en la Tabla A. En la tabla, una clasificación de 100 indica 100 % de control de la enfermedad y una clasificación de 0 indica ningún control de la enfermedad (con respecto a los controles). Un guión (-) indica ningún resultado de ensayo.

TABLA A

Comp. N°	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F
1	0	20	56	-	0	-
2	100	67	96	-	50	86
3	0	53	0	-	21	-
4	0	14	0	-	21	-
5	0	0	33	-	0	-
6	0	28	0	-	41	-
7	0	0	0	-	0	-
8	99	31	29	-	0	93
9	82	28	0	-	0	-
10	0	20	0	-	0	95
11	0	31	91	-	0	97
12	0	6	0	-	0	-
13	0	0	0	-	0	-
14	0	6	0	-	0	-
15	100	76	98	-	0	99
16	100	95	100	-	0	99
17	0	4	0	-	79	-
18	100	80	100	-	0	96
19	100	99	100	-	0	-
20	100	0	93	-	0	99
21	100	99	99	-	21	100
22	93	20	31	-	21	-
23	90	6	29	-	86	-
24	100	100	100	-	21	-
25	97	61	62	-	0	-
26	97	17	90	-	0	-
27	100	8	99	-	0	92
28	99	5	31	-	0	-
29	100	33	98	-	0	47
30	0	0	0	-	0	-
31	0	0	0	-	0	-
32	87	0	95	-	0	93
33	96	51	91	-	29	-
34	85	48	31	-	0	-
35	88	66	93	-	0	97
36	100	99	100	-	91	95
37	85	23	80	-	87	-
38	0	45	0	-	55	43
39	100	100	100	-	85	100
40	98	76	60	-	0	-
41	100	94	100	-	0	82
42	99	31	100	-	21	-
43	100	83	100	-	21	-
44	97	57	98	-	21	0
45	95	70	98	-	0	-
46*	-	0	0	0	0	-

ES 2 427 153 T3

Comp. N°	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F
47	100	100	100	-	96	100
48	0	6	29	-	49	39
49	97	83	67	-	85	-
50	-	55	100	99	0	100
51	-	20	100	96	0	100
52	-	20	100	74	0	96
53	-	20	100	89	0	-
54	-	11	100	69	0	50
55	-	7	100	92	0	47
56	-	31	93	0	0	-
57	-	100	100	94	50	99
58	-	100	100	94	0	100
59	-	84	98	63	21	93
60	-	95	93	42	67	47
61	-	2	69	0	0	-
62	-	92	92	24	29	43
63	-	100	100	93	0	99
64	-	100	100	95	92	93
65	-	92	100	100	0	100
66	-	2	54	42	0	-
67	-	10	68	0	0	99
68	-	47	100	16	0	95
69	-	88	100	0	29	100
70	-	100	100	100	0	-
71	-	34	74	0	0	-
72	-	1	91	66	0	-
73	-	2	75	9	0	-
74	-	27	99	92	0	-
75	-	16	100	72	0	0
76	-	0	79	0	0	-
77	-	100	100	100	88	50
78	-	100	78	46	0	-
79	-	82	77	0	0	-
80	-	99	100	70	29	49
81	-	100	100	100	0	50
82	-	100	97	53	55	93
83	-	14	31	0	0	-
84	-	41	44	0	0	-
85	-	99	99	9	32	-
86	-	99	99	100	0	86
87	-	79	88	8	0	100
88	-	43	33	0	0	-
89	-	100	99	99	43	93
90	-	17	26	9	0	-
91	-	16	99	79	0	-
92	-	83	100	100	0	100
93	-	9	26	0	0	-
94	-	0	100	100	0	93
95	-	0	100	83	0	97
96	-	98	100	49	0	-

ES 2 427 153 T3

Comp. N°	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F
97	-	53	86	0	0	-
98	-	0	84	0	0	-
99	-	97	100	99	0	-
100	-	94	100	99	0	-
101	-	0	70	8	0	-
102	-	100	99	-	0	-
103	-	100	71	-	79	-
104	-	100	87	-	0	-
105	-	96	100	-	0	-
106	-	0	24	-	0	-
107	-	99	100	-	0	-
108	-	99	100	-	0	-
109	-	99	99	-	94	-
110	-	100	100	-	50	-
111	-	96	99	37	98	-
112	-	93	100	99	95	-
113	-	0	97	31	0	-
114	-	99	100	99	0	-
115	-	100	100	99	0	-
116	-	100	49	87	0	-
117	-	100	100	100	0	-
118	-	99	100	99	0	-
119	-	95	99	33	89	100
120	-	7	51	100	0	-
121	-	0	47	0	0	-
122	-	28	53	96	17	-
123	-	13	100	47	7	-
124	-	100	100	0	71	90
125	-	100	100	99	94	100
126	-	-	-	-	-	-
127	-	0	92	0	0	-
128	-	0	0	0	0	-
129	-	0	50	57	0	-
130	-	99	54	100	0	-
131	-	77	55	62	0	-
132	-	100	100	100	0	100
133	-	77	53	79	0	-
134	-	97	51	100	0	-
135	-	16	51	47	0	-
136	-	77	100	80	0	-
137	-	100	51	93	0	-
138	-	91	100	37	44	-
139	-	0	0	0	0	-
140	-	0	0	0	0	-
141	-	0	0	0	0	-
142	-	0	0	0	87	-
143	-	69	100	99	0	50
144	-	100	100	100	0	99
145	-	96	100	100	0	93
146	-	100	100	100	0	99

ES 2 427 153 T3

Comp. N°	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F
147	-	98	100	100	0	100
148	-	98	100	100	0	92
149	-	100	100	100	0	100
150	-	83	100	100	0	100
151*	-	99	100	99	0	-
152*	-	99	100	99	0	-
153*	-	99	100	98	0	-
154*	-	99	100	68	0	-
155	100	41	31	-	0	-
156	100	-	62	-	21	100
157	-	63	100	91	0	-
158	-	9	95	0	0	90
159	-	95	99	91	73	93
160	-	47	40	0	0	50
161	0	14	15	0	42	-
162	0	14	15	0	42	43
163	-	24	55	0	0	-
164	-	1	60	16	0	-
165	-	11	14	0	0	-
166	-	34	68	0	0	-
167	-	27	97	0	0	99
168	-	15	8	0	0	-
169	-	8	68	24	0	-
170	-	7	29	100	0	-
171	-	0	100	0	0	-
172	-	43	0	63	0	99
173	-	0	100	0	0	95
174	-	68	95	24	0	90
175	-	93	95	79	0	43
176	-	15	100	99	0	49
177	-	86	100	87	0	43
178	-	100	100	92	0	-
179**	-	96	100	98	0	-
180**	-	47	100	98	0	-
181**	-	73	100	16	0	-
182*	-	99	40	76	0	-
183**	-	0	99	98	0	-
184**	-	77	100	58	0	-
185**	-	99	97	99	0	-
186**	-	0	100	99	0	-
187	-	98	100	99	0	93
188**	-	99	100	99	84	99
189	-	93	100	99	0	-
190	-	8	100	99	0	93
191	-	79	100	99	0	-
192	-	97	100	74	0	-
193	-	100	98	88	0	-
194*	-	0	99	99	0	-
195	-	47	100		0	-
196*	-	97			0	-

ES 2 427 153 T3

Comp. N°	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F
197*	-	98	100	99	0	-
198*	-	99	100	99	0	-
199*	-	99	100	99	0	-
200*	-	39	98	98	0	-
201*	-	98	100	99	0	-
202	-	97	100	99	0	-
203	-	94	100	99	0	-
204	-	16	99	98	0	-
205	-	0	75	17	0	-
206*	-	99	100	99	0	-
207	-	36	99	99	0	-
208	-	100	100	99	0	-
209	-	98	100	99	0	-
210	-	100	100	99	0	-
211*	-	99	100	99	0	-
212*	-	97	100	99	0	-
213*	-	99	100	99	0	-
214	-	98	99	99	0	-
215	-	0	100	99	0	-
216	-	72	95	16	0	-
217	-	52	99	40	0	-
218*	-	91	100	99	0	-
219	-	69	99	99	0	-
220*	-	95	100	98	0	-
221**	-	77	99	98	0	-
222*	-	100	100	99	0	-
223*	-	99	100	99	0	-
224*	-	93	100	99	0	-
225	-	83	100	99	0	-
226*	-	100	100	99	0	-
227	-	44	63	0	0	-
228	-	88	100	99	0	-
229	-	97	100	90	0	-
230	-	87	100	94	0	-
231	-	100	100	99	0	-
232	-	100	100	99	0	-
233*	-	99	100	99	0	-
234*	-	100	100	99	0	-
235	-	94	100	99	0	-
236*	-	100	100	99	0	-
237	-	81	99	99	62	-
238**	-	100	100	99	0	-
239*	-	63	57	0	0	-
240**	-	99	100	99	0	-
241	-	17	99	68	47	-
242	-	16	100	73	0	-
243*	-	91	86	82	0	-
244	-	100	99	93	0	-
245	-	0	47	0	0	-
246	-	16	100	96	0	-

