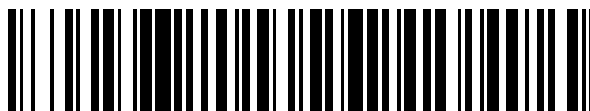


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 555 163**

51 Int. Cl.:

C07D 451/06 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

A01P 7/02 (2006.01)

A61P 33/10 (2006.01)

C07D 491/052 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **24.02.2011 E 11747466 (8)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **07.10.2015 EP 2540719**

54 Título: **Compuesto de amina cíclico y acaricida**

30 Prioridad:

04.10.2010 JP 2010224844

21.05.2010 JP 2010117392

25.02.2010 JP 2010039839

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

29.12.2015

73 Titular/es:

**NIPPON SODA CO., LTD. (100.0%)
2-1, Ohtemachi 2-chome Chiyoda-ku
Tokyo 100-8165, JP**

72 Inventor/es:

**HAMAMOTO, ISAMI;
KOIZUMI, KEIJI;
KAWAGUCHI, MASAHIRO;
TANIGAWA, HISASHI;
NAKAMURA, TAKEHIKO y
KOBAYASHI, TOMOMI**

74 Agente/Representante:

CURELL AGUILÁ, Mireia

ES 2 555 163 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

Compuesto de amina cíclico y acaricida.

5 **Campo técnico**

La presente invención se refiere a un compuesto de amina cíclico y a un acaricida. Más específicamente, la presente invención se refiere a un compuesto de amina cíclico y a un acaricida que presenta una actividad acaricida superior, tiene una propiedad y seguridad superiores, y se puede sintetizar ventajosamente y de forma industrial.

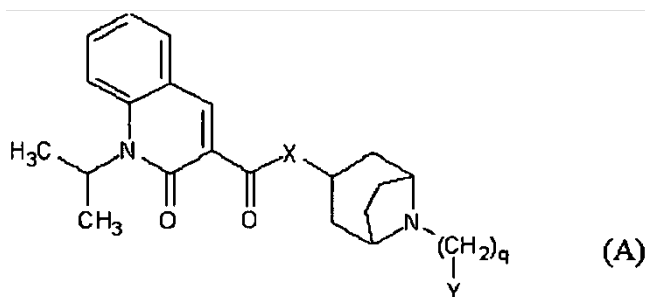
10 Se reivindica la prioridad en la solicitud de patente japonesa nº 2010-039839, presentada el 25 de febrero de 2010, la solicitud de patente japonesa nº 2010-117392, presentada el 21 de mayo de 2010, la solicitud de patente japonesa nº 2010-224844, presentada el 4 de octubre de 2010, cuyo contenido se incorpora en la presente memoria como referencia.

15 **Técnica anterior**

En el documento 1 de patente se describe un compuesto representado por la fórmula (A), que es estructuralmente relevante para el compuesto de la presente invención. Se describe que este compuesto es eficaz como un estimulante del receptor de serotonina 4. Sin embargo, no se describe un procedimiento sintético específico ni el efecto del compuesto representado por la fórmula (A), en la que X representa un átomo de oxígeno, Y representa un grupo alcoxi y q representa 0.

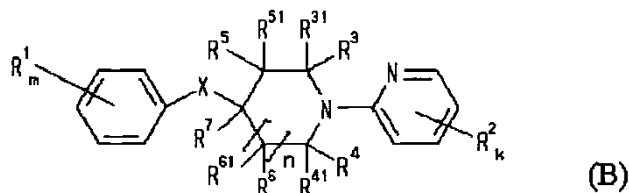
[Fórmula química 1]

25



Además, en el documento 2 de patente se describe un compuesto representado por la fórmula (B), una sal y un N-óxido del compuesto representado por la fórmula (B), y un agente de control de plagas que incluye el compuesto representado por la fórmula (B) como ingrediente activo (en la fórmula (B), R¹ representa un grupo hidroxilo o similar, m representa 0 o un número entero de 1 a 5, R² representa un átomo de halógeno o similar, k representa 0 o un número entero de 1 a 4, R³, R³¹, R⁴, R⁴¹, R⁵, R⁵¹, R⁶, R⁶¹ y R⁷ representan independientemente un átomo de hidrógeno o similar, X representa un átomo de oxígeno o similar, n representa 0 o 1).

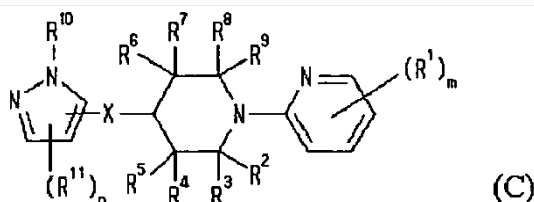
35 [Fórmula química 2]



Además, en el documento 3 de patente se describe un compuesto de N-piridil-piperidina representado por la fórmula (C). Se describe que el compuesto representado por la fórmula (C) tiene una actividad acaricida frente a arañas y ácaros de la roya (en la fórmula (C), R¹ representa un átomo de halógeno, un grupo haloalquilo de C1-4, un grupo ciano, un grupo nitro o un grupo alcoxi de C1-4-carbonilo. R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ representan independientemente un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C1-4. R¹⁰ representa un átomo de hidrógeno o similar. R¹¹ representa un átomo de halógeno o similar. X representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre. m representa un número entero de 1 to 4. n representa 1 o 2).

45

[Fórmula química 3]



5 **Bibliografía de la técnica anterior**

Documentos de patente

- 10 Documento 1 de patente: Publicación de solicitud de patente japonesa sin examinar nº Hei 8-34784
 Documento 2 de patente: WO 2005/095380
 Documento 3 de patente: WO 2008/026658

Descripción de la invención

15 Problemas que debe resolver la invención

Los acaricidas tradicionales, aunque se han sintetizado industrial y ventajosamente, y se han usado de forma segura, muchos de ellos carecen de otras propiedades tales como eficacia residual. Además, los requisitos de la seguridad, tales como la reducción del efecto dañino de las sustancias químicas para las plantas, la reducción o neutralización de la toxicidad para seres humanos, ganado o vida marina, han estado creciendo cada año.

Por lo tanto, el objetivo de la presente invención es proporcionar un nuevo compuesto de amina cíclico y un acaricida, que tiene una actividad acaricida superior, tiene una propiedad y seguridad superiores, y se puede sintetizar ventajosa e industrialmente.

Además, el objetivo de la presente invención es proporcionar un compuesto de hidroxilamina que es adecuado para sintetizar el compuesto de amina cíclico usado como ingrediente activo del acaricida.

Medios para resolver los problemas

30 A fin de lograr los objetivos anteriores, se realizaron estudios exhaustivos. Como resultado, se descubrió que un compuesto de amina cíclico que tiene una estructura específica, o sal del mismo, se puede usar como un acaricida que tiene una propiedad acaricida superior, propiedades excelentes y una seguridad elevada. Además, se descubrió que un compuesto de hidroxilamina que tiene una estructura específica, o una sal del mismo, es adecuado para un producto intermedio para sintetizar el compuesto de amina cíclico que tiene una estructura específica, o sal del mismo.

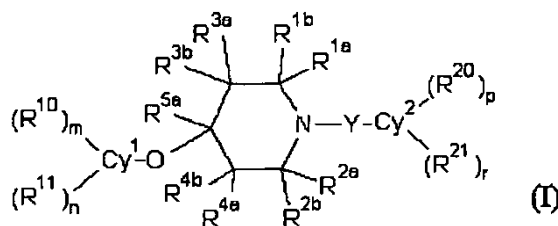
La presente invención se logró sobre la base a esta percepción.

40 A saber, la presente invención es como se expone a continuación:

[1] Un compuesto de amina cíclico representado por la fórmula (I) o sal del mismo:

[Fórmula química 4]

45



en la fórmula (I),

50 Cy¹ y Cy² representan independientemente un grupo arilo de C6-C10 o un grupo heterocíclico;

en la fórmula (I), R^{1a}, R^{1b}, R^{2a}, R^{2b}, R^{3a}, R^{3b}, R^{4a}, R^{4b} y R^{5a} representan independientemente un átomo de

hidrógeno o un grupo alquilo de C1-6 no sustituido o sustituido;

R^{1a} y R^{2a} , o R^{3a} y R^{4a} se enlazan juntos para formar un grupo alquileo de C3-6 no sustituido o sustituido, un grupo alqueniilo de C3-6 no sustituido o sustituido, un grupo representado por la fórmula: $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$, un grupo representado por la fórmula: $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$, un grupo representado por la fórmula: $-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$, o un grupo representado por la fórmula: $-\text{CH}_2\text{NR}^6\text{CH}_2-$, (con la condición de que R^6 represente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1-6 no sustituido o sustituido, un grupo acilo de C1-7 no sustituido o sustituido o un grupo alcoxi de C1-6-carbonilo no sustituido o sustituido);

en la fórmula (I), R^{10} , R^{11} , R^{20} y R^{21} representan independientemente un grupo alquilo de C1-6 no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquilo de C3-8 no sustituido o sustituido, un grupo alqueniilo de C2-6 no sustituido o sustituido, un grupo alquinilo de C2-6 no sustituido o sustituido, un grupo hidroxilo, un grupo oxo, un grupo alcoxi de C1-6 no sustituido o sustituido, un grupo cicloalcoxi de C3-8 no sustituido o sustituido, un grupo alqueniil C2-6-oxi no sustituido o sustituido, un grupo alquinil C2-6-oxi no sustituido o sustituido, un grupo carboxilo, un grupo acilo de C1-7 no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi C1-6-carbonilo no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquil C3-8-oxicarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo alqueniil C2-6-oxicarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo alquinil C2-6-oxicarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo aril C6-10-oxicarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo heterocicliloxicarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo acil C1-7-oxi no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi C1-6-oxicarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquil C3-8-oxicarboniloxi no sustituido o sustituido, un grupo alqueniil C2-6-oxicarboniloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquil C1-6-aminocarboniloxi no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquil C3-8-aminocarboniloxi no sustituido o sustituido, un grupo alqueniil C2-6-aminocarboniloxi no sustituido o sustituido, un grupo aril C6-10-aminocarboniloxi no sustituido o sustituido, un grupo heterocicliaminocarboniloxi no sustituido o sustituido, un grupo aminooxi no sustituido o sustituido, un grupo alquiliden C1-6-aminooxi no sustituido o sustituido, un grupo arilo de C6-10 no sustituido o sustituido, un grupo heterocicliilo sustituido o sustituido, un grupo aril C6-10-oxi sustituido o sustituido, un grupo heterociclioxi sustituido o sustituido, un grupo sulfoniloxi sustituido, un grupo amino, un grupo alquil C1-6-amino no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquil C3-8-amino no sustituido o sustituido, un grupo alqueniil C2-6-amino no sustituido o sustituido, un grupo alquinil C2-6-amino no sustituido o sustituido, un grupo aril C6-10-amino no sustituido o sustituido, un grupo heterocicliamino no sustituido o sustituido, un grupo hidroxiamino no sustituido o sustituido, un grupo acil C1-7-amino no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi C1-6-carbonilamino no sustituido o sustituido, un grupo alqueniil C2-6-oxicarbonilamino no sustituido o sustituido, un grupo alquinil C2-6-oxicarbonilamino no sustituido o sustituido, un grupo aril C6-10-oxicarbonilamino no sustituido o sustituido, un grupo heterocicliloxicarbonilamino no sustituido o sustituido, un grupo sulfonilamino sustituido, un grupo aminocarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo mercapto, un grupo alquil C1-6-tio no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquil C3-8-tio no sustituido o sustituido, un grupo alqueniil C2-6-tio no sustituido o sustituido, un grupo alquinil C2-6-tio no sustituido o sustituido, un grupo aril C6-10-tio no sustituido o sustituido, un grupo heterocicliitio no sustituido o sustituido, un grupo (alquilo de C1-6 no sustituido o sustituido)-tiocarbonilo, un grupo (alcoxi de C1-6 no sustituido o sustituido)-tiocarbonilo, un grupo (alquil C1-6-tio no sustituido o sustituido)-carbonilo, un grupo (alquil C1-6-tio no sustituido o sustituido)-tiocarbonilo, un grupo sulfiniilo sustituido, un grupo sulfoniilo sustituido, un grupo pentafluorosulfanilo, un grupo sililo trisustituido con alquilo de C1-6, un grupo sililo trisustituido con arilo de C6-10, un grupo ciano, un grupo nitro o un átomo de halógeno;

R^{10} y R^{11} de Cy^1 pueden formar independientemente un anillo, o se pueden unir juntos para formar un anillo, o se pueden unir con los átomos que constituyen Cy^1 para formar un anillo; R^{20} y R^{21} de Cy^2 puede formar independientemente un anillo, o se pueden unir juntos para formar un anillo, o se pueden unir con los átomos que constituyen Cy^2 para formar un anillo;

en la fórmula (I), m representa el número de R^{10} y representa un número entero de 0 a 5, cuando m es 2 o más, los R^{10} pueden ser iguales o diferentes;

en la fórmula (I), n representa el número de R^{11} y representa un número entero de 0 a 5, cuando n es 2 o más, los R^{11} pueden ser iguales o diferentes;

en la fórmula (I), p representa el número de R^{20} y representa un número entero de 0 a 5, cuando p es 2 o más, los R^{20} pueden ser iguales o diferentes;

en la fórmula (I), r representa el número de R^{21} y representa un número entero de 0 a 5, cuando r es 2 o más, los R^{21} pueden ser iguales o diferentes;

en la fórmula (I), Y representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre.

[2] El compuesto de amina cíclico o sal del mismo según [1], en el que

en la fórmula (I), Cy^1 representa un grupo fenilo, un grupo pirazolilo, un grupo tiadiazolilo, un grupo piridilo, un grupo

CH₂SCH₂-, un grupo representado por la fórmula: -CH₂C(=O)CH₂-, o un grupo representado por la fórmula: -CH₂NR⁶CH₂- (con la condición de que R⁶ represente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1-6 no sustituido o sustituido, un grupo acilo de C1-7 no sustituido o sustituido o un grupo alcoxi C1-6-carbonilo no sustituido o sustituido).

5 en la fórmula (II), p' representa el número de R²⁰ y representa un número entero de 0 a 4. Cuando p' es 2 o más, los R²⁰ son iguales o diferentes.

[6] El compuesto de amina cíclico según [5], en el que

10 en la fórmula (II), R¹⁰ representa un grupo alquilo de C1-6, un grupo alcoxi C1-6-alquilo de C1-6, un grupo alcoxi C1-6-alcoxi C1-6-alquilo de C1-6, un grupo alqueno de C2-6, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi de C1-6, un grupo haloalcoxi de C1-6, un grupo cicloalcoxi de C3-8, un grupo alquenoil C2-6-oxi, un grupo haloalquenoil C2-6-oxi, un grupo alquinoil C2-6-oxi, un grupo haloalquinoil C2-6-oxi, un grupo cicloalquil C3-8-alcoxi de C1-6, un grupo haloalquinoil C2-6-oxi, un grupo alquil C1-6-alcoxi de C1-6, un grupo hidroxi-alcoxi de C1-6, un grupo acil C1-7-oxi, un grupo alcoxi C1-6-carbonilo, un grupo alquenoil C2-6-oxicarbonilo, un grupo alquinoil C2-6-oxicarbonilo, un grupo alcoxi C1-6-carbonilo, un grupo alquil C1-6-aminocarbonilo, un grupo arilo de C6-10, un grupo heterocíclico, un grupo haloalquil C1-6-sulfonilo, un grupo alquilideno C1-6-amino, un grupo alcoxi C1-6-carbonilamino, un grupo aralquilo de C7-11 no sustituido o sustituido, un grupo aralquil C7-11-oxi no sustituido o sustituido, un grupo alquil C1-6-tio, o un grupo nitró;

en la fórmula (II), R¹¹ representa un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo pentafluorosulfanilo, un grupo haloalquilo de C1-6, un grupo haloalquenoil de C2-6 o un grupo haloalquinoil de C2-6; y

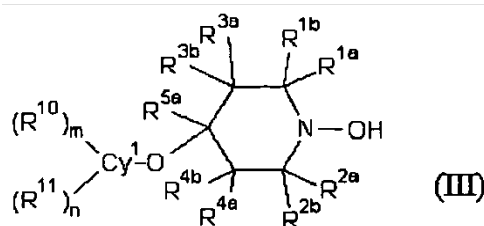
25 en la fórmula (II), R²⁰ representa un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo pentafluorosulfanilo, un grupo haloalquilo de C1-6, un grupo haloalquenoil de C2-6 o un grupo haloalquinoil de C2-6.

[7] Un agente de control de plagas, que comprende al menos uno seleccionado del compuesto de amina cíclico o sal del mismo según uno cualquiera de [1]-[6] como ingrediente activo.

30 [8] Un acaricida que comprende al menos uno seleccionado del compuesto de amina cíclico o sal del mismo según uno cualquiera de [1]-[6] como ingrediente activo.

[9] Un compuesto de hidroxilamina representado por la fórmula (III) o sal del mismo:

35 [Fórmula química 6]



40 en la fórmula (III), Cy¹ representa un grupo arilo de C6-10 o un grupo heterocíclico;

en la fórmula (III), R^{1a}, R^{1b}, R^{2a}, R^{2b}, R^{3a}, R^{3b}, R^{4a}, R^{4b} y R^{5a} representan independientemente un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C1-6 no sustituido o sustituido; y R^{1a} y R^{2a}, o R^{3a} y R^{4a} se enlazan juntos para formar un grupo alqueno de C3-6 no sustituido o sustituido, un grupo alquenoil de C3-6 no sustituido o sustituido, un grupo representado por la fórmula: -CH₂OCH₂-, un grupo representado por la fórmula: -CH₂SCH₂-, un grupo representado por la fórmula: -CH₂C(=O)CH₂-, o un grupo representado por la fórmula: -CH₂NR⁶CH₂- (con la condición de que R⁶ represente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1-6 no sustituido o sustituido, un grupo acilo de C1-7 no sustituido o sustituido o un grupo alcoxi C1-6-carbonilo no sustituido o sustituido);

50 en la fórmula (III), R¹⁰ y R¹¹ representan independientemente un grupo alquilo de C1-6 no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquilo de C3-8 no sustituido o sustituido, un grupo alquenoil de C2-6 no sustituido o sustituido, un grupo alquinoil de C2-6 no sustituido o sustituido, un grupo hidroxilo, un grupo oxo, un grupo alcoxi de C1-6 no sustituido o sustituido, un grupo cicloalcoxi de C3-8 no sustituido o sustituido, un grupo alquenoil C2-6-oxi no sustituido o sustituido, un grupo alquinoil C2-6-oxi no sustituido o sustituido, un grupo carboxilo,

55 un grupo acilo de C1-7 no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi C1-6-carbonilo no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquil C3-8-oxicarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo alquenoil C2-6-oxicarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo alquinoil C2-6-oxicarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo aril C6-10-carbonilo no sustituido o sustituido,

un grupo heterocicliloxicarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo acil C1-7-oxi no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi C1-6-carboniloxi no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquil C3-8-oxicarboniloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquenil C2-6-oxicarboniloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquinil C2-6-oxicarboniloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquil C1-6-aminocarboniloxi no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquil C3-8-aminocarboniloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquenil C2-6-aminocarboniloxi no sustituido o sustituido, un grupo alquinil C2-6-aminocarboniloxi no sustituido o sustituido, un grupo aril C6-10-aminocarboniloxi no sustituido o sustituido, un grupo heterociclilaminocarboniloxi no sustituido o sustituido, un grupo aminooxi no sustituido o sustituido, un grupo alquiliden C1-6-aminooxi no sustituido o sustituido, un grupo arilo de C6-10 no sustituido o sustituido, un grupo heterociclilo sustituido o sustituido,

un grupo aril C6-10-oxi sustituido o sustituido, un grupo heterocicliloxi sustituido o sustituido, un grupo sulfoniloxi sustituido, un grupo amino, un grupo alquil C1-6-amino no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquil C3-8-amino no sustituido o sustituido, un grupo alquenil C2-6-amino no sustituido o sustituido, un grupo alquinil C2-6-amino no sustituido o sustituido, un grupo aril C6-10-amino no sustituido o sustituido, un grupo heterociclilamino no sustituido o sustituido, un grupo hidroxiamino no sustituido o sustituido, un grupo acil C1-7-amino no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi C1-6-carbonilamino no sustituido o sustituido, un grupo alquenil C2-6-oxicarbonilamino no sustituido o sustituido, un grupo alquinil C2-6-oxicarbonilamino no sustituido o sustituido, un grupo aril C6-10-oxicarbonilamino no sustituido o sustituido, un grupo heterocicliloxicarbonilamino no sustituido o sustituido, un grupo sulfonilamino sustituido, un grupo aminocarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo mercapto, un grupo alquil C1-6-tio no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquil C3-8-tio no sustituido o sustituido, un grupo alquenil C2-6-tio no sustituido o sustituido, un grupo alquinil C2-6-tio no sustituido o sustituido, un grupo aril C6-10-tio no sustituido o sustituido, un grupo heterociclilitio no sustituido o sustituido, un grupo (alquilo de C1-6 no sustituido o sustituido)-tiocarbonilo, un grupo (alcoxi de C1-6 no sustituido o sustituido)-tiocarbonilo, un grupo (alquil C1-6-tio no sustituido o sustituido)-carbonilo, un grupo (alquil C1-6-tio no sustituido o sustituido)-tiocarbonilo, un grupo sulfinilo sustituido, un grupo sulfonilo sustituido, un grupo pentafluorosulfanilo, un grupo sililo trisustituido con alquilo de C1-6, un grupo sililo trisustituido con arilo de C6-10, un grupo ciano, un grupo nitro o un átomo de halógeno;

R^{10} y R^{11} de Cy^1 pueden formar independientemente un anillo, o se pueden enlazar juntos para formar un anillo, o se pueden enlazar con los átomos que constituyen Cy^1 para formar un anillo;

en la fórmula (III), m representa el número de R^{10} y representa un número entero de 0 a 5, cuando m es 2 o más, los R^{10} pueden ser iguales o diferentes;

en la fórmula (III), n representa el número de R^{11} y representa un número entero de 0 a 5, cuando n es 2 o más, los R^{11} pueden ser iguales o diferentes.

[10] El compuesto de hidroxilamina o sal del mismo según [9], en el que

en la fórmula (III), Cy^1 representa un grupo fenilo, un grupo pirazolilo, un grupo tiadiazolilo, un grupo piridilo, un grupo pirimidinilo o un grupo piridazinilo.

[11] El compuesto de hidroxilamina o sal del mismo según [9] o [10], en el que

en la fórmula (III), R^{10} representa un grupo alquilo de C1-6, un grupo alcoxi C1-6-alquilo de C1-6, un grupo alcoxi C1-6-alcoxi C1-6-alquilo de C1-6, un grupo alquenilo de C2-6, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi de C1-6, un grupo haloalcoxi de C1-6, un grupo cicloalcoxi de C3-8, un grupo alquenil C2-6-oxi, un grupo haloalquenil C2-6-oxi, un grupo alquinil C2-6-oxi, un grupo haloalquinil C2-6-oxi, un grupo alcoxi C1-6-alcoxi de C1-6, un grupo cicloalquil C3-8-alcoxi de C1-6, un grupo ciano-alcoxi de C1-6, un grupo acil C1-7-alcoxi de C1-6, un grupo hidroxilo-alcoxi de C1-6, un grupo acil C1-7-oxi, un grupo alcoxi C1-6-carbonilo, un grupo alquenil C2-6-oxicarbonilo, un grupo alquinil C2-6-oxicarbonilo, un grupo alcoxi C1-6-carboniloxi, un grupo alquil C1-6-aminocarboniloxi, un grupo arilo de C6-10, un grupo heterociclilo, un grupo haloalquil C1-6-sulfoniloxi, un grupo alquiliden C1-6-aminooxi, un grupo alcoxi C1-6-carbonilamino, un grupo aralquilo de C7-11 no sustituido o sustituido, un grupo aralquil C7-11-oxi no sustituido o sustituido, un grupo alquil C1-6-tio o un grupo nitro; y

en la fórmula (III), R^{11} representa un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo pentafluorosulfanilo, un grupo haloalquilo de C1-6, un grupo haloalquenilo de C2-6 o un grupo haloalquinilo de C2-6.

Efectos de la invención

El compuesto de amina cíclico o sal del mismo según la presente invención hace posible prevenir de forma eficaz los acaricidas que son dañinos para cultivos agrícolas o dañinos en términos de higiene.

El compuesto de hidroxilamina o sal del mismo según la invención hace posible sintetizar fácilmente el compuesto de amina cíclico o la sal del mismo según la presente invención.

Mejor modo de poner en práctica la invención

[Compuesto de amina cíclico]

5 El compuesto de amina de la presente invención está representado por la fórmula (I) o (II). Además, la sal del compuesto de amina cíclico de la presente invención es una sal de un compuesto cíclico representado por la fórmula (I) o (II).

10 La expresión “no sustituido” significa en esta descripción que un grupo base es el único grupo que constituye el grupo. Además, excepto que se indique específicamente de otro modo, un grupo tiene el significado de estar “no sustituido” cuando el grupo no se describe como “sustituido” y se describe usando el nombre del grupo base.

15 Por otro lado, el término “sustituido” significa que cualquiera de los átomos de hidrógeno del grupo base está sustituido por un grupo que es el mismo que o diferente del grupo base. El grupo “sustituido” puede estar sustituido con un sustituyente, o dos o más sustituyentes. Los dos o más sustituyentes pueden ser iguales o diferentes.