ES 2 427 153 T3

Comp. N°	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F
247	-	0	90	17	0	-
248	-	88	100	80	53	-
249*	-	100	100	99	0	-
250**	-	97	97	71	0	-
251**	-	100	100	97	0	-
252**	-	99	99	85	19	-
253*	-	96	90	67	0	-
254	-	95	99	99	0	-
255**	-	25	9	0	0	-
256*	-	99	100	86	-	-
257**	-	99	100	99	-	-
258**	-	100	100	99	-	-
259	-	-	-	-	-	-
260	-	14	0	-	0	-
261	93	0	31	-	21	-
262	94	6	52	-	0	-
263	92	0	15	-	0	0
264	96	20	0	-	68	93
265	0	34	0	-	47	-
266	100	6	57	-	42	86
267	95	6	21	-	0	-
268	0	6	36	-	0	-
269	0	40	0	-	0	-
270	0	0	0		0	-
271	-	7	67	0	0	-
272	-	14	50	0	0	-
273	-	44	0	0	0	-
274	-	29	37	0	0	-
275	-	30	9	0	0	0
276	-	30	17	0	0	-
277	-	15	9	0	0	-
278	-	0	33	0	0	93
279	-	0	0	0	0	0
280	-	0	24	0	0	-
281	-	15	0	0	0	-
282	55	8	0		0	39
283	-	48	84	0	0	99
284	-	10	21	0	0	-
285	-	10	25	0	0	-
286	-	39	23	0	52	-
287	-	0	50	0	0	-
288	-	73		76	0	95
289*	-	100	100	99	65	-
290	-	0	90	26	0	-
291	-	95	100	99	0	-
292	-	71	100	93	0	-
293	-	100	100	99	0	-
294	-	99	100	96	0	-
295	-	39	95	39	0	-
296	-	82	100	93	0	-

ES 2 427 153 T3

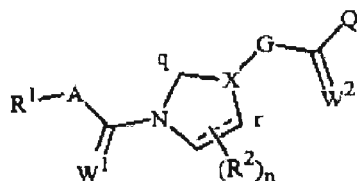
Comp. N°	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F
297	-	39	63	33	0	-
298**	-	57	80	0	0	-
299	-	83	99	96	0	-
300	-	62	97	58	0	-
301	-	99	99	80	-	-
302	-	86	95	26	-	-
303	-	45	95	26	-	-
304	-	72	57	26	-	-
305	-	100	100	99	-	-
306	-	96	100	83	-	-
307	-	79	100	26	0	-
308	-	98	100	93	0	-
309	-	96	100	83	0	-
310	-	47	73	9	0	-
311	-	31	83	0	28	-
312	-	91	100	80	0	-
313	-	98	99	92	0	-
314	-	98	100	99	0	-
315**	-	72	100	88	0	-
316	-	97	100	97	0	-

* indica los compuestos ensayados a 40 ppm

** indica los compuestos ensayados a 10 ppm.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto seleccionado de la Fórmula 1, un N- óxido o una sal apropiada para el uso agrícola del mismo,



1

en la que

5 la línea punteada indica que el enlace puede ser un enlace simple o un enlace doble;

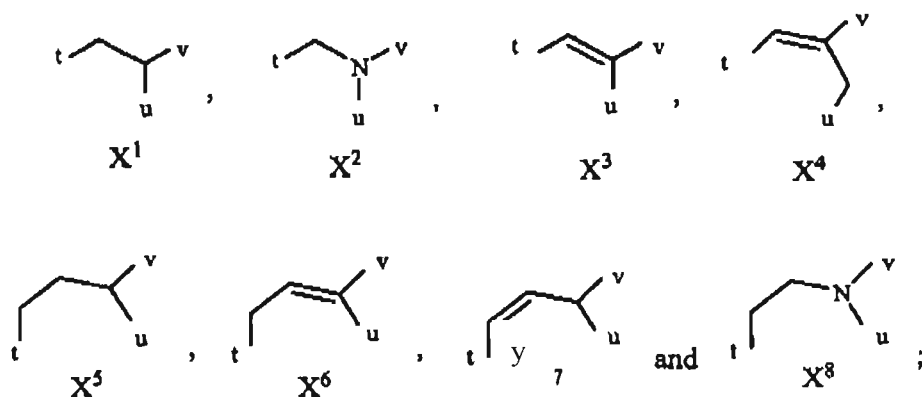
R¹ es un fenilo o anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, opcionalmente sustituido con 1 a 2 sustituyentes independientemente seleccionados de R⁴;

10 cada R⁴ es independientemente alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilalquilo C₅-C₁₀, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, hidroxilo, amino, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxilquilo C₂-C₄, hidroxialquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxycarbonilo C₂-C₆, alquilcarboniloxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₈ o trialquilsililo C₃-C₆;

15 A es CH₂ o NH;

W¹ es O o S;

X es un radical seleccionado de



20 en la que el enlace de X que está identificado con "t" está conectado al átomo de carbono identificado con "q" de Fórmula 1, el enlace que está identificado con "u" está conectado al átomo de carbono identificado con "r" de Fórmula 1, y el enlace que está identificado con "v" está conectado a G;

cada R² es independientemente alquilo C₁-C₄, alquenilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, halógeno, ciano o hidroxilo;

n es 0, 1 o 2; o

dos R² se toman juntos como alquilenilo C₁-C₃ o alquilenileno C₂-C₃ para formar un sistema anular bicíclico con puente; o

25 dos R² unidos a átomos de carbono anulares adyacentes unidos por un enlace doble se toman juntos como -CH=CH-CH=CH- opcionalmente sustituido con 1-3 sustituyentes seleccionados de alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄,

haloalcoxi C₁-C₄, halógeno, hidroxilo, amino, ciano y nitro;

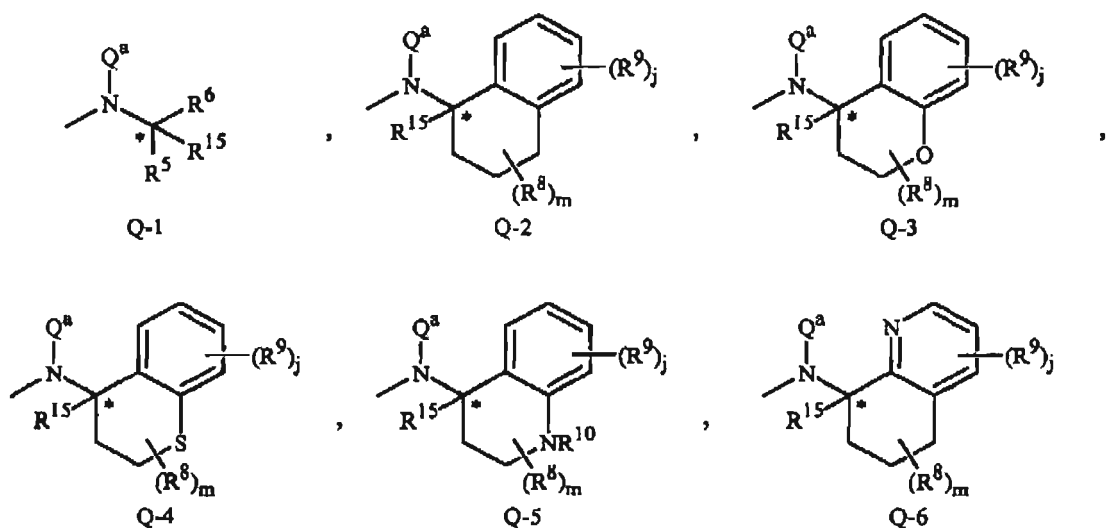
G es un anillo heteroaromático de 5 miembros o anillo heterocíclico saturado o parcialmente saturado de 5 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados de R³ en los miembros anulares de carbono y seleccionado de R¹¹ en los miembros anulares de nitrógeno;

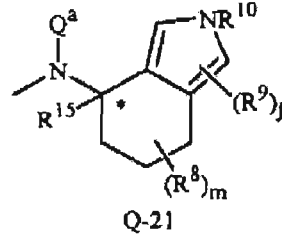
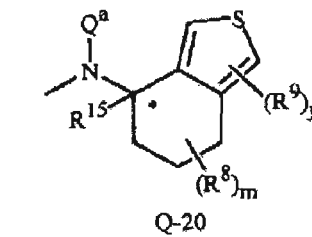
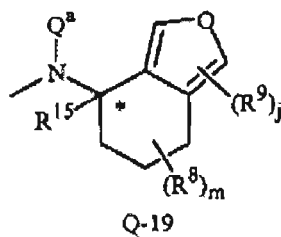
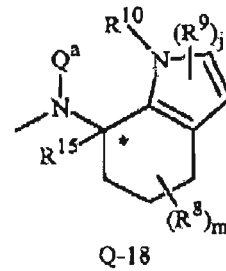
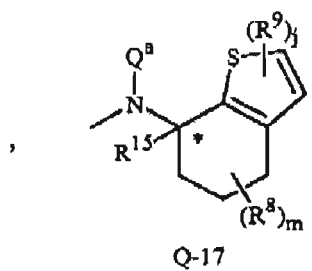
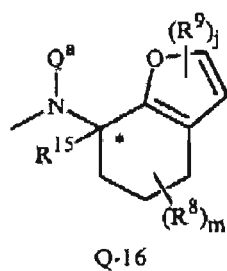
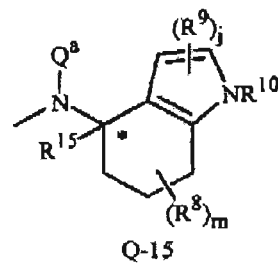
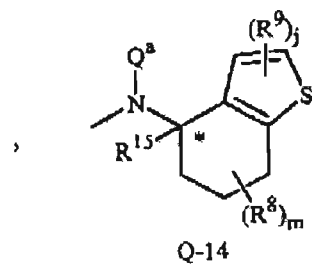
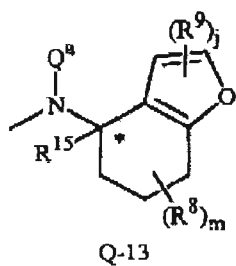
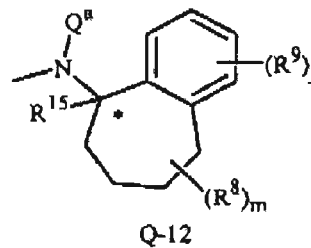
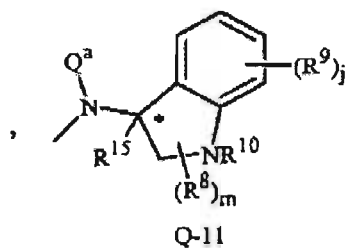
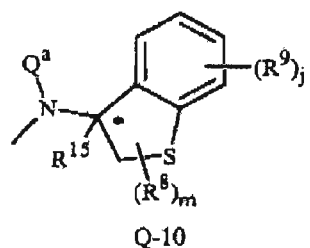
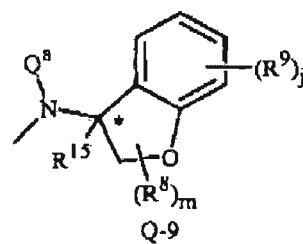
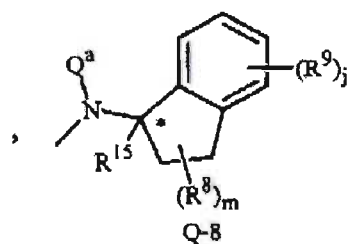
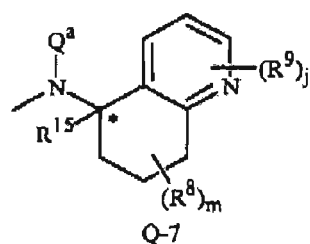
5 cada R³ es independientemente alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃ o halógeno;