20 El término “C1-6”, por ejemplo, significa que el grupo base tiene 1 a 6 átomos de carbono. Este número no incluye el número de átomos de carbono que constituyen los sustituyentes. Por ejemplo, un grupo butilo sustituido con un grupo etoxi se clasifica en un grupo alcoxi de C2 alquilo de C4.

El “sustituyente” no está particularmente limitado en tanto que sea químicamente permisible y logre los efectos de la presente invención.

25 Ejemplos del “sustituyente” incluyen un átomo de halógeno tal como un átomo de flúor, átomo de cloro, átomo de bromo, átomo de yodo o similar; un grupo alquilo de C1-6 tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo n-hexilo o similar; un grupo cicloalquilo de C3-8 tal como un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo, un grupo cicloheptilo o similar; un grupo alquenilo de C2-6 tal como un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 1-pentenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 3-pentenilo, un grupo 4-pentenilo, un grupo 1-metil-2-butenilo, un grupo 2-metil-2-butenilo, un grupo 1-hexenilo, un grupo 2-hexenilo, un grupo 3-hexenilo, un grupo 4-hexenilo, un grupo 5-hexenilo o similar; un grupo cicloalquenilo de C3-8 tal como un grupo 2-ciclopropenilo, un grupo 2-ciclopentenilo, un grupo 3-ciclohexenilo, un grupo 4-ciclooctenilo o similar; un grupo alquinilo de C2-6 tal como un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 1-metil-2-propinilo, un grupo 2-metil-3-butinilo, un grupo 1-pentinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo, un grupo 4-pentinilo, un grupo 1-metil-2-butinilo, un grupo 2-metil-3-pentinilo, un grupo 1-hexinilo, un grupo 1,1-dimetil-2-butinilo o similar;

40 un grupo alcoxi de C1-6 tal como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi, un grupo t-butoxi o similar; un grupo alquenil C2-6-oxi tal como un grupo viniloxi, un grupo aliloxi, un grupo propeniloxi, un grupo buteniloxi o similar; un grupo alquiniil C2-6-oxi tal como un grupo etiniloxi, un grupo propargiloxi o similar; un grupo arilo de C6-10 tal como un grupo fenilo, un grupo naftilo o similar; un grupo aril C6-10-oxi tal como un grupo fenoxi, un grupo 1-naftoxi o similar; un grupo aralquilo de C7-11 tal como un grupo bencilo, un grupo fenetilo o similar; un grupo aralquil C7-11-oxi tal como un grupo benciloxi, un grupo fenetiloxi o similar; un grupo acilo de C1-7 tal como un grupo formilo, un grupo acetilo, un grupo propionilo, un grupo benzoilo, un grupo ciclohexil-carbonilo o similar; un grupo acil C1-7-oxi tal como un grupo formiloxi, un grupo acetiloxi, un grupo propioniloxi, un grupo benzoiloxi, un grupo ciclohexil-carboniloxi o similar; un grupo alcoxi C1-6-carbonilo tal como un grupo metoxicarbonilo, un grupo etoxicarbonilo, un grupo propoxicarbonilo, un grupo i-propoxicarbonilo, un grupo n-butoxicarbonilo, un grupo t-butoxicarbonilo o similar; un grupo carboxilo;

50 un grupo hidroxilo; un grupo oxo; un grupo haloalquilo de C1-6 tal como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo, un grupo 1-fluoro-n-butilo, un grupo perfluoro-n-pentilo o similar; un grupo haloalquenilo de C2-6 tal como un grupo 2-cloro-1-propenilo, un grupo 2-fluoro-1-butenilo o similar; un grupo haloalquinilo de C2-6 tal como un grupo 4,4-dicloro-1-butinilo, un grupo 4-fluoro-1-pentinilo, un grupo 5-bromo-2-pentinilo o similar; un grupo haloalcoxi de C1-6 tal como un grupo 2-cloro-n-propoxi, un grupo 2,3-diclorobutoxi o similar; un grupo haloalquenil C2-6-oxi tal como un grupo 2-cloropropeniloxi, un grupo 3-bromobuteniloxi o similar; un haloarilo de C6-10 tal como un grupo 4-clorofenilo, un grupo 4-fluorofenilo, un grupo 2,4-diclorofenilo o similar; un grupo haloarilo de C6-10 tal como un grupo 4-fluorofeniloxi, un grupo 4-cloro-1-naftoxi o similar; un grupo acilo de C1-7 sustituido con halógeno tal como un grupo cloroacetilo, un grupo trifluoroacetilo, un grupo tricloroacetilo, un grupo 4-clorobenzoilo o similar;

60 un grupo ciano; un grupo isociano; un grupo nitro; un grupo isocianato; un grupo cianato; un grupo amino; un grupo alquil C1-6-amino tal como un grupo metilamino, un grupo dimetilamino, un grupo dietilamino o similar; un grupo aril C6-10-amino tal como un grupo anilino, un grupo naftilamino o similar; un grupo aralquil C7-11-amino tal como un grupo bencilamino, un grupo feniletilamino o similar; un grupo acil C1-7-amino tal como un grupo formilamino, un grupo acetilamino, un grupo propanoilamino, un grupo butirilamino, un grupo i-propilcarbonilamino, un grupo

benzoilamino o similar; un grupo alcoxi C1-6-carbonilamino tal como un grupo metoxicarbonilamino, un grupo etoxicarbonilamino, un grupo n-propoxicarbonilamino, un grupo i-propoxicarbonilamino o similar; un grupo aminocarbonilo no sustituido o sustituido tal como un grupo aminocarbonilo, un grupo dimetilaminocarbonilo, un grupo fenilaminocarbonilo, un grupo N-fenil-N-metilaminocarbonilo o similar; un grupo alquilo de C1-6 sustituido con imino tal como un grupo iminometilo, un grupo (1-imino)etilo, un grupo (1-imino)-n-propilo o similar; un grupo alquilo de C1-6 sustituido con hidroxiiimino tal como un grupo hidroxiiiminometilo, un grupo (1-hidroxiiimino)etilo, un grupo (1-hidroxiiimino)propilo, un grupo metoxiiiminometilo, un grupo (1-metoxiiimino)etilo o similar;

un grupo mercapto; un grupo isotiocianato; un grupo tiocianato; un grupo alquil C1-6-tio tal como un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo n-propiltio, un grupo i-propiltio, un grupo n-butiltio, un grupo i-butiltio, un grupo s-butiltio, un grupo t-butiltio o similar; un grupo alquenil C2-6-tio tal como un grupo viniltio, un grupo aliltio o similar; un grupo alquiniil C2-6-tio tal como un grupo etiniltio, un grupo propargiltio o similar; un grupo aril C6-10-tio tal como un grupo feniltio, un grupo naftiltio o similar; un grupo heterociciltio tal como un grupo tiazoliltio, un grupo piridiltio o similar; un grupo aralquil C7-11-tio tal como un grupo benciltio, un grupo fenetiltio o similar; un grupo (alquil C1-6-tio)carbonilo tal como un grupo (metiltio)carbonilo, un grupo (etiltio)carbonilo, un grupo (n-propiltio)carbonilo, un grupo (i-propiltio)carbonilo, un grupo (n-butiltio)carbonilo, un grupo (i-butiltio)carbonilo, un grupo (s-butiltio)carbonilo, un grupo (t-butiltio)carbonilo o similar;

un grupo alquil C1-6-sulfinilo tal como un grupo metilsulfinilo, un grupo etilsulfinilo, un grupo t-butilsulfinilo o similar; un grupo alquenil C2-6-sulfinilo tal como un grupo alilsulfinilo o similar; un grupo alquiniil C2-6-sulfinilo tal como un grupo propargilsulfinilo o similar; un grupo aril C6-10-sulfinilo tal como un grupo fenilsulfinilo o similar; un grupo heterocicilsulfinilo tal como un grupo tiazolilsulfinilo, un grupo piridilsulfinilo o similar; un grupo aralquil C7-11-sulfinilo tal como un grupo bencilsulfinilo, un grupo fenetilsulfinilo o similar; un grupo alquil C1-6-sulfonilo tal como un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo t-butilsulfonilo o similar; un grupo alquenil C2-6-sulfonilo tal como un grupo alilsulfonilo o similar; un grupo alquiniil C2-6-sulfonilo tal como un grupo propargilsulfonilo o similar; un grupo aril C6-10-sulfonilo tal como un grupo fenilsulfonilo o similar; un grupo heterocicilsulfonilo tal como un grupo tiazolilsulfonilo, un grupo piridilsulfonilo o similar; un grupo aralquil C7-11-sulfonilo tal como un grupo bencilsulfonilo, un grupo fenetilsulfonilo o similar;

un grupo heteroarilo de 5 miembros tal como un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxadiazolilo, un grupo tiadiazolilo, un grupo tetrazolilo o similar; un grupo heteroarilo de 6 miembros tal como un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo, un grupo triazinilo o similar; un grupo heterociclilo saturado tal como un grupo aziridinilo, un grupo epoxi, un grupo pirrolidinilo, un grupo tetrahidrofurano, un grupo piperidilo, un grupo piperazinilo, un grupo morfolinilo o similar; un grupo sililo trisustituido con alquilo de C1-6 tal como un grupo trimetilsililo, un grupo trietilsililo, un grupo t-butildimetilsililo o similar; un grupo trifenilsililo o similar; o similares.

Además, estos “sustituyentes” pueden estar sustituidos con otros “sustituyentes”.

[Cy¹, Cy²]

En la fórmula (I), Cy¹ y Cy² representan independientemente un grupo arilo de C6-10 o un grupo heterocíclico.

El “grupo arilo de C6-10” de Cy¹ y Cy² puede ser un grupo arilo de C6-10 monocíclico o policíclico. En el grupo arilo policíclico, en tanto que incluya al menos un anillo aromático, otros anillos pueden ser un anillo alicíclico saturado, un anillo alicíclico insaturado, o un anillo aromático. Ejemplos del grupo arilo de C6-10 incluyen un grupo fenilo, un grupo naftilo, un grupo azuleno, un grupo indenilo, un grupo indanilo, un grupo tetralinilo o similares. Entre estos grupos, un grupo fenilo es preferible como el “grupo arilo de C6-10” de Cy¹ o Cy².

El “grupo heterociclilo” de Cy¹ y Cy² es un grupo en el que se incluyen 1-4 heteroátomos, seleccionados de un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno, y un átomo de azufre, como los átomos que constituyen el anillo. El grupo heterociclilo puede ser un grupo monoheterociclilo o un grupo poliheterociclilo.

Ejemplos del grupo heterociclilo incluyen un grupo heteroarilo de 5 miembros, un grupo heteroarilo de 6 miembros, un grupo heteroarilo condensado, un grupo heterociclilo saturado, un grupo heterociclilo parcialmente insaturado o similares.

Ejemplos del grupo heteroarilo de 5 miembros incluyen un grupo pirrolilo tal como un grupo pirrol-1-ilo, pirrol-2-ilo, pirrol-3-ilo o similar; un grupo furilo tal como un grupo furan-2-ilo, furan-3-ilo o similar; un grupo tienilo tal como un grupo tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo o similar; un grupo imidazolilo tal como un grupo imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, imidazol-4-ilo, imidazol-5-ilo o similar; un grupo pirazolilo tal como un grupo pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-4-ilo, pirazol-5-ilo o similar; un grupo oxazolilo tal como un grupo oxazol-2-ilo, oxazol-4-ilo, oxazol-5-ilo o similar; un grupo isoxazolilo tal como un grupo isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo o similar; un grupo tiazolilo tal como un grupo tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, tiazol-5-ilo o similar; un grupo isotiazolilo tal como un grupo isotiazol-3-ilo, isotiazol-4-ilo, isotiazol-5-ilo o similar; un grupo triazolilo tal como un grupo 1,2,3-triazol-1-ilo, 1,2,3-triazol-4-ilo, 1,2,3-triazol-5-ilo, 1,2,4-triazol-1-

ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,2,4-triazol-5-ilo o similar; un grupo oxadiazolilo tal como un grupo 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, 1,3,4-oxadiazol-2-ilo o similar; un grupo tiadiazolilo tal como un grupo 1,2,4-tiadiazol-3-ilo, 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo o similar; un grupo tetrazolilo tal como un grupo tetrazol-1-ilo, tetrazol-2-ilo o similar; o similar.

5 Ejemplos del grupo heteroarilo de 6 miembros incluyen un grupo piridilo tal como un grupo piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo o similar; un grupo pirazinilo tal como un grupo pirazin-2-ilo, pirazin-3-ilo o similar; un grupo pirimidinilo tal como un grupo pirimidin-2-ilo, pirimidin-4-ilo, pirimidin-5-ilo o similar; un grupo piridazinilo tal como un grupo piridazin-3-ilo, piridazin-4-ilo o similar; un grupo triazinilo o similar; o similares.