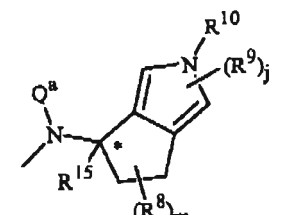
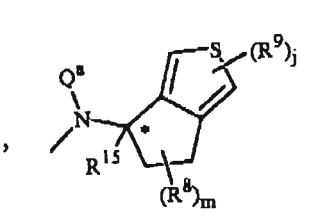
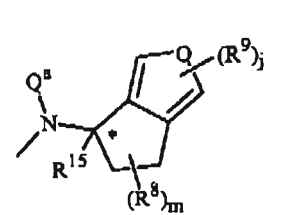
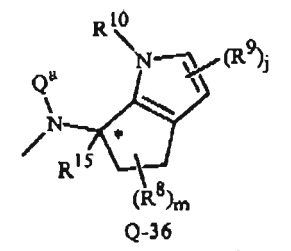
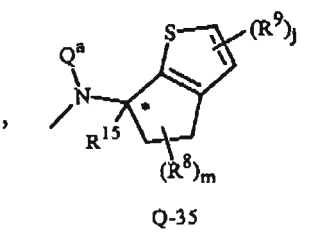
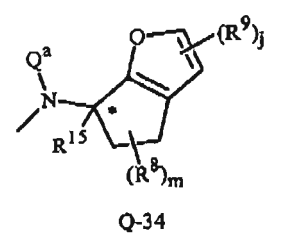
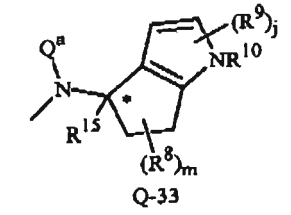
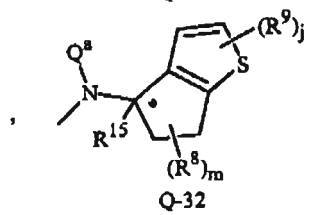
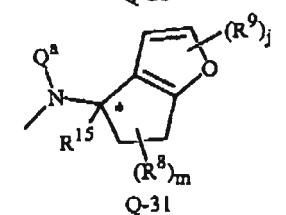
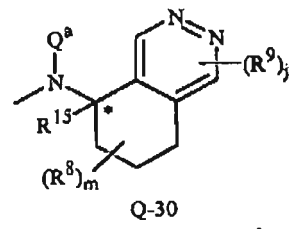
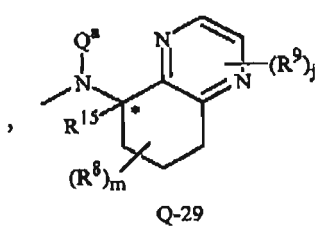
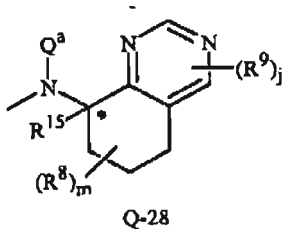
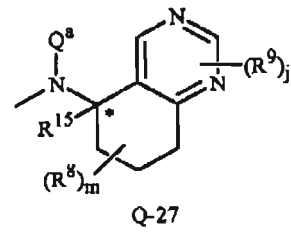
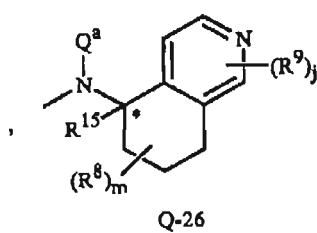
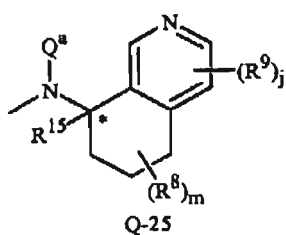
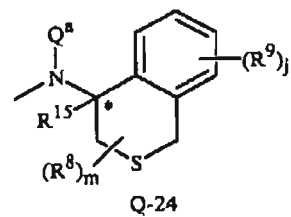
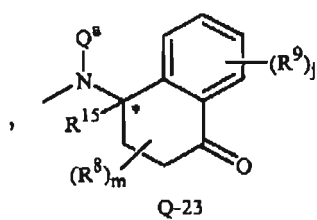
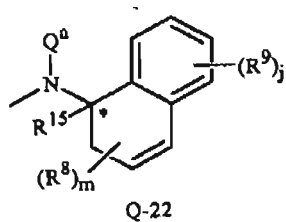
R¹¹ es alquilo C₁-C₃;

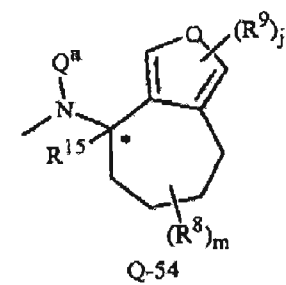
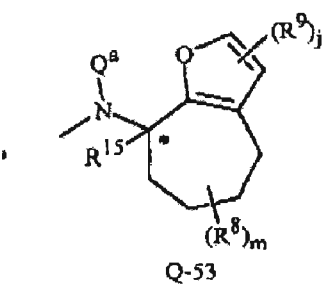
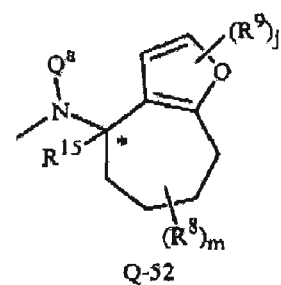
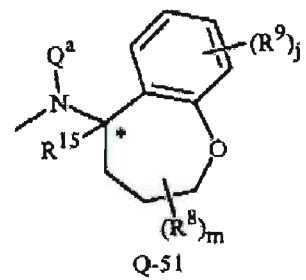
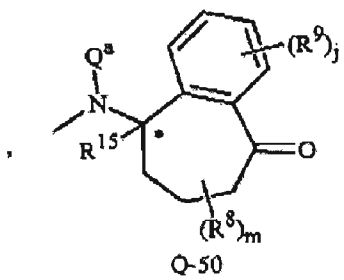
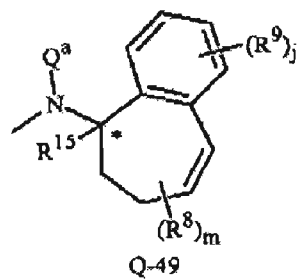
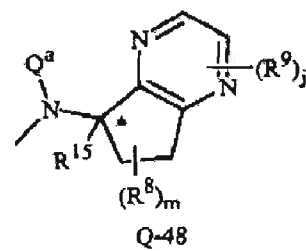
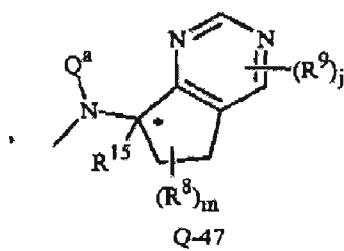
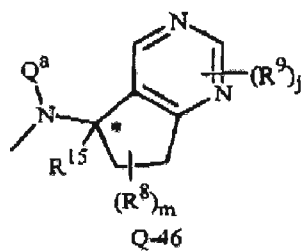
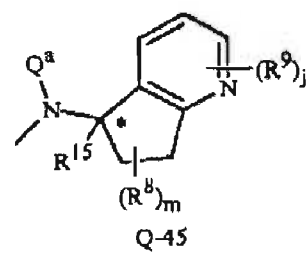
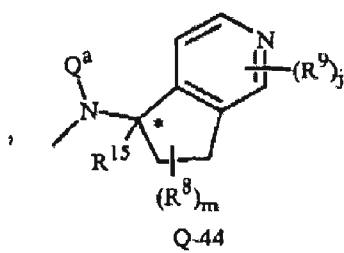
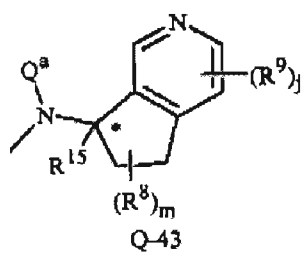
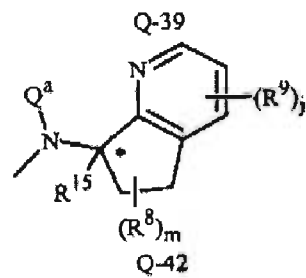
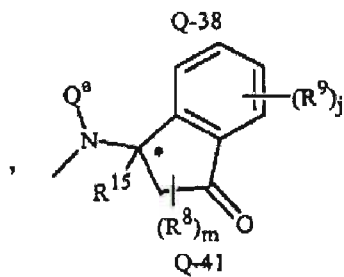
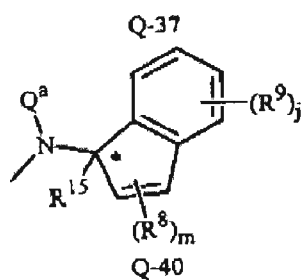
W² es O o S;

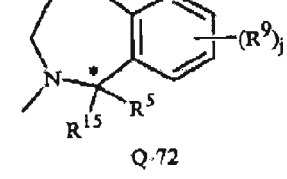
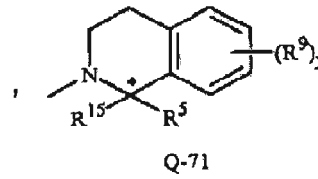
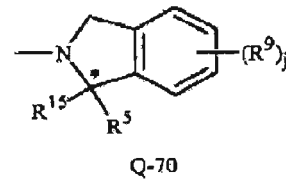
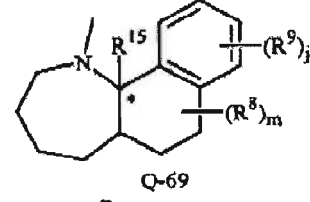
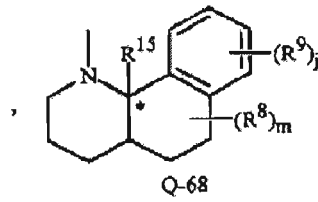
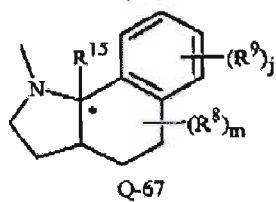
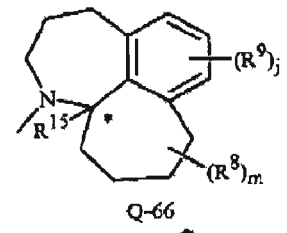
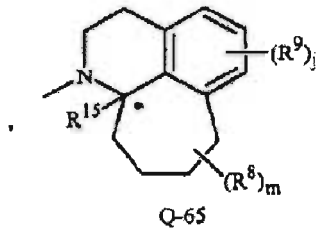
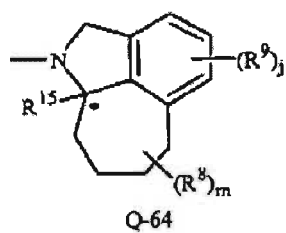
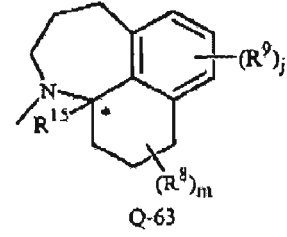
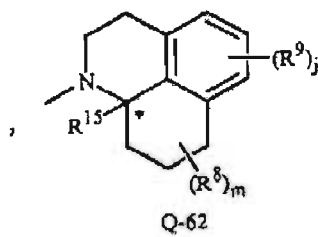
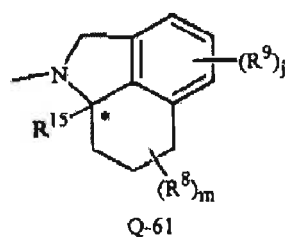
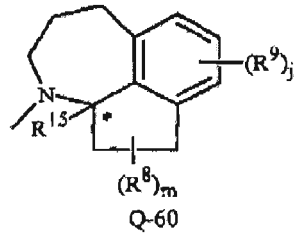
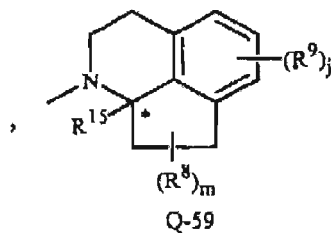
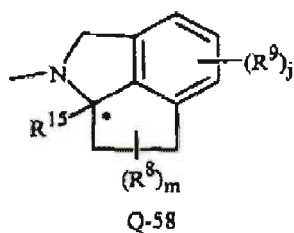
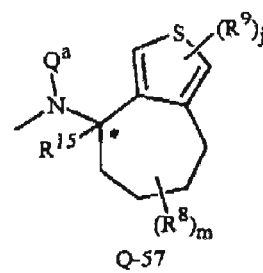
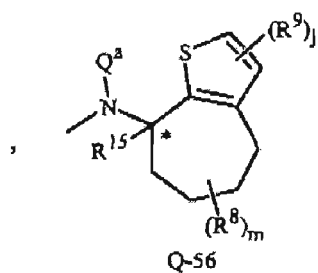
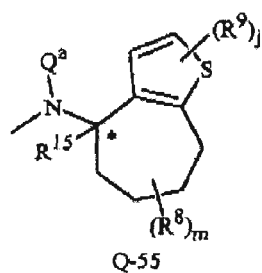
Q es un radical seleccionado de

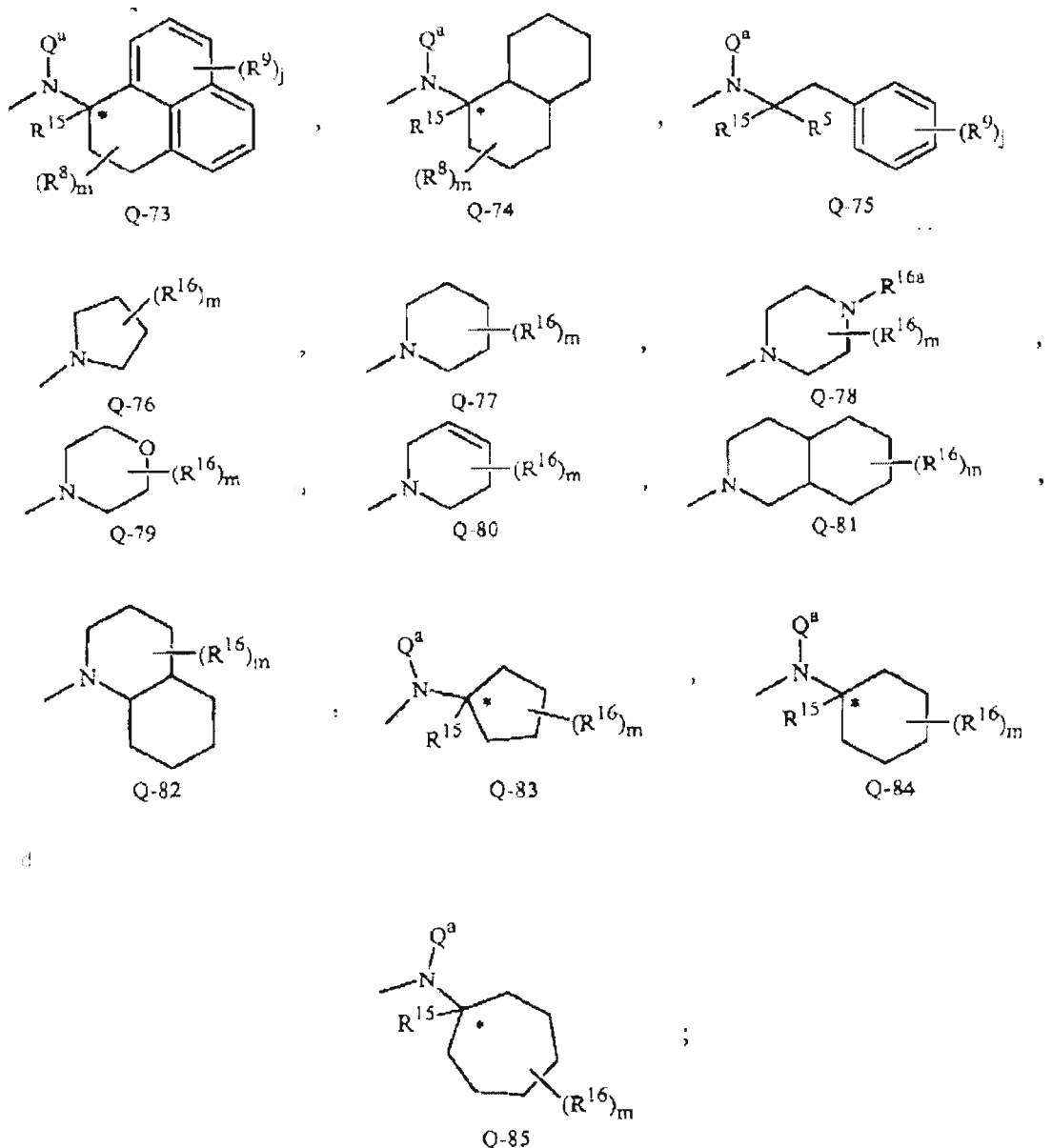












y d

en la que el átomo de carbono identificado con el asterisco (*) contiene un estereocentro; y para Q-2 a Q-76, cada R⁸ está independientemente unido a los átomos de carbono del anillo carbocíclico no aromático o anillo heterocíclico del grupo Q, y cada R⁹ está independientemente unido a los átomos de carbono del fenilo o anillo heteroaromático del grupo Q;

cada R⁸ es independientemente H, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₃-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, hidroxilo, amino, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfino C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfino C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₆, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquilo C₂-C₄, hidroxialquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxicarbonilo C₂-C₄, alcoxicarbonilo C₂-C₄, alquilcarboniltio C₂-C₄, alquilaminocarbonilo C₂-C₄, alquilaminocarbonilo C₂-C₄, dialquilaminocarbonilo C₃-C₆ o trialquilsilo C₃-C₆;

cada R⁹ es independientemente alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, hidroxilo, amino, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfino C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfino C₁-C₄,

haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquilo C₂-C₄, hidroxialquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxicarbonilo C₂-C₆, alquilcarboniloxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₈ o trialquilsililo C₃-C₆;