10 Ejemplos del grupo heteroarilo condensado incluyen un grupo indol-1-ilo, indol-2-ilo, indol-3-ilo, indol-4-ilo, indol-5-ilo, indol-6-ilo, indol-7-ilo; un grupo benzofuran-2-ilo, un grupo benzofuran-3-ilo, un grupo benzofuran-4-ilo, un grupo benzofuran-5-ilo, un grupo benzofuran-6-ilo, un grupo benzofuran-7-ilo; un grupo benzotiofen-2-ilo, un grupo benzotiofen-3-ilo, un grupo benzotiofen-4-ilo, un grupo benzotiofen-5-ilo, un grupo benzotiofen-6-ilo, un grupo benzotiofen-7-ilo; un grupo bencimidazol-1-ilo, un grupo bencimidazol-2-ilo, un grupo bencimidazol-4-ilo, un grupo bencimidazol-5-ilo, un grupo benzoxazol-2-ilo, un grupo benzoxazol-4-ilo, un grupo benzoxazol-5-ilo, un grupo benzotiazol-2-ilo, un grupo benzotiazol-4-ilo, un grupo benzotiazol-5-ilo; un grupo quinolin-2-ilo, un grupo quinolin-3-ilo, un grupo quinolin-4-ilo, un grupo quinolin-5-ilo, un grupo quinolin-6-ilo, un grupo quinolin-7-ilo, un grupo quinolin-8-ilo o similar; o similares.

20 Ejemplos de otro grupo heterociclilo incluyen un grupo aziridin-1-ilo, un grupo aziridin-2-ilo, epoxi; un grupo pirrolidin-1-ilo, un grupo pirrolidin-2-ilo, un grupo pirrolidin-3-ilo, un grupo tetrahidrofuran-2-ilo, un grupo tetrahidrofuran-3-ilo; un grupo [1,3]dioxiran-2-ilo, un grupo [1,3]dioxiran-4-ilo; un grupo piperidin-1-ilo, un grupo piperidin-2-ilo, un grupo piperidin-3-ilo, un grupo piperidin-4-ilo, un grupo piperazin-1-ilo, un grupo piperazin-2-ilo, un grupo morfolin-2-ilo, un grupo morfolin-3-ilo, un grupo morfolin-4-ilo; un grupo 1,3-benzodioxol-4-ilo, un grupo 1,3-benzodioxol-5-ilo, un grupo 1,4-benzodioxan-5-ilo, un grupo 1,4-benzodioxan-6-ilo, un grupo 3,4-dihidro-2H-1,5-benzodioxepin-6-ilo, un grupo 3,4-dihidro-2H-1,5-benzodioxepin-7-ilo, un grupo 2,3-dihidrobenzofuran-4-ilo, un grupo 2,3-dihidrobenzofuran-5-ilo, un grupo 2,3-dihidrobenzofuran-6-ilo, un grupo 2,3-dihidrobenzofuran-7-ilo; o similares.

30 Entre estos grupos, el grupo heterociclilo de Cy^1 o Cy^2 es preferiblemente un grupo heteroarilo de 5 miembros o un grupo heteroarilo de 6 miembros, más preferiblemente un grupo pirazolilo, un grupo tiadiazolilo, un grupo piridilo, un grupo pirimidinilo, o un grupo piridazinilo.

35 En el compuesto de amina cíclico de la presente invención, Cy^1 es preferiblemente un grupo fenilo, Cy^2 es preferiblemente un grupo piridilo.

$[R^{1a}, R^{1b}, R^{2a}, R^{2b}, R^{3a}, R^{3b}, R^{4a}, R^{4b} \text{ y } R^{5a}]$

40 En la fórmula (I), $R^{1a}, R^{1b}, R^{2a}, R^{2b}, R^{3a}, R^{3b}, R^{4a}, R^{4b} \text{ y } R^{5a}$ (en lo sucesivo aquí, pueden denominarse como "R^{1a} o similares") representan independientemente un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo de C1-6 no sustituido o sustituido; R^{1a} y R^{2a} , o R^{3a} y R^{4a} se enlazan juntos para formar un grupo alqueno de C3-6 no sustituido o sustituido, un grupo alqueno de C3-6 no sustituido o sustituido, un grupo representado por la fórmula: $-CH_2OCH_2-$, un grupo representado por la fórmula: $-CH_2SCH_2-$, un grupo representado por la fórmula: $-CH_2C(=O)CH_2-$, o un grupo representado por la fórmula: $-CH_2NR^6CH_2-$ (con la condición de que R^6 represente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1-6 no sustituido o sustituido, un grupo acilo de C1-7 no sustituido o sustituido, o un grupo alcoxi C1-6-carbonilo no sustituido o sustituido). Además, el grupo formado enlazando R^{1a} con R^{2a} , R^{3a} con R^{4a} puede denominarse como "resto reticulante".

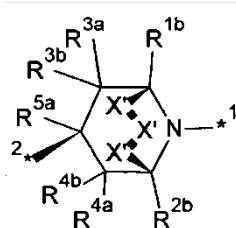
50 El "grupo alquilo de C1-6" de R^{1a} o similar puede ser un grupo alquilo lineal o un grupo alquilo ramificado. Ejemplos del grupo alquilo incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo n-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo n-hexilo, un grupo i-propilo, un grupo i-butilo, un grupo s-butilo, un grupo t-butilo, un grupo i-pentilo, un grupo neopentilo, un grupo 2-metilbutilo, un grupo 2,2-dimetilpropilo, un grupo i-hexilo o similar.

55 Ejemplos del "grupo alquilo de C1-6 sustituido" de R^{1a} o similar incluyen un grupo cicloalquil C3-8-alquilo de C1-6 tal como un grupo ciclopropiletilo, un grupo 2-ciclopropiletilo, ciclopentiletilo, un grupo 2-ciclohexiletilo, un grupo 2-ciclooctiletilo o similar; un grupo haloalquilo de C1-6 tal como un grupo fluoroetilo, un grupo clorometilo, un grupo bromometilo, un grupo difluorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo dibromometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo tribromometilo, un grupo 2,2,2-tolulfluoroetilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo 4-fluorobutilo, un grupo 4-clorobutilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo 2,2,2-trifluoro-1-trifluorometiletilo, un grupo perfluorohexilo, un grupo perclorohexilo, un grupo perfluorooctilo, un grupo perclorooctilo, un grupo 2,4,6-triclorohexilo, un grupo hexafluoroisopropilo, un grupo pentafluoroisopropilo, un grupo perfluorometoxi o similar;

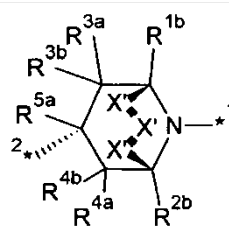
65 un grupo hidroxi-alquilo de C1-6 tal como un grupo hidroximetilo, un grupo 2-hidroxietilo o similar; un grupo alcoxi C1-6-alquilo de C1-6 tal como un grupo metoximetilo, un grupo etoximetilo, un grupo metoxietilo, un grupo etoxietilo, un grupo metoxi-n-propilo, un grupo n-propoximetilo, un grupo i-propoximetilo, un grupo i-propoxietilo, un grupo s-

- butoximetilo, un grupo t-butoxietilo o similar; un grupo alcoxi C1-6-alcoxi C1-6-alquilo de C1-6 tal como un grupo metoximetoximetilo, un grupo 1-metoxietoximetilo, un grupo 2-metoxietoximetilo, un grupo 2-(1-metoxietoxi)etilo, un grupo 2-(2-metoxietoxi)etilo o similar; un grupo di-alcoxi C1-6-alquilo de C1-6 tal como un grupo dimetoximetilo, un grupo dietoximetilo, un grupo 2,2-dimetoxietilo, un grupo 1,2-dimetoxietilo, un grupo 3,3-dimetoxi-n-propilo, un grupo 2,2-dietoxietilo o similar; un grupo acil C-7-oxi-alquilo de C1-6 tal como un grupo formiloximetilo, un grupo acetoximetilo, un grupo 2-acetoxietilo, un grupo propioniloximetilo, un grupo propioniloxietilo o similar; un grupo alquilo de C1-6 sustituido con imino tal como un grupo iminometilo, un grupo (1-imino)etilo, un grupo (1-imino)propilo o similar;
- 5 un grupo alquilo de C1-6 sustituido con hidroxiiimino tal como un grupo hidroxiiiminometilo, un grupo (1-hidroxiiimino)etilo, un grupo (1-hidroxiiimino)-n-propilo, un grupo metoxiiiminometilo, un grupo (1-metoxiiimino)etilo o similar;
- 10 un grupo aralquilo de C7-11 no sustituido o sustituido, tal como un grupo bencilo no sustituido o sustituido, un grupo fenetilo no sustituido o sustituido, o similar; o similares.
- 15 Ejemplos del grupo "alquileno de C3-6" formado enlazando R^{1a} con R^{2a} , o R^{3a} con R^{4a} incluyen un grupo trimetileno, un grupo tetrametileno, un grupo propileno o similar. Entre estos grupos, es preferible un grupo alquileno de C3-4.
- 20 Además, ejemplos del grupo "alquenileno de C3-6" incluyen un grupo propenileno, un grupo 2-butenileno o similar. Entre estos grupos, es preferible un grupo alquenileno de C3-4.
- Ejemplos del posible "sustituyente" incluyen un átomo de halógeno tal como un átomo de flúor, átomo de cloro, átomo de bromo, átomo de yodo o similar; un grupo alquilo de C1-6 tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo n-hexilo o similar; un grupo cicloalquilo de C3-6 tal como un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo o similar; un grupo alcoxi de C1-6 tal como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi, un grupo t-butoxi o similar; un grupo hidroxil; un grupo haloalquilo de C1-6 tal como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo, un grupo 1-fluoro-n-butilo, un grupo perfluoro-n-pentilo o similar; o similares.
- 25 En la fórmula $-CH_2NR^6CH_2-$, R^6 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1-6 no sustituido o sustituido, un grupo acilo de C1-7 no sustituido o sustituido, o un grupo alcoxi C1-6-carbonilo no sustituido o sustituido.
- 30 Ejemplos del "grupo alquilo de C1-6 no sustituido o sustituido" de R^6 son los mismos que los listados como ejemplos de R^{1a} o similares.
- 35 Ejemplos del "grupo acilo de C1-7" de R^6 incluyen un grupo formilo, un grupo acetilo, un grupo propionilo, un grupo benzoílo, un grupo ciclohexil-carbonilo o similares.
- 40 Ejemplos del "grupo acilo de C1-7 sustituido" de R^6 incluyen un grupo cloroacetilo, un grupo trifluoroacetilo, un grupo tricloroacetilo, un grupo 4-clorobenzoílo o similares.
- 45 Ejemplos del "grupo alcoxi C1-6-carbonilo" de R^6 incluyen un grupo metoxicarbonilo, un grupo etoxicarbonilo, un grupo propoxicarbonilo, un grupo i-propoxicarbonilo, un grupo n-butoxicarbonilo, un grupo t-butoxicarbonilo o similares.
- 50 Ejemplos del "grupo alcoxi C1-6-carbonilo sustituido" de R^6 incluyen un grupo cicloalquil C3-8-alcoxi C1-6-carbonilo tal como un grupo ciclopropiletoxicarbonilo, un grupo ciclobutiletoxicarbonilo, un grupo ciclopentiletoxicarbonilo, un grupo ciclohexiletoxicarbonilo, un grupo 2-metilciclopropiletoxicarbonilo, un grupo 2,3-dimetilciclopropiletoxicarbonilo, un grupo 2-clorociclopropiletoxicarbonilo, un grupo 2-ciclopropiletoxicarbonilo o similar; un grupo haloalcoxi C1-6-carbonilo tal como un grupo fluorometoxicarbonilo, un grupo clorometoxicarbonilo, un grupo bromometoxicarbonilo, un grupo difluorometoxicarbonilo, un grupo diclorometoxicarbonilo, un grupo dibromometoxicarbonilo, un grupo trifluorometoxicarbonilo, un grupo triclorometoxicarbonilo, un grupo tribromometoxicarbonilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetoxicarbonilo, un grupo 2,2,2-tricloroetoxicarbonilo, un grupo pentafluoroetoxicarbonilo, un grupo 4-fluorobutoxicarbonilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropoxicarbonilo, un grupo 2,2,2-trifluoro-1-trifluorometiletoxicarbonilo, un grupo perfluorohexiloxicarbonilo o similar; o similares.
- 55 Las siguientes fórmulas estructurales parciales (a1)-(a4) se muestran para explicar específicamente el resto reticulante. En las fórmulas (a1)-(a4), *1 representa la posición que se enlaza con Y, *2 representa la posición que se enlaza con el átomo de oxígeno. Los X representan independientemente $-CH_2-$, un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, $-NR^6-$, un grupo carbonilo, o similar. La presente invención también incluye isómeros en los que el resto reticulante tiene relación exo o relación endo con R^{6a} , o mezclas de los mismos.
- 60
- 65