R¹⁰ es H o alquilo C₁-C₃;

5 m es 0, 1 o 2;

j es 0, 1 o 2;

10 cada R¹⁶ es independientemente alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilalquilo C₅-C₁₀, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, hidroxilo, amino, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquilo C₂-C₄, hidroxialquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxicarbonilo C₂-C₆, alquilcarboniloxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₈ o trialquilsililo C₃-C₆; o un anillo fenilo o bencilo, opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados de R¹³, o

15 dos R¹⁶ unidos a átomos de carbono anulares adyacentes se toman juntos como -(CH₂)₃- o -(CH₂)₄- opcionalmente sustituido con 1-3 sustituyentes seleccionados de alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, halógeno, hidroxilo, amino, ciano y nitro;

20 R^{16a} es H, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilalquilo C₅-C₁₀, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, amino, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquilo C₂-C₄, hidroxialquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxicarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₈; o un anillo fenilo o bencilo, opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados de R¹³;

25 cada R¹³ es independientemente alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilalquilo C₅-C₁₀, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, hidroxilo, amino, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquilo C₂-C₄, hidroxialquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxicarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₈ o trialquilsililo C₃-C₆;

30 R⁶ es un fenilo, bencilo, naftalenilo, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆ o anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada uno opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes seleccionados de R⁷ en los miembros anulares de carbono y R¹² en los miembros anulares de nitrógeno;

35 cada R⁷ es independientemente alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilalquilo C₅-C₁₀, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, hidroxilo, amino, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquilo C₂-C₄, hidroxialquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxicarbonilo C₂-C₆, alquilcarboniloxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₈ o trialquilsililo C₃-C₆;

R¹² es H o alquilo C₁-C₃;

45 Q^a es H, alquilo C₁-C₃, alquenilo C₂-C₃, alquinilo C₂-C₃, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilalquilo C₅-C₁₀, haloalquilo C₁-C₃, haloalquenilo C₂-C₃, ciano, hidroxilo, alcoxi C₁-C₃, alcoxialquilo C₂-C₃, hidroxialquilo C₁-C₃, alquilcarbonilo C₂-C₃, alcoxicarbonilo C₂-C₃, alquilaminocarbonilo C₂-C₃ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₅;

R⁵ es H, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilalquilo C₅-C₁₀, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, ciano, nitro, alcoxialquilo C₂-C₄, hidroxialquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxicarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₈ o trialquilsililo C₃-C₆; y

50 R¹⁵ es H, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilo

C₄-C₁₀, alquilocicloalquilalquilo C₅-C₁₀, haloalquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₄ o alcoxialquilo C₂-C₄;

siempre que:

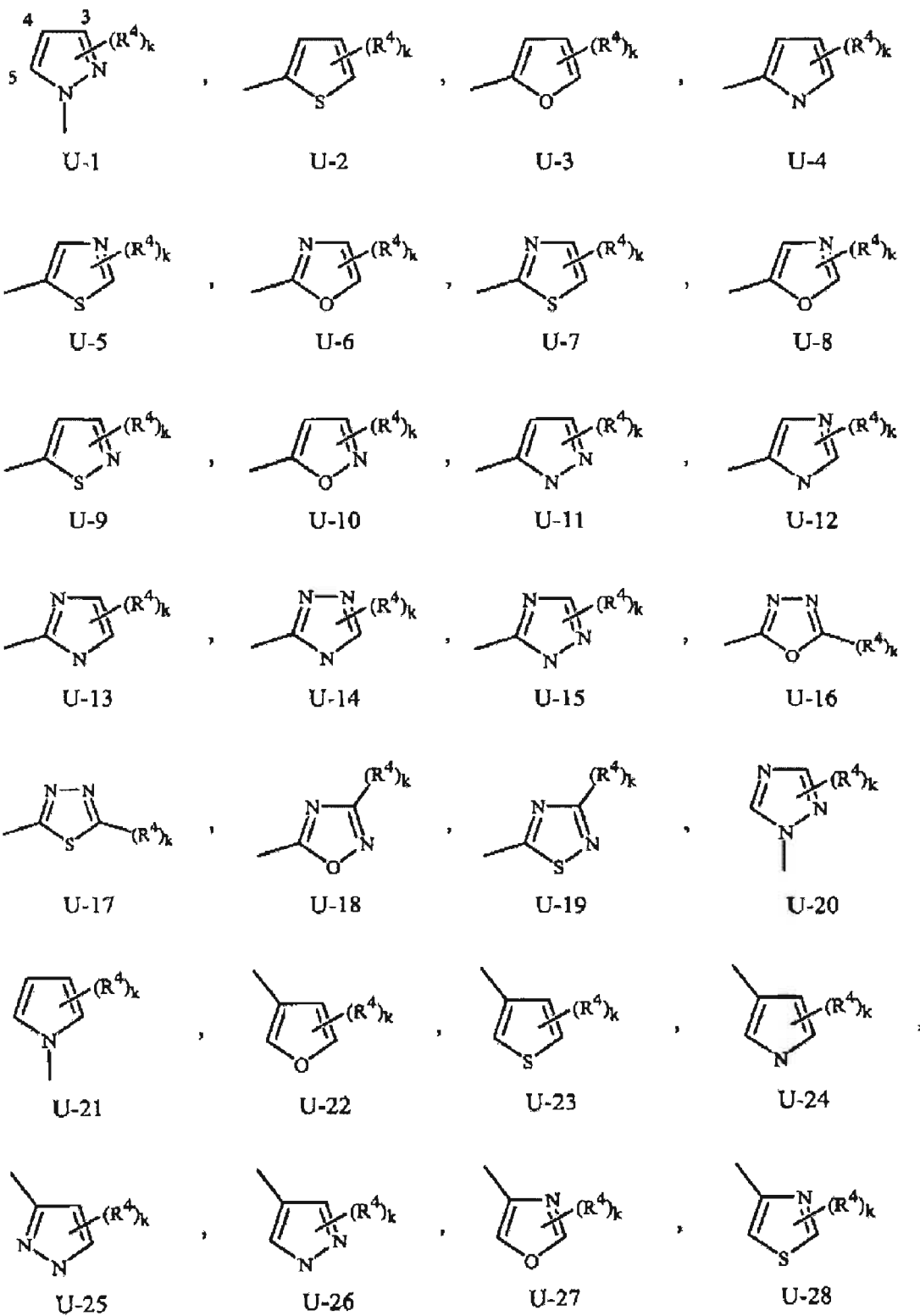
5 (a) el compuesto de Fórmula 1 es distinto que
2-[1([(clorofenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1-feniletil]-4-tiazolcarboxamida;

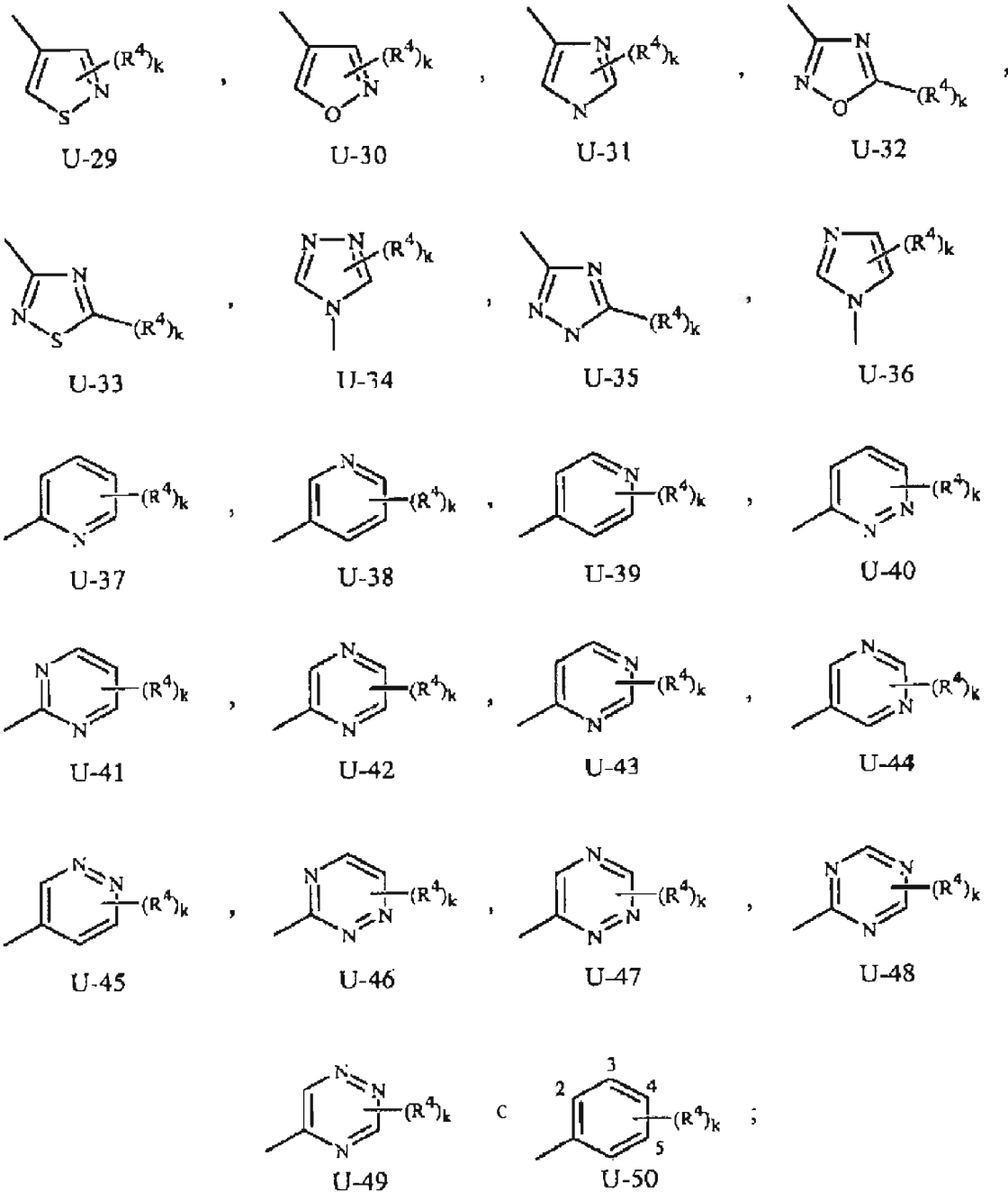
(b) cuando X es X², X³, X⁴, X⁶ o X⁸, después G no está unido a X a través de un heteroátomo del anillo G; y

(c) R¹ es distinto que 4-fluorofenilo.

2. Un compuesto de la reivindicación 1 en el que

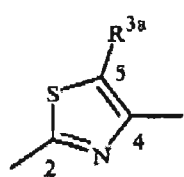
R1 es uno de U-1 a U-50





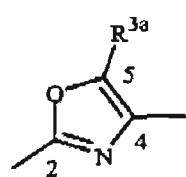
k es 0, 1 o 2;

G es uno de G-1 a G-55



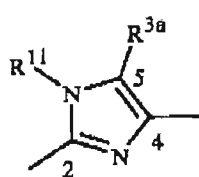
G-1

,



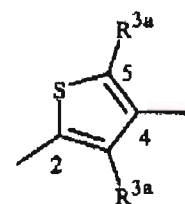
G-2

,



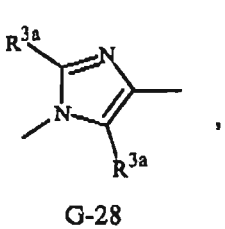
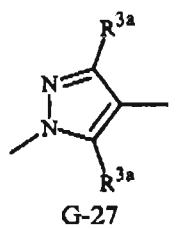
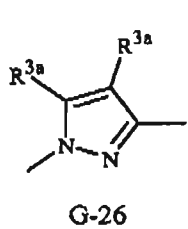
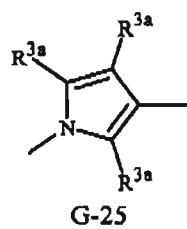
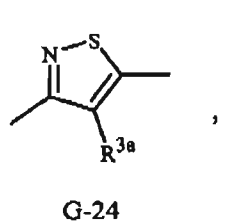
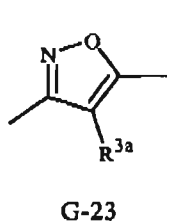
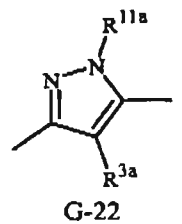
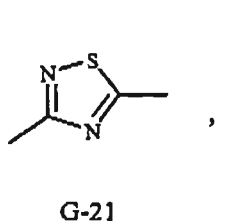
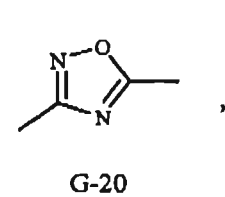
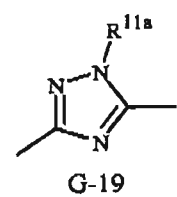
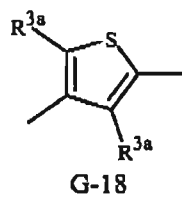
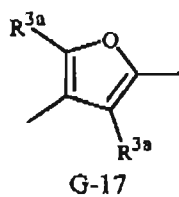
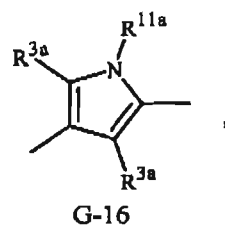
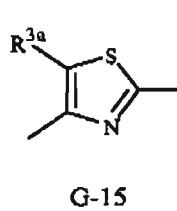
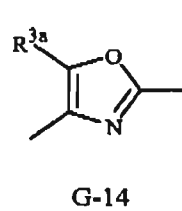
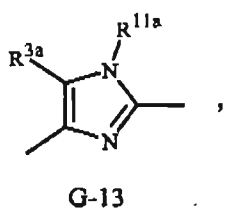
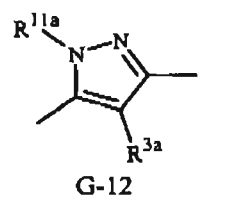
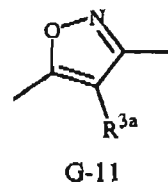
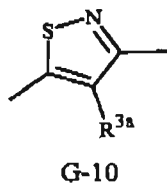
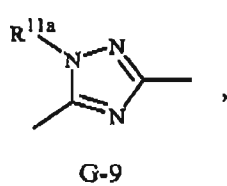
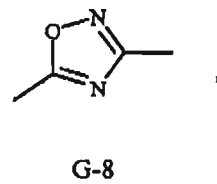
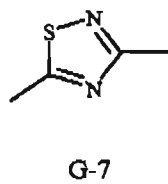
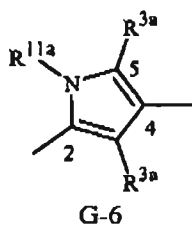
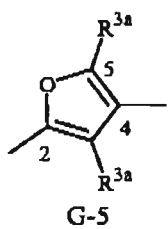
G-3