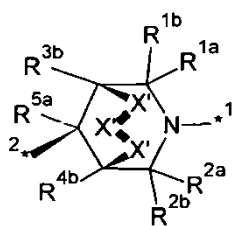
[Fórmula química 7]



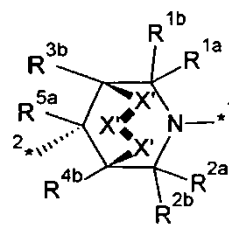
(a1)



(a2)



(a3)



(a4)

5 [R¹⁰, R¹¹, R²⁰, R²¹]

En la fórmula (I), R¹⁰, R¹¹, R²⁰ y R²¹ (en lo sucesivo aquí, puede denominarse como "R¹⁰ o similares") representan independientemente un grupo alquilo de C1-6 no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquilo de C3-8 no sustituido o sustituido, un grupo alqueno de C2-6 no sustituido o sustituido, un grupo alquino de C2-6 no sustituido o sustituido, un grupo hidroxilo, un grupo oxo, un grupo alcoxi de C1-6 no sustituido o sustituido, un grupo cicloalcoxi de C3-8 no sustituido o sustituido, un grupo alquenoil C2-6-oxi no sustituido o sustituido, un grupo alquinoil C2-6-oxi no sustituido o sustituido, un grupo carboxilo, un grupo acilo de C1-7 no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi C1-6-carbonilo no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquil C3-8-oxicarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo alquenoil C2-6-oxicarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo alquinoil C2-6-oxicarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo aril C6-10-oxicarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo heterociclioxicarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo acil C1-7-oxi no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi C1-6-oxicarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquil C3-8-oxicarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo alquenoil C2-6-oxicarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo alquinoil C2-6-oxicarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo alquil C1-6-aminocarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquil C3-8-aminocarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo alquenoil C2-6-aminocarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo alquinoil C2-6-aminocarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo aril C6-10-aminocarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo heterocicliaminocarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo amino no sustituido o sustituido, un grupo alquiden C1-6-amino no sustituido o sustituido, un grupo arilo de C6-10 no sustituido o sustituido, un grupo heterociclilo sustituido o sustituido, un grupo aril C6-10-oxi sustituido o sustituido, un grupo heterociclioxi sustituido o sustituido, un grupo sulfonilo sustituido, un grupo amino, un grupo alquil C1-6-amino no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquil C3-8-amino no sustituido o sustituido, un grupo alquenoil C2-6-amino no sustituido o sustituido, un grupo alquinoil C2-6-amino no sustituido o sustituido, un grupo aril C6-10-amino no sustituido o sustituido, un grupo heterocicliamino no sustituido o sustituido, un grupo hidroxiamino no sustituido o sustituido, un grupo acil C1-7-amino no sustituido o sustituido, un grupo alcoxi C1-6-carbonilamino no sustituido o sustituido, un grupo alquenoil C2-6-oxicarbonilamino no sustituido o sustituido, un grupo alquinoil C2-6-oxicarbonilamino no sustituido o sustituido, un grupo aril C6-10-oxicarbonilamino no sustituido o sustituido, un grupo heterociclioxicarbonilamino no sustituido o sustituido, un grupo sulfonilamino sustituido, un grupo aminocarbonilo no sustituido o sustituido, un grupo mercapto, un grupo alquil C1-6-tio no sustituido o sustituido, un grupo cicloalquil C3-8-tio no sustituido o sustituido, un grupo alquenoil C2-6-tio no sustituido o sustituido, un grupo alquinoil C2-6-tio no sustituido o sustituido, un grupo aril C6-10-tio no sustituido o sustituido, un grupo heterocicliitio no sustituido o sustituido, un grupo (alquilo de C1-6 no sustituido o sustituido)-tiocarbonilo, un grupo (alcoxi de C1-6 no sustituido o sustituido)-tiocarbonilo, un grupo (alquil C1-6-tio no sustituido o sustituido)-carbonilo, un grupo (alquil C1-6-tio no sustituido o sustituido)-tiocarbonilo, un grupo sulfonilo sustituido, un grupo sulfonilo sustituido, un grupo pentafluorosulfonilo, un grupo sililo trisustituido con alquilo de C1-6, un grupo sililo trisustituido con arilo de C6-10, un grupo ciano, un grupo nitro o un átomo de halógeno.

R¹⁰ y R¹¹ de Cy¹ pueden formar independientemente un anillo, o se pueden enlazar juntos para formar un anillo, o se pueden enlazar con los átomos que constituyen Cy¹ para formar un anillo; R²⁰ y R²¹ de Cy² pueden formar

independientemente un anillo, o se pueden enlazar juntos para formar un anillo, o se pueden enlazar con los átomos que constituyen Cy^2 para formar un anillo.

5 m representa el número de R^{10} y representa un número entero de 0-5, representa preferiblemente 1. Cuando m es 2 o más, los R^{10} pueden ser iguales o diferentes.

n representa el número de R^{11} y representa un número entero de 0-5, representa preferiblemente 1. Cuando n es 2 o más, los R^{11} pueden ser iguales o diferentes.

10 p representa el número de R^{20} y representa un número entero de 0 a 5, representa preferiblemente 1. Cuando p es 2 o más, los R^{20} pueden ser iguales o diferentes.

r representa el número de R^{21} y representa un número entero de 0 a 5, representa preferiblemente 1. Cuando r es 2 o más, los R^{21} pueden ser iguales o diferentes.

15 Ejemplos del "grupo alquilo de C1-6 no sustituido o sustituido" de R^{10} o similares son los mismos que aquellos listados como ejemplos de R^{1a} o similares.

20 Además, distintos de los ejemplos de R^{1a} o similares, los ejemplos del "grupo alquilo de C1-6 no sustituido o sustituido" también incluyen un grupo cicloalcoxi C3-8-alquilo de C1-6 tal como un grupo clorociclohexiloximetilo, un grupo bromociclohexiloximetilo, un grupo 2-metilciclopropiloximetilo, un grupo 2,3-dimetilciclopropiloximetilo, un grupo espiro[2.2]penta-1-iloximetilo, un grupo 1-metil-espiro[2.2]penta-1-iloximetilo, un grupo 1-hidroximetil-espiro[2.2]penta-1-iloximetilo, un grupo 4,4-difluoro-espiro[2.2]penta-1-iloximetilo, un grupo biciclopropil-2-iloximetilo o similar; un grupo cicloalquil C3-8-alcoxi C1-6-alquilo de C1-6 sustituido tal como un grupo clorociclohexilmetoximetilo, un grupo bromociclohexilmetoximetilo, un grupo 2-metilciclopropilmetoximetilo, un grupo 2,3-dimetilciclopropilmetoximetilo, un grupo espiro[2.2]penta-1-ilmtoximetilo, un grupo 1-metil-espiro[2.2]penta-1-ilmtoximetilo, un grupo 1-hidroximetil-espiro[2.2]penta-1-ilmtoximetilo, un grupo 4,4-difluoro-espiro[2.2]penta-1-ilmtoximetilo, un grupo biciclopropil-2-ilmtoximetilo o similar; o similares.

30 Ejemplos del "grupo cicloalquilo de C3-8" de R^{10} incluyen un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo, un grupo cicloheptilo o similares.

35 Ejemplos del "grupo cicloalquilo de C3-8 sustituido" incluyen un grupo clorociclohexilo, un grupo bromociclohexilo, un grupo 2-metilciclopropilo, un grupo 2,3-dimetilciclopropilo, un grupo espiro[2.2]penta-1-ilo, un grupo 1-metil-espiro[2.2]penta-1-ilo, un grupo 1-hidroximetil-espiro[2.2]penta-1-ilo, un grupo 4,4-difluoro-espiro[2.2]penta-1-ilo, un grupo biciclopropil-2-ilo o similares.

40 Ejemplos del "grupo alqueno de C2-6" de R^{10} o similares incluyen un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 1-pentenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 3-pentenilo, un grupo 4-pentenilo, un grupo 1-metil-2-butenilo, un grupo 2-metil-2-butenilo, un grupo 1-hexenilo, un grupo 2-hexenilo, un grupo 3-hexenilo, un grupo 3-hexenilo, un grupo 5-hexenilo o similares.

45 Ejemplos del "grupo alqueno de C2-6 sustituido" de R^{10} o similares incluyen un grupo haloalqueno de C2-6 tal como un grupo 2-cloro-1-propenilo, un grupo 2-fluoro-1-butenilo o similar; o similares.

50 Ejemplos del "grupo alqueno de C2-6" de R^{10} o similares incluyen un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 1-metil-2-propinilo, un grupo 2-metil-3-butinilo, un grupo 1-pentinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo, un grupo 4-pentinilo, un grupo 1-metil-2-butinilo, un grupo 2-metil-3-pentinilo, un grupo 1-hexinilo, un grupo 1,1-dimetil-2-butinilo o similares.

Ejemplos del "grupo alqueno de C2-6 sustituido" de R^{10} o similares incluyen un grupo haloalqueno de C2-6 tal como un grupo 4,4-dicloro-1-butinilo, un grupo 4-fluoro-1-pentinilo, un grupo 5-bromo-2-pentinilo o similar; o similares.

55 Ejemplos del "grupo alcoxi de C1-6" de R^{10} o similares incluyen un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo i-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo t-butoxi, un grupo n-pentiloxi, un grupo i-pentiloxi, un grupo 2-metilbutoxi, un grupo neopentilo, un grupo n-hexiloxi o similares. Entre estos grupos alcoxi, es preferible un grupo alcoxi de C3-6.

60 Ejemplos del "grupo alcoxi de C1-6 sustituido" de R^{10} o similares incluyen un grupo haloalcoxi de C1-6 tal como un grupo fluorometoxi, un grupo clorometoxi, un grupo bromometoxi, un grupo difluorometoxi, un grupo diclorometoxi, un grupo dibromometoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo triclorometoxi, un grupo tribromometoxi, un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi, un grupo 2,2,2-tricloroetoxi, un grupo pentafluoroetoxi, un grupo 4-fluorobutoxi, un grupo 3,3,3-trifluoropropoxi, un grupo 2,2,2-trifluoro-1-trifluorometiletoxi, un grupo perfluorohexiloxi o similar; un grupo hidroxialcoxi de C1-6 tal como un grupo 2-hidroxietoxi, un grupo 2-hidroxipropoxi o similar; un grupo alcoxi C1-6-alcoxi de C1-6 tal como un grupo metoximetoxi, un grupo 1-metoxietoxi, un grupo 2-metoxietoxi, un grupo etoximetoxi, un

65

5 grupo 1-etoxietoxi, un grupo 2-etoxietoxi, un grupo 1-metoxi-n-propoxi, un grupo 2-metoxi-n-propoxi, un grupo 3-metoxi-n-propoxi o similar; un grupo cicloalquil C3-8-alcoxi de C1-6 tal como un grupo ciclopropiletoxi, un grupo ciclobutiletoxi, un grupo ciclopentiletoxi, un grupo ciclohexiletoxi, un grupo 2-metilciclopropiletoxi, un grupo 2,3-dimetilciclopropiletoxi, un grupo 2-ciclopropiletoxi o similar; un grupo aralquil C7-11-oxi tal como un grupo benciloxi, un grupo fenetiloxi o similar; un grupo acil C1-7-alcoxi de C1-6 tal como un grupo acetiletoxi, un grupo 2-acetiletoxi o similar; un grupo ciano-alcoxi de C1-6 tal como un grupo cianometoxi, un grupo 2-cianoetoxi o similar; un grupo cicloalquil C3-8-alcoxi de C1-6 sustituido tal como un grupo clorociclohexiletoxi, un grupo bromociclohexiletoxi, un grupo 2-metilciclopropiletoxi, un grupo 2,3-dimetilciclopropiletoxi, un grupo espiro[2.2]penta-1-iletexi, un grupo 1-metil-espiro[2.2]penta-1-iletexi, un grupo 1-hidroximetil-espiro[2.2]penta-1-iletexi, un grupo 4,4-difluoro-espiro[2.2]penta-1-iletexi, un grupo biciclopropil-2-ilmetoxi o similar; o similares.

10 Ejemplos del "grupo cicloalcoxi de C3-8" de R¹⁰ o similares incluyen un grupo ciclopropiloxi, un grupo ciclobutiloxi, un grupo ciclopentiloxi, un grupo ciclohexiloxi, un grupo cicloheptiloxi o similares.

15 Ejemplos del "grupo cicloalquil C3-8-oxi sustituido" de R¹⁰ o similares incluyen un grupo clorociclohexiloxi, un grupo bromociclohexiloxi, un grupo 2-metilciclopropiloxi, un grupo 2,3-dimetilciclopropiloxi, un grupo espiro[2.2]penta-1-iloxi, un grupo 1-metil-espiro[2.2]penta-1-iloxi, un grupo 1-hidroximetil-espiro[2.2]penta-1-iloxi, un grupo 4,4-difluoro-espiro[2.2]penta-1-iloxi, un grupo biciclopropil-2-iloxi o similares.

20 Ejemplos del "grupo alquenil C2-6-oxi" de R¹⁰ o similares incluyen un grupo viniloxi, un grupo 1-propeniloxi, un grupo 2-propeniloxi, un grupo 1-buteniloxi, un grupo 2-buteniloxi, un grupo 3-buteniloxi, un grupo 1-metil-2-propeniloxi, un grupo 2-metil-2-propeniloxi, un grupo 1-penteniloxi, un grupo 2-penteniloxi, un grupo 1-metil-2-buteniloxi, un grupo 2-metil-2-buteniloxi, un grupo 3-metil-2-buteniloxi, un grupo 1-hexeniloxi, un grupo 2-hexeniloxi o similares.

25 Ejemplos del "grupo alquenil C2-6-oxi sustituido" de R¹⁰ o similares incluyen un grupo haloalquenil C2-6-oxi tal como un grupo 2-cloro-1-propeniloxi, un grupo 3,3-dicloro-2-propeniloxi, un grupo 2-fluoro-1-buteniloxi o similar; o similares.

30 Ejemplos del "grupo alquinil C2-6-oxi" de R¹⁰ o similares incluyen un grupo etiniloxi, un grupo 1-propiniloxi, un grupo 2-propiniloxi, un grupo 1-butiniloxi, un grupo 2-butiniloxi, un grupo 3-butiniloxi, un grupo 1-metil-2-propiniloxi, un grupo 2-metil-3-butiniloxi, un grupo 1-pentiniloxi, un grupo 2-pentiniloxi, un grupo 1-metil-2-butiniloxi, un grupo 2-metil-3-pentiniloxi, un grupo 1-hexiniloxi o similares.

35 Ejemplos del "grupo alquinil C2-6-oxi sustituido" de R¹⁰ o similares incluyen un grupo haloalquinil C2-6-oxi tal como un grupo 4,4-dicloro-1-butiniloxi, un grupo 4-fluoro-1-pentiniloxi, un grupo 5-bromo-2-pentiniloxi o similar; o similares.

Ejemplos del "grupo acilo de C1-7" de R¹⁰ o similares incluyen un grupo formilo, un grupo acetilo, un grupo propionilo, un grupo benzoilo o similares.

40 Ejemplos del "grupo acilo de C1-7 sustituido" de R¹⁰ o similares incluyen un grupo acilo de C1-7 sustituido con halógeno tal como un grupo cloroacetilo, un grupo trifluoroacetilo, un grupo tricloroacetilo, un grupo 4-clorobenzoilo o similar;

45 Ejemplos del "grupo alcoxi C1-6-carbonilo" de R¹⁰ o similares incluyen un grupo metoxicarbonilo, un grupo etoxicarbonilo, un grupo propoxicarbonilo, un grupo i-propoxicarbonilo o similares.

50 Ejemplos del "grupo alcoxi C1-6-carbonilo sustituido" de R¹⁰ o similares incluyen un grupo cicloalquil C3-8-alcoxi C1-6-carbonilo tal como un grupo ciclopropiletoxicarbonilo, un grupo ciclobutiletoxicarbonilo, un grupo ciclopentiletoxicarbonilo, un grupo ciclohexiletoxicarbonilo, un grupo 2-metilciclopropiletoxicarbonilo, un grupo 2,3-dimetilciclopropiletoxicarbonilo, un grupo 2-clorociclopropiletoxicarbonilo, un grupo 2-ciclopropiletoxicarbonilo o similar; un grupo haloalcoxi C1-6-carbonilo tal como un grupo fluorometoxicarbonilo, un grupo clorometoxicarbonilo, un grupo bromometoxicarbonilo, un grupo difluorometoxicarbonilo, un grupo diclorometoxicarbonilo, un grupo dibromometoxicarbonilo, un grupo trifluorometoxicarbonilo, un grupo triclorometoxicarbonilo, un grupo tribromometoxicarbonilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetoxicarbonilo, un grupo 2,2,2-tricloroetoxicarbonilo, un grupo pentafluoroetoxicarbonilo, un grupo 4-fluorobutoxicarbonilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropoxicarbonilo, un grupo 2,2,2-trifluoro-1-trifluorometiletoxicarbonilo, un grupo perfluorohexiloxicarbonilo o similar; un grupo aril C6-10-alquil C1-6-oxicarbonilo tal como un grupo benciloxicarbonilo, un grupo 1-feniletoxicarbonilo o similar; un grupo heterociclil-alcoxi C1-6-carbonilo tal como un grupo tetrahidrofuran-2-iletoxicarbonilo, un grupo pirazoliletoxicarbonilo, un grupo tiadiazoliletoxicarbonilo, un grupo piridiletoxicarbonilo, pirimidiniletoxicarbonilo, un grupo piridaziniletoxicarbonilo o similar;

60 Ejemplos del "grupo cicloalquil C3-8-oxicarbonilo" de R¹⁰ o similares incluyen un grupo ciclopropiloxicarbonilo, un grupo ciclobutoxicarbonilo o similares.

65 Ejemplos del "grupo alquenil C2-6-oxicarbonilo" de R¹⁰ o similares incluyen un grupo eteniloxicarbonilo, un grupo 2-propeniloxicarbonilo, un grupo 1-propeniloxicarbonilo o similares.

- Ejemplos del “grupo alquenil C2-6-oxicarbonilo sustituido” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo 1-metil-2-propeniloxicarbonilo, un grupo 2-metil-1-propeniloxicarbonilo o similares.
- 5 Ejemplos del “grupo alquiniil C2-6-oxicarbonilo” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo etiniloxicarbonilo, un grupo propargiloxicarbonilo, un grupo 2-butiniloxicarbonilo o similares.
- Ejemplos del “grupo alquiniil C2-6-oxicarbonilo sustituido” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo 1-metilpropargiloxicarbonilo o similares.
- 10 Ejemplos del “grupo aril C6-10-oxicarbonilo” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo feniloxicarbonilo, un grupo naftoxicarbonilo o similares.
- 15 Ejemplos del “grupo heterocicliloxicarbonilo” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo piridiloxicarbonilo, un grupo piridaziniloxicarbonilo o similares.
- Ejemplos del “grupo acil C1-7-oxi” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo formiloxi, un grupo acetiloxi, un grupo propioniloxi o similares.
- 20 Ejemplos del “grupo acil C1-7-oxi sustituido” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo halogeno-acil C1-7-oxi sustituido tal como un grupo cloroacetiloxi, un grupo trifluoroacetiloxi, un grupo tricloroacetiloxi, un grupo 4-clorobenzoiloxi; o similar; o similares.
- 25 Ejemplos del “grupo alcoxi C1-6-carboniloxi” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo metoxicarboniloxi, un grupo etoxicarboniloxi, un grupo i-propoxicarboniloxi o similares.
- Ejemplos del “grupo cicloalquil C3-8-oxicarboniloxi” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo ciclopropiloxicarboniloxi, un grupo ciclobutiloxicarboniloxi, un grupo ciclopentiloxicarboniloxi, un grupo ciclohexiloxicarboniloxi o similares.
- 30 Ejemplos del “grupo alquenil C2-6-oxicarboniloxi” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo viniloxicarboniloxi, un grupo 1-propeniloxicarboniloxi, un grupo 2-propeniloxicarboniloxi, un grupo 1-buteniloxicarboniloxi, un grupo 2-buteniloxicarboniloxi, un grupo 3-buteniloxicarboniloxi, un grupo 1-metil-2-propeniloxicarboniloxi o similares.
- 35 Ejemplos del “grupo alquiniil C2-6-oxicarboniloxi” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo etiniloxicarboniloxi, un grupo 1-propiniloxicarboniloxi, un grupo 2-propiniloxicarboniloxi, un grupo 1-butiniloxicarboniloxi, un grupo 2-butiniloxicarboniloxi, un grupo 3-butiniloxicarboniloxi o similares.
- Ejemplos del “grupo alquil C1-6-aminocarboniloxi” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo metilaminocarboniloxi, un grupo dimetilaminocarboniloxi, un grupo dietilaminocarboniloxi, un grupo i-propilaminocarboniloxi, un grupo i-butilaminocarboniloxi o similares.
- 40 Ejemplos del “grupo cicloalquil C3-8-aminocarboniloxi” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo ciclopropilaminocarboniloxi, un grupo ciclobutilaminocarboniloxi, un grupo ciclopentilaminocarboniloxi, un grupo ciclohexilaminocarboniloxi o similares.
- 45 Ejemplos del “grupo alquenil C2-6-aminocarboniloxi” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo vinilaminocarboniloxi, un grupo 1-propenilaminocarboniloxi, un grupo 2-propenilaminocarboniloxi, un grupo 1-butenilaminocarboniloxi o similares.
- 50 Ejemplos del “grupo alquiniil C2-6-aminocarboniloxi” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo etinilaminocarboniloxi, un grupo 1-propinilaminocarboniloxi, un grupo 2-propinilaminocarboniloxi, un grupo 1-butinilaminocarboniloxi o similares.
- 55 Ejemplos del “grupo aril C6-10-aminocarboniloxi” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo anilincarboniloxi, un grupo naftilaminocarboniloxi o similares.
- Ejemplos del “grupo heterociclilaminocarboniloxi” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo piridilaminocarboniloxi, un grupo piridazinilaminocarboniloxi o similares.
- 60 Ejemplos del “grupo aminooxi sustituido” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo alquil C1-6-aminooxi tal como un grupo metilaminooxi, un grupo etilaminooxi o similar; un grupo acil C1-7-aminooxi tal como un grupo formilaminooxi, un grupo acetilaminooxi o similar; o similares.
- 65 Ejemplos del “grupo alquiliden C1-6-aminooxi” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo metilidenaminooxi, un grupo etilidenaminooxi, un grupo n-propilidenaminooxi, un grupo i-propilidenaminooxi, un grupo n-butilidenaminooxi, un grupo i-butilidenaminooxi, un grupo s-butilidenaminooxi o similares.

Ejemplos del “grupo arilo de C6-10” de R¹⁰ o similares son los mismos que aquellos listados para los ejemplos de Cy¹ o similares.

- 5 Ejemplos del “grupo heterociclilo” de R¹⁰ o similares son los mismos que aquellos listados para los ejemplos de Cy¹ o similares.

Ejemplos del “grupo aril C6-10-oxi” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo fenoxi, un grupo naftoxi o similares.

- 10 Ejemplos del “grupo heterociclioxi” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo piridiloxi, un grupo piridaziniloxi o similares.

Ejemplos del “grupo sulfoniloxi sustituido” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo alquil C1-6-sulfoniloxi tal como un grupo metilsulfoniloxi, un grupo etilsulfoniloxi o similar; un grupo haloalquil C1-6-sulfoniloxi tal como un grupo trifluorometilsulfoniloxi, un grupo 2,2,2-trifluoroetilsulfoniloxi o similar; un grupo aril C6-10-sulfoniloxi tal como un grupo fenilsulfoniloxi o similar; o similares.

- 15 Ejemplos del “grupo alquil C1-6-amino” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo metilamino, un grupo dimetilamino, un grupo dietilamino, un grupo i-butilamino o similares.

Ejemplos del “grupo alquil C1-6-amino” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo metilamino, un grupo dimetilamino, un grupo dietilamino, un grupo i-butilamino o similares.

- 20 Ejemplos del “grupo cicloalquil C3-8-amino” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo ciclopropilamino, un grupo ciclobutilamino, un grupo ciclopentilamino, un grupo ciclohexilamino o similares.

Ejemplos del “grupo alquenal C2-6-amino” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo vinilamino, un grupo 1-propenilamino, un grupo 2-propenilamino, un grupo 1-butenilamino o similares.

- 25 Ejemplos del “grupo alquenal C2-6-amino” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo etnilamino, un grupo 1-propinilamino, un grupo 2-propinilamino, un grupo 1-butinilamino o similares.

Ejemplos del “grupo aril C6-10-amino” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo anilino, un grupo naftilamino o similares.

- 30 Ejemplos del “grupo heterocicliamino” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo piridilamino, un grupo piridazinilamino o similares.

Ejemplos del “grupo hidroxiamino sustituido” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo alcoxi C1-6-amino tal como un grupo metoxiamino, un grupo etoxiamino o similar; un grupo acil C1-7-oxiamino tal como un grupo acetoxiamino, un grupo propioniloxiamino o similar; o similares.

- 35 Ejemplos del “grupo hidroxiamino sustituido” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo alcoxi C1-6-amino tal como un grupo metoxiamino, un grupo etoxiamino o similar; un grupo acil C1-7-oxiamino tal como un grupo acetoxiamino, un grupo propioniloxiamino o similar; o similares.