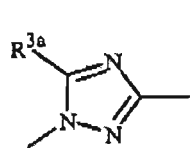
,



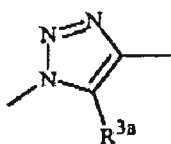
G-4

,

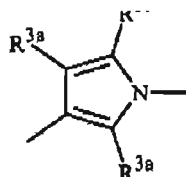




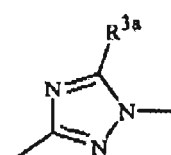
G-29



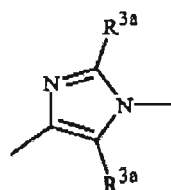
G-30



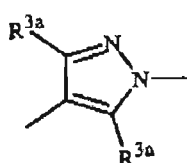
G-31



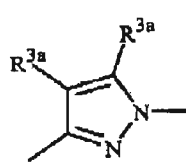
G-32



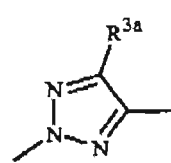
G-33



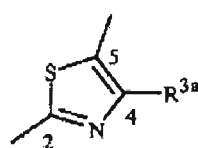
G-34



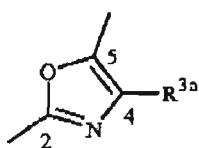
G-35



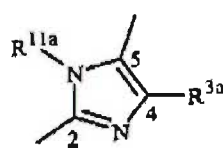
G-36



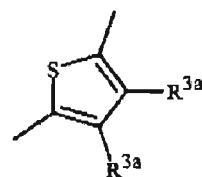
G-37



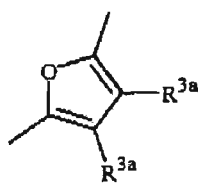
G-38



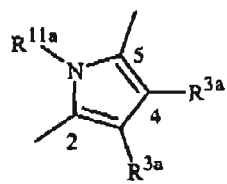
G-39



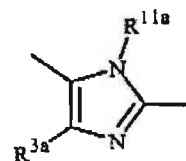
G-40



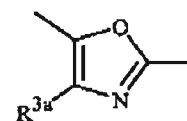
G-41



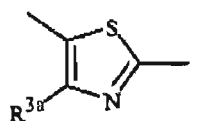
G-42



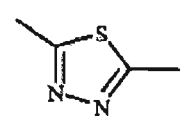
G-43



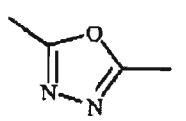
G-44



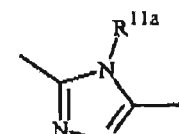
G-45



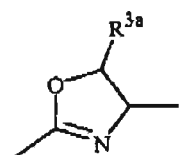
G-46



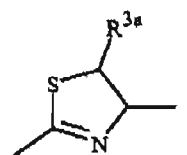
G-47



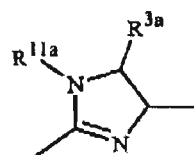
G-48



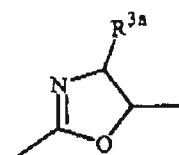
G-49



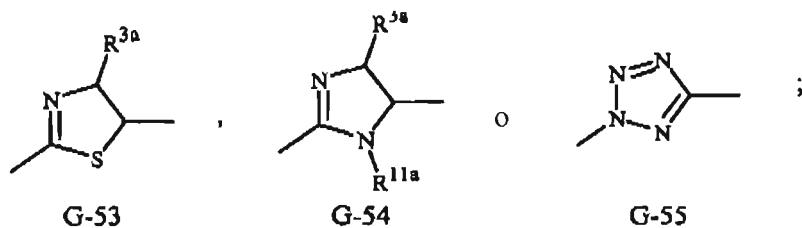
G-50



G-51



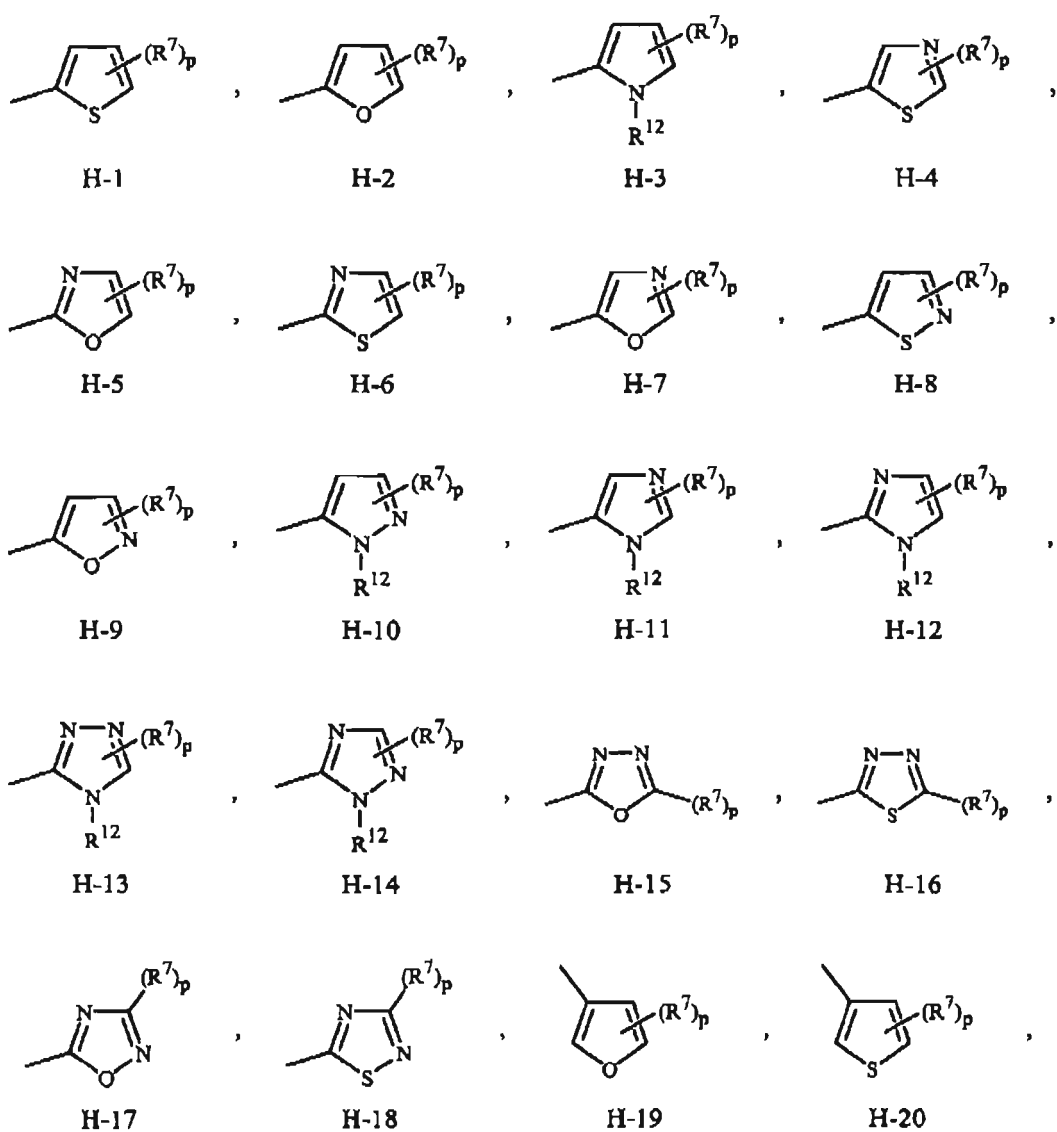
G-52

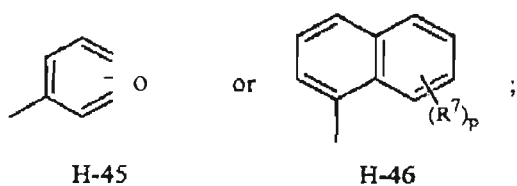
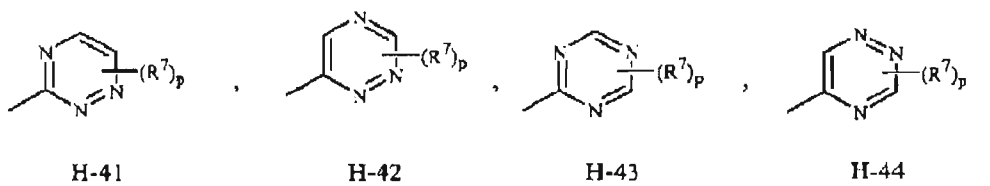
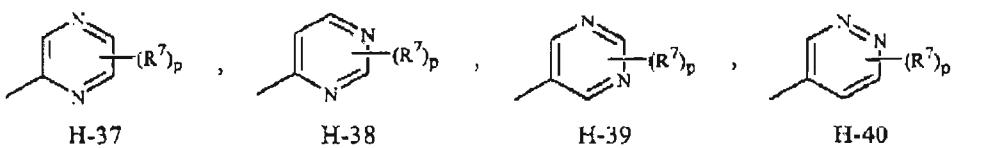
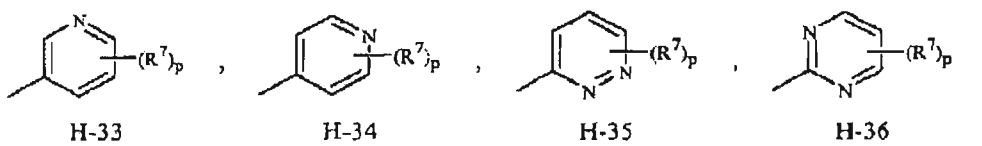
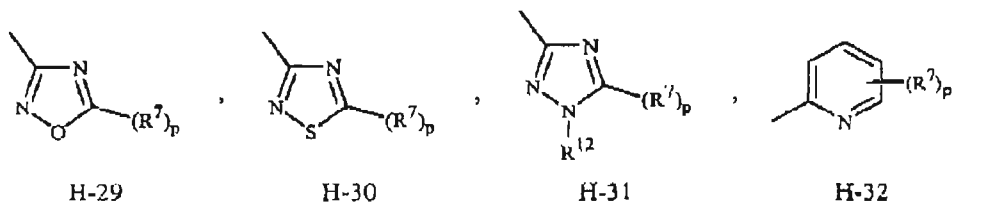
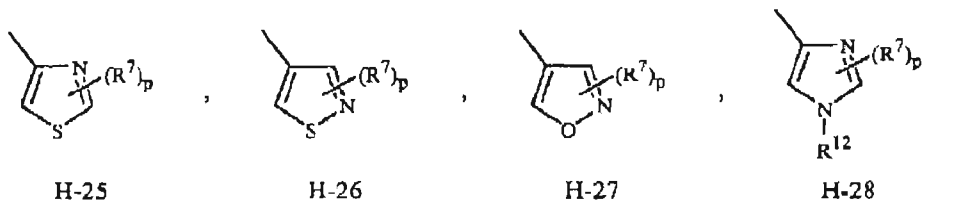
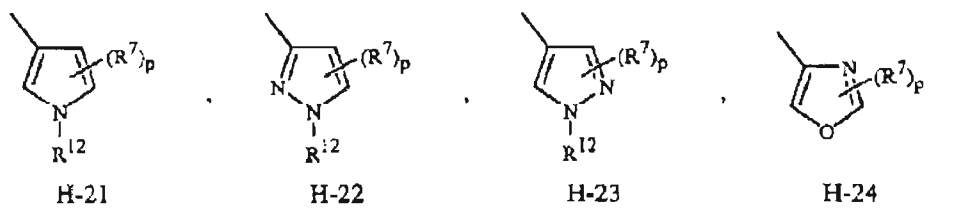


R^{3a} es H, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃ o halógeno;

R^{11a} es H o alquilo C₁-C₃;

R⁶ es uno de H-1 a H-46





y

p es 0, 1 o 2;

siempre que cuando U es U- 4, U-11 a U-15, U-24 a U-26, U-31 y U-35, y un radical R^4 está unido a un átomo de nitrógeno del anillo, dicho radical R^4 es alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 o alcóxialquilo C_2-C_4 .