Ejemplos del “grupo acil C1-7-amino” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo formilamino, un grupo acetilamino, un grupo propanoilamino, un grupo butirilamino, un grupo i-propilcarbonilamino, un grupo benzoilamino o similares.

- 40 Ejemplos del “grupo alcoxil C1-6-carbonilamino” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo metoxicarbonilamino, un grupo etoxicarbonilamino, un grupo n-propoxicarbonilamino, un grupo i-propoxicarbonilamino o similares.

Ejemplos del “grupo alquenal C2-6-oxicarbonilamino” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo vinilaminocarbonilamino, un grupo 1-propenilaminocarbonilamino, un grupo 2-propenilaminocarbonilamino, un grupo 1-butenilaminocarbonilamino o similares.

- 45 Ejemplos del “grupo alquenal C2-6-oxicarbonilamino” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo vinilaminocarbonilamino, un grupo 1-propenilaminocarbonilamino, un grupo 2-propenilaminocarbonilamino, un grupo 1-butenilaminocarbonilamino o similares.

Ejemplos del “grupo alquenal C2-6-oxicarbonilamino” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo etnilaminocarbonilamino, un grupo 1-propinilaminocarbonilamino, un grupo 2-propinilaminocarbonilamino, un grupo 1-butinilaminocarbonilamino o similares.

- 50 Ejemplos del “grupo alquenal C2-6-oxicarbonilamino” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo etnilaminocarbonilamino, un grupo 1-propinilaminocarbonilamino, un grupo 2-propinilaminocarbonilamino, un grupo 1-butinilaminocarbonilamino o similares.

Ejemplos del “grupo aril C6-10-oxicarbonilamino” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo anilincarbonilamino, un grupo naftilaminocarbonilamino o similares.

- 55 Ejemplos del “grupo heterociclioxicarbonilamino” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo piridilaminocarbonilamino, un grupo piridazinilaminocarbonilamino o similares.

Ejemplos del “grupo sulfonilamino sustituido” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo alquil C1-6-sulfonilamino tal como un grupo metilsulfonilamino, un grupo etilsulfonilamino o similar; un grupo haloalquil C1-6-sulfonilamino tal como un grupo trifluorometilsulfonilamino, un grupo 2,2,2-trifluoroetilsulfonilamino o similar; un grupo aril C6-10-sulfonilamino tal como un grupo fenilsulfonilamino o similar; o similares.

- 60 Ejemplos del “grupo sulfonilamino sustituido” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo alquil C1-6-sulfonilamino tal como un grupo metilsulfonilamino, un grupo etilsulfonilamino o similar; un grupo haloalquil C1-6-sulfonilamino tal como un grupo trifluorometilsulfonilamino, un grupo 2,2,2-trifluoroetilsulfonilamino o similar; un grupo aril C6-10-sulfonilamino tal como un grupo fenilsulfonilamino o similar; o similares.

Ejemplos del “grupo aminocarbonilo sustituido” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo dimetilaminocarbonilo, un grupo fenilaminocarbonilo, un grupo N-fenil-N-metilaminocarbonilo o similares.

- 65 Ejemplos del “grupo alquil C1-6-tio” de R¹⁰ o similares incluyen un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo n-

propiltio, un grupo i-propiltio, un grupo n-butiltio, un grupo i-butiltio, un grupo s-butiltio, un grupo t-butiltio o similares.

Ejemplos del "grupo cicloalquil C3-8-tio" de R^{10} o similares incluyen un grupo ciclopropiltio, un grupo ciclobutiltio, un grupo ciclopentiltio, un grupo ciclohexiltio, un grupo cicloheptiltio o similares.

5 Ejemplos del "grupo alquenil C2-6-tio" de R^{10} o similares incluyen un grupo viniltio, un grupo 1-propeniltio, un grupo 2-propeniltio, un grupo 1-buteniltio, un grupo 2-buteniltio, un grupo 3-buteniltio o similares.

10 Ejemplos de "alquinil C2-6-tio" de R^{10} o similares incluyen un grupo etiniltio, un grupo 1-propiniltio, un grupo 2-propiniltio, un grupo 1-butiniltio, un grupo 2-butiniltio, un grupo 3-butiniltio o similares.

Ejemplos del "grupo aril C6-10-tio" de R^{10} o similares incluyen un grupo feniltio, un grupo naftiltio o similares.

15 Ejemplos del "grupo heterociciltio" de R^{10} o similares incluyen un grupo piridiltio, un grupo piridaziniltio o similares.

Ejemplos del "grupo (alquil C1-6)tiocarbonilo" de R^{10} o similares incluyen un grupo metil(tiocarbonilo), un grupo etil(tiocarbonilo), un grupo n-propil(tiocarbonilo), un grupo i-propil(tiocarbonilo), un grupo n-butil(tiocarbonilo), un grupo i-butil(tiocarbonilo), un grupo s-butil(tiocarbonilo), un grupo t-butil(tiocarbonilo) o similares.

20 Ejemplos del "grupo (alcoxi C1-6)tiocarbonilo" de R^{10} o similares incluyen un grupo metoxi(tiocarbonilo), un grupo etoxi(tiocarbonilo), un grupo n-propoxi(tiocarbonilo), un grupo i-propoxi(tiocarbonilo), un grupo n-butoxi(tiocarbonilo), un grupo i-butoxi(tiocarbonilo), un grupo s-butoxi(tiocarbonilo), un grupo t-butoxi(tiocarbonilo) o similares.

25 Ejemplos del "grupo (alquil C1-6-tio)carbonilo" de R^{10} o similares incluyen un grupo (metiltio)carbonilo, un grupo (etiltiltio)carbonilo, un grupo (n-propiltio)carbonilo, un grupo (i-propiltio)carbonilo, un grupo (n-butiltio)carbonilo, un grupo (i-butiltio)carbonilo, un grupo (s-butiltio)carbonilo, un grupo (t-butiltio)carbonilo o similares.

30 Ejemplos del "grupo (alquil C1-6-tio)tiocarbonilo" de R^{10} o similares incluyen un grupo (metiltio)tiocarbonilo, un grupo (etiltiltio)tiocarbonilo, un grupo (n-propiltio)tiocarbonilo, un grupo (i-propiltio)tiocarbonilo, un grupo (n-butiltio)tiocarbonilo, un grupo (i-butiltio)tiocarbonilo, un grupo (s-butiltio)tiocarbonilo, un grupo (t-butiltio)tiocarbonilo o similares.

35 Ejemplos del "grupo sulfinilo sustituido" de R^{10} o similares incluyen un grupo alquil C1-6-sulfinilo tal como un grupo metilsulfinilo, un grupo etilsulfinilo o similar; un grupo haloalquil C1-6-sulfinilo tal como un grupo trifluorometilsulfinilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilsulfinilo o similar; un grupo aril C6-10-sulfinilo tal como un grupo fenilsulfinilo o similar; o similares.

40 Ejemplos del "grupo sulfonilo sustituido" de R^{10} o similares incluyen un grupo alquil C1-6-sulfonilo tal como a metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo o similar; un grupo haloalquil C1-6-sulfonilo tal como un grupo trifluorometilsulfonilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo o similar; un grupo aril C6-10-sulfonilo tal como un grupo fenilsulfonilo o similar; un grupo alcoxi C1-6-sulfonilo tal como un grupo metoxisulfonilo, un grupo etoxisulfonilo o similar; o similares.

45 Ejemplos del "grupo sililo trisustituido con alquilo de C1-6" de R^{10} o similares incluyen un grupo trimetilsililo, un grupo trietilsililo, un grupo t-butildimetilsililo o similares.

Ejemplos del "grupo sililo trisustituido con arilo de C6-10" de R^{10} o similares incluyen un grupo trifenilsililo o similares.

50 Ejemplos de "átomo de halógeno" de R^{10} o similares incluyen un átomo de cloro, átomo de bromo, átomo de flúor, átomo de yodo o similar.

55 R^{10} y R^{11} de Cy^1 puede formar independientemente un anillo, o se pueden enlazar juntos para formar un anillo, o se pueden enlazar con los átomos que constituyen Cy^1 para formar un anillo; R^{20} y R^{21} de Cy^2 puede formar independientemente un anillo, o se pueden enlazar juntos para formar un anillo, o se pueden enlazar con los átomos que constituyen Cy^2 para formar un anillo.

60 Los ejemplos del anillo que se puede formar incluyen un anillo hidrocarbonado aromático tal como un anillo bencénico o similar; un anillo cicloalquénico de C5-7 tal como un anillo ciclopenténico, ciclohexénico, ciclohepténico, o similar; un heteroanillo aromático de 5 a 7 miembros, tal como un anillo de furano, un anillo de tiofeno, un anillo de pirrol, un anillo de imidazol, un anillo de pirazol, un anillo de tiazol, un anillo de oxazol, un anillo de isoxazol, un anillo de piridina, un anillo de pirazina, un anillo de pirimidina, un anillo de piridazina, un anillo de azepina, un anillo de diazepina, o similar; un heteroanillo de 5 a 7 miembros insaturado, tal como un anillo de dihidro-2H-pirano, dihidro-2H-tiopirano, un anillo de tetrahidropiridina, o similar; o similares.

65 Estos anillos pueden tener sustituyentes en los anillos.

Además, R^{10} , m , R^{11} , n y R^{20} de fórmula (II) son los mismos como se definen previamente en la fórmula (I). En la fórmula (II), p' representa el número de R^{20} y representa un número entero de 0 a 4. Cuando p' es 2 o más, los R^{20} pueden ser iguales o diferentes. En la fórmula (II), A representa un grupo alqueno de C3-6 no sustituido o sustituido, un grupo alquénilo de C3-6 no sustituido o sustituido, un grupo representado por la fórmula: $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$, un grupo representado por la fórmula: $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$, un grupo representado por la fórmula: $-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$, o un grupo representado por la fórmula: $-\text{CH}_2\text{NR}^6\text{CH}_2-$ (con la condición de que R^6 represente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1-6 no sustituido o sustituido, un grupo acilo de C1-7 no sustituido o sustituido, o un grupo alcoxi C1-6-carbonilo no sustituido o sustituido).

[Sal de compuesto de amina cíclico]

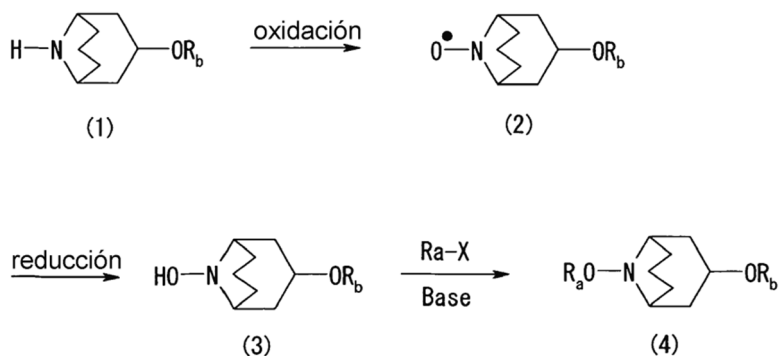
No hay limitaciones particulares en las sales del compuesto de amina cíclico de la presente invención, con tal de que sea una sal agrícola y hortícolamente aceptable. Los ejemplos de la sal incluyen sales de ácidos orgánicos tales como ácido clorhídrico o ácido sulfúrico; sales de ácidos orgánicos tales como ácido acético o ácido láctico; sales de metales alcalinos tales como litio, sodio o potasio; sales de metales alcalino-térreos, tales como calcio o magnesio; sales de metales de transición, tales como hierro o cobre; y sales de bases orgánicas tales como amoníaco, trietilamina, tributilamina, piridina o hidrazina. La sal de compuesto de amina cíclico de la presente invención se puede producir mediante un método bien conocido usando el compuesto de amina cíclico representado por la fórmula (I) o (II).

[Método de producción]

No hay limitaciones particulares en el método de producción del compuesto de amina cíclico o sal del mismo.

En primer lugar, se explicará un método de producción de un compuesto de hidroxilamina de la presente invención, en el que Y es un átomo de oxígeno. Cuando Y es un átomo de oxígeno, es preferible un método de producción que pasa a través de un compuesto representado por la siguiente fórmula (3).

[Fórmula química 10]



En primer lugar, se prepara un compuesto de amina secundaria representado por la fórmula (1) (en lo sucesivo, se puede denominar como "compuesto (1)"). Entonces se puede sintetizar un compuesto aminoxílico representado por la fórmula (2) (en lo sucesivo aquí, se puede denominar como "compuesto (2)") mediante la oxidación del compuesto (1) con un agente oxidante adecuado. Los ejemplos específicos del método de reacción de oxidación incluyen un método en el que se permite que un agente oxidante tal como peróxido de hidrógeno, hipoclorito sódico o un agente oxidante orgánico actúe en un disolvente adecuado tal como un alcohol anhidro o hidratado, tal como metanol, etanol, propanol o isopropanol, un éter tal como dioxano o tetrahydrofurano (THF) o acetonitrilo, y un método en el que se permite actuar un complejo de volframato-peróxido de hidrógeno urea. Además, otro ejemplo de un método que se puede usar incluye el soplado de un gas que contiene oxígeno u oxígeno activo, tal como ozono, en la mezcla de reacción.

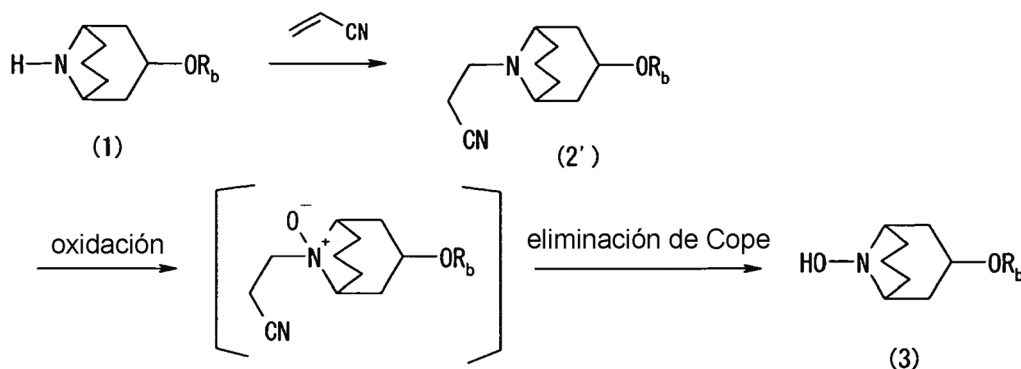
A continuación, el grupo aminoxílico se convierte en un grupo hidroxiamino reduciendo el compuesto (2) en condiciones adecuadas. Mediante esta reacción de reducción se forma un compuesto de hidroxilamina representado por la fórmula (3) (en lo sucesivo, se puede denominar como "compuesto (3)").

Tras la reacción de reducción, un haluro de heterociclilo se hace reaccionar con el compuesto (3) en presencia de una base. Como resultado, se puede obtener un compuesto heterocicliloxilamínico representado por la fórmula (4). Esta reacción se describe, por ejemplo, en la patente US nº 5.286.865.

Adicionalmente, en las fórmulas (1) a (4) mencionadas anteriormente, R_b representa un grupo fenilo sustituido, R_a representa un grupo heterociclilo sustituido, y X representa un átomo de halógeno.

Además, el compuesto (3) también se puede obtener, por ejemplo, mediante el método de producción indicado a continuación.

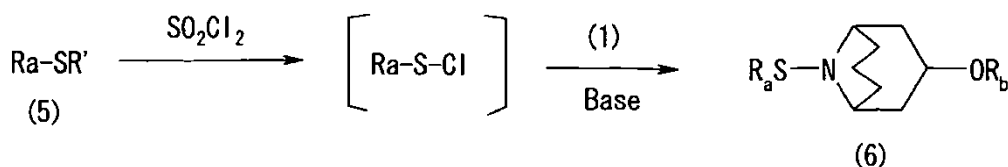
[Fórmula química 11]



Un compuesto alquilamínico representado por la fórmula (2') (en lo sucesivo, se puede denominar como "compuesto (2')") se obtiene N-alkilando el compuesto (1) mencionado anteriormente con acrilonitrilo. A continuación, el compuesto (3) se puede obtener oxidando con un agente oxidante adecuado para obtener una forma de N-óxido en el sistema de reacción, y sometiendo entonces esta a una reacción de eliminación de Cope. Esta reacción se describe, por ejemplo, en Tetrahedron Letters, 48 (2007), p. 1683-1686.

Por otro lado, un compuesto de la presente invención, en el que Y es un átomo de azufre, se puede producir mediante el siguiente método de producción.

[Fórmula química 12]



En primer lugar, se prepara un compuesto sulfenílico representado por la fórmula (5) (en lo sucesivo, se puede denominar como "compuesto (5)") (en la fórmula, R^1 representa un átomo de hidrógeno o un grupo bencilo). Después, se añade cloruro de sulfurilo y se hace reaccionar con el compuesto (5) para obtener un compuesto de cloruro de sulfenilo, seguido de la reacción con el compuesto (1) en presencia de una base para obtener un compuesto heterociclilitioxamínico representado por la fórmula (6). El método de producción del compuesto de cloruro de sulfenilo se describe en Synthesis 1994; volumen 1994 (1): 21-22, o similar.

[Compuesto de hidroxiamina]

El compuesto de hidroxiamina según la presente invención es un compuesto representado por la fórmula (III). Además, una sal del compuesto de hidroxiamina según la presente invención es una sal de un compuesto representado por la fórmula (III). Un compuesto representado por la fórmula (III) o una sal del mismo es preferible como un intermedio de producción de un compuesto representado por la fórmula (I) o fórmula (II) o una sal del mismo.

En la fórmula (III), Cy^1 , R^{10} , R^{11} , m, n, R^{1a} , R^{1b} , R^{2a} , R^{2b} , R^{3a} , R^{3b} , R^{4a} , R^{4b} y R^{5a} son los mismos como se definen previamente en la fórmula (I).

En la fórmula (III), R^{1a} y R^{2a} , o R^{3a} y R^{4a} se enlazan juntos para formar un grupo alqueno de C3-6 no sustituido o sustituido, un grupo alquénico de C3-6 no sustituido o sustituido, un grupo representado por la fórmula: $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$, un grupo representado por la fórmula: $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$, un grupo representado por la fórmula: $-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$, o un grupo representado por la fórmula: $-\text{CH}_2\text{NR}^6\text{CH}_2-$ (con la condición de que R^6 represente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1-6 no sustituido o sustituido, un grupo acilo de C1-7 no sustituido o sustituido, o un grupo alcoxi C1-6-carbonilo no sustituido o sustituido). Ejemplos de estos grupos orgánicos divalentes son los mismos como se definen previamente en la fórmula (I).

En la fórmula (III), Cy¹ es preferiblemente un grupo fenilo, un grupo pirazolilo, un grupo tiadiazolilo, un grupo piridilo, un grupo pirimidinilo o un grupo piridazinilo.

5 En la fórmula (III), R¹⁰ representa preferiblemente un grupo alquilo de C1-6, un grupo alcoxi C1-6-alquilo de C1-6, un grupo alcoxi C1-6-alcoxi C1-6-alquilo de C1-6, un grupo alqueno de C2-6, un grupo hidroxi, un grupo alcoxi de C1-6, un grupo haloalcoxi de C1-6, un grupo cicloalcoxi de C3-8, un grupo alquenoil C2-6-oxi, un grupo haloalquenoil C2-6-oxi, un grupo alquinoil C2-6-oxi, un grupo haloalquinoil C2-6-oxi, un grupo alcoxi C1-6-alcoxi de C1-6, un grupo cicloalquil C3-8-alcoxi de C1-6, un grupo ciano-alcoxi de C1-6, un grupo acil C1-7-alcoxi de C1-6, un grupo hidroxi-alcoxi de C1-6, un grupo acil C1-7-oxi, un grupo alcoxi C1-6-carbonilo, un grupo alquenoil C2-6-oxicarbonilo, un grupo alquinoil C2-6-oxicarbonilo, un grupo alcoxi C1-6-carbonilo, un grupo alquil C1-6-aminocarbonilo, un grupo arilo de C6-10, un grupo heterociclilo, un grupo haloalquil C1-6-sulfonilo, un grupo alquilideno C1-6-aminooxi, un grupo alcoxi C1-6-carbonilamino, un grupo aralquilo de C7-11 no sustituido o sustituido, un grupo aralquil C7-11-oxi no sustituido o sustituido, un grupo alquil C1-6-tio, o un grupo nitro.

15 En la fórmula (III), R¹¹ representa preferiblemente un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo pentafluorosulfanilo, un grupo haloalquilo de C1-6, un grupo haloalqueno de C2-6, o un grupo haloalquino de C2-6.

20 No hay limitaciones particulares sobre la sal del compuesto de hidroxiamina según la presente invención, con la condición de que no inhiba la reacción con el haluro de heterociclilo en presencia de una base. Los ejemplos de las sales incluyen sales de metales alcalinos tales como sales de litio, sales de sodio o sales de potasio. Una sal del compuesto de hidroxiamina según la presente invención se puede obtener mediante un método bien conocido usando un compuesto de hidroxiamina representado por la fórmula (III).

25 Puesto que el compuesto de amina cíclico de la presente invención, o sal del mismo, demuestra acción insecticida sobre insectos adultos, insectos inmaduros, larvas, huevos de insectos y similares, se puede usar para controlar organismos dañinos tales como insectos dañinos presentes en cultivos agrícolas, ácaros, garrapatas, insectos sanitariamente dañinos, insectos dañinos para el grano almacenado, insectos dañinos para la ropa e insectos dañinos para la casa.

30 Los ejemplos de los insectos incluyen los siguientes

35 plagas de lepidópteros tales como, por ejemplo, *Spodoptera litura*, *Mamestra brassicae*, *agrotis ipsilon*, orugas verdes, *Autographa nigrisigna*, *Plutella xylostella*, *Adoxophyes honmai*, *Homona magnanima*, *Carposina sasakii*, *Grapholita molesta*, *Phyllocnistis citrella*, *Caloptilia theivora*, *Phyllonorycter ringoniella*, *Lymantria dispar*, *Euproctis pseudoconspersa*, *Chilo suppressalis*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Ostrinia nubilalis*, *Hyphantria cunea*, *Cadra cautella*, género *Heliothis*, género *Helicoverpa*, género *Agrothis*, *Tinea translucens*, *Cydia pomonella*, y *Pectinophora gossypiella*;

40 plagas de hemípteros tales como, por ejemplo, *Myzus persicae*, *Aphis gossypii*, *Lipaphis erysimi*, *Rhopalosiphum padi*, *Riptortus clavatus*, *Nezara antennata*, *Unaspis yanonensis*, *Pseudococcus comstocki*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Bemisia tabaci*, *Bemisia argentifolii*, *Psylla pyrisuga*, *Stephanitis nashi*, *Nilaparvata lugens*, *Laodelphax stratella*, *Sogatella furcifera*, y *Nephotettix cincticeps*;

45 plagas de coleópteros tales como, por ejemplo, *Phyllotreta striolata*, *Aulacophora femoralis*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Sitophilus zeamais*, *Callosobruchus chinensis*, *Popillia japonica*, *Anomala rufocuprea*, género *Diabrotica*, *Lasioderma serricorne*, *Lyctus brunneus*, *Monoctonus alternatus*, *Anoplophora malasiaca*, género *Agriotes*, *Epilachna vigintioctopunctata*, *Tenebroides mauritanicus*, y *Anthonomus grandis*;

50 plagas de dípteros tales como, por ejemplo, *Musca domestica*, *Calliphora lata*, *Boettcherisca peregrine*, *Zeugodacus cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Delia platura*, *Agromyza oryzae*, *Drosophila melanogaster*, *Stomoxys calcitrans*, *Culex tritaeniorhynchus*, *Aedes aegypti*, y *Anopheles sinensis*;

55 plagas de tisanópteros tales como, por ejemplo, *Thrips palmi*, y *Scirtothrips dorsalis*;

plagas de himenópteros tales como, por ejemplo, *Monomorium pharaonis*, *Vespa simillima xanthoptera*, y *Athalia rosae ruficomis*;

60 plagas de ortópteros tales como, por ejemplo, *Locusta migratoria*, *Blattella germanica*, *Periplaneta americana*, y *Periplaneta fuliginosa*;

plagas de isópteros tales como, por ejemplo, *Coptotermes formosanus* y *Reticulitermes speratus*;

65 plagas de sifonápteros tales como, por ejemplo, *Pulex irritans* y *Ctenocephalides felis*;

plagas de fitópteros tales como, por ejemplo, *Pediculus humanus*;

nematodos parasitarios de plantas tales como *Meloidogyne incognita*, *Pratylenchus* spp., *Heterodera glycines*, *Aphelenchoides besseyi*, y *Bursaphelenchus xylophilus*; y acarina.

5 Entre estos insectos, el compuesto de amina cíclico de la presente invención o sal del mismo es útil como un ingrediente activo de un acaricida, puesto que es particularmente eficaz en el control de ácaros.

Los ejemplos de ácaros a los que se busca controlar se indican a continuación:

10 ácaros que pertenecen a la familia de Tetranychidae, incluyendo *Brevipalpus lewisi*, *Brevipalpus obovatus*, *Brevipalpus phoenicis*, *Bryobia praetiosa*, *Bryobia rubrioculus*, *Dolichotetranychus floridanus*, *