3. Un compuesto de la reivindicación 2 en el que

cada R^2 es independientemente alquilo C_1-C_2 , haloalquilo C_1-C_2 , alcóxido C_1-C_2 , halógeno, ciano o hidróxido;

cada R^4 es independientemente alquilo C_1-C_3 , alqueno C_2-C_3 , alquino C_2-C_3 , ciclopropilo, haloalquilo C_1-C_3 , haloalqueno C_2-C_3 , haloalquino C_2-C_3 , halociclopropilo, halógeno, ciano, nitró, alcóxido C_1-C_2 o haloalcóxido C_1-C_2 ;

X es un radical seleccionado de X^1 , X^2 y X^3 ;

Q_a es H o CH_3 ;

R^5 es alquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , alquino C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , haloalqueno C_2-C_4 , haloalquino C_2-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , ciano o alcóxialquilo C_2-C_4 ;

cada R^7 es independientemente alquilo C_1-C_3 , alqueno C_2-C_3 , alquino C_2-C_3 , ciclopropilo, haloalquilo C_1-C_3 , haloalqueno C_2-C_3 , haloalquino C_2-C_3 , halociclopropilo, halógeno, ciano, nitró, alcóxido C_1-C_2 o haloalcóxido C_1-C_2 ;

cada R^8 es independientemente H, alquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , alquino C_3-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_4 , haloalqueno C_2-C_4 , haloalquino C_2-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_6 , halógeno, hidróxido, amino, ciano, nitró, alcóxido C_1-C_4 o alquilcarboniloxi C_2-C_4 ;

cada R^9 es independientemente alquilo C_1-C_3 , ciclopropilo, haloalquilo C_1-C_3 , halociclopropilo, halógeno, hidróxido, alquilcarboniloxi C_2-C_3 , alcóxido C_1-C_2 o haloalcóxido C_1-C_2 ;

R^{10} es H o metilo;

cada R^{16} es independientemente alquilo C_1-C_3 , alqueno C_2-C_3 , alquino C_2-C_3 , ciclopropilo, haloalquilo C_1-C_3 , haloalqueno C_2-C_3 , haloalquino C_2-C_3 , halociclopropilo, halógeno, ciano, nitró, alcóxido C_1-C_2 o haloalcóxido C_1-C_2 ; o un anillo fenilo o bencilo, opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados de R^{13} ;

R^{16a} es H, alquilo C_1-C_3 , alilo, propargilo, ciclopropilo o haloalquilo C_1-C_3 ; o un anillo fenilo o bencilo, opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados de R^{13} ;

cada R^{13} es independientemente alquilo C_1-C_3 , alqueno C_2-C_3 , alquino C_2-C_3 , ciclopropilo, haloalquilo C_1-C_3 , haloalqueno C_2-C_3 , haloalquino C_2-C_3 , halociclopropilo, halógeno, ciano, nitró, alcóxido C_1-C_2 o haloalcóxido C_1-C_2 ; y R^{15} es H o CH_3 .

4. Un compuesto de la reivindicación 3 en el que

R^1 es uno de U-1 a U-3, U-13, U-20, U-22, U-23, U-37 a U-39 y U-50; y

cada R^4 es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alcóxido C_1-C_2 o haloalcóxido C_1-C_2 .

5. Un compuesto de la reivindicación 3 en el que

G es G-1, G-2, G-7, G-8, G-14, G-15, G-23, G-24, G-26, G-27, G-36, G-37, G-38, G-49 o G-50;

R^{3a} es H, CH_3 , Cl o Br; y

R^{11} es H o CH_3 .

6. Un compuesto de la reivindicación 5 en el que G no está sustituido.

7. Un compuesto de la reivindicación 3 en el que

Q es Q-1, Q-2, Q-3, Q-4, Q-8, Q-9, Q-10, Q-12, Q-14, Q-22, Q-23, Q-24, Q-40, Q-41, Q-59, Q-62, Q-74 o Q-84;

R^5 es alquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , alquino C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , haloalqueno C_2-C_4 ,

- haloalquínilo C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₄, ciano o alcoxialquilo C₂-C₄;
- R⁶ es H-1, H-20, H-32, H-45 o H-46;
- cada R⁷ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₂ o haloalcoxi C₁-C₂;
- 5 cada R⁸ es independientemente alquilo C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, haloalcoxi C₁-C₂, alcoxycarbonilo C₂-C₄ o hidroxí; y
- cada R⁹ es independientemente halógeno, hidroxí, OCH₃ o CH₃.
8. Un compuesto de la reivindicación 7 en el que
- Q es Q-1, Q-2, Q-8, Q-14, Q-23, Q-41, Q-59 o Q-62;
- Q^a es CH₃;
- 10 R⁵ es alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquénilo C₂-C₄, haloalquénilo C₂-C₄ o ciano;
- R⁶ es H-1 o H-45;
- R¹² es H o CH₃;
- cada R⁷ es independientemente F, Cl, Br, OCH₃ o metilo;
- R⁸ es CH₃, OCH₃ o hidroxí;
- 15 R¹⁰ es H o CH₃; y
- R¹⁵ es H.
9. Un compuesto de la reivindicación 3 en el que
- W¹ y W² son independientemente O;
- Q^a es CH₃;
- 20 R^{3a} es H;
- m, j, n y p son todos independientemente 0 o 1;
- cada R⁷ es independientemente F, Cl, Br, OCH₃ o metilo;
- cada R⁸ es independientemente alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂ o hidroxí; y cada R⁹ es independientemente F, Cl, Br, hidroxí, OCH₃ o CH₃.
- 25 10. Un compuesto de la reivindicación 9 en el que
- R¹ es U-1 o U-50;
- cada R⁴ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃ o alcoxi C₁-C₂;
- k es 1 o 2;
- G es G-1, G-2, G-15, G-26, G-27, G-36, G-37 o G-38;
- 30 Q es Q-1, Q-2, Q-8, Q-23 o Q-41;
- R⁵ es alquilo C₁-C₄, alquénilo C₂-C₄ o ciano; y
- R⁶ es H-45;
- siempre que cuando k es 1, R⁴ está conectado a la posición 3 o 5 de U-1 y a la posición 2 o 3 de U-50; y cuando k es 2, un R⁴ independientemente seleccionado está conectado a cada una de las posiciones 3 y 5 de U-1 y a cada una de las
- 35 posiciones 2 y 5 de U-50.
11. Un compuesto de la reivindicación 10 en el que

- X es X¹; y
G es G-1.
12. Un compuesto de la reivindicación 10 en el que
X es X¹; y
- 5 G es G-2.
13. Un compuesto de la reivindicación 10 en el que
X es X¹; y
G es G-15.
14. Un compuesto de la reivindicación 10 en el que
- 10 X es X¹; y
G es G-26.
15. Un compuesto de la reivindicación 10 en el que
X es X¹; y
G es G-36.
- 15 16. Un compuesto de la reivindicación 10 en el que
X es X²; y
G es G-1.
17. Un compuesto de la reivindicación 10 en el que
X es X²; y
- 20 G es G-2.
18. El compuesto de la reivindicación 1 seleccionado del grupo que consiste en:
2-[1-[(2,5-dimetilfenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida,
2-[1-[(2,5-diclorofenil)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida,
N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-
25 4-tiazolcarboxamida,
N-[(1R)-2,3-dihidro-1H-inden-1-il]-N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-
4-tiazolcarboxamida,
N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-
4-tiazolcarboxamida,
- 30 N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R,4S)-1,2,3,4-tetrahidro-
4-hidroxi-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida y su enantiómero,
N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1,2,3,4-tetrahidro-2-metil-1-naftalenil)-4-tiazol
carboxamida,
- 35 N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R,4R)-1,2,3,4-tetrahidro-4-hidroxi-1-
naftalenil]-4-tiazolcarboxamida y su enantiómero,
2-[1-[[5-etil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarb
oxamida,

- 2-[1-[[3,5-bis(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida,
- N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-(1,2,3,4-tetrahidro-4-oxo-1-naftalenil)-4-tiazolcarboxamida,
- 5 N-metil-2-[4-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-1-piperazinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida,
- N-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarboxamida,
- 10 N-(2,3-dihidro-2-metil-1H-inden-1-il)-N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarboxamida,
- N-metil-1-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-1H-pirazol-3-carboxamida,
- N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-2H-1,2,3-triazol-4-carboxamida,
- 15 N-metil-1-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-1H-pirazol-4-carboxamida,
- N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R,2S)-1,2,3,4-tetrahidro-2-metil-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida,
- 20 N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-4-tiazolcarboxamida y su enantiómero,
- 2-[1-[(3,5-dicloro-1H-pirazol-1-il)acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida,
- 2-[1-[[5-cloro-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-metil-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-tiazolcarboxamida,
- 25 N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]-4-oxazolcarboxamida, y
- N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil)-4-tiazolcarboxamida.
- 30 19. Un procedimiento para controlar enfermedades vegetales provocadas por patógenos vegetales micóticos Oomycete que comprende aplicar a la planta o porción de la misma, o a la semilla de la planta o plántula, una cantidad funguicidamente efectiva de un compuesto que tiene una fórmula correspondiente a la Fórmula 1 de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18 donde la condición (a) y condición (c) ambas sean omitidas.
20. Una composición funguicida que comprende (1) un compuesto que tiene una fórmula correspondiente a la Fórmula 1 de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18 donde la condición (a) y la condición (c) ambas sean omitidas; y (2) al menos otro funguicida.
- 35 21. Una composición funguicida que comprende (1) una cantidad funguicidamente efectiva de un compuesto que tiene una fórmula correspondiente a la Fórmula 1 de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18 donde la condición (a) y la condición (c) ambas sean omitidas; y (2) al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos.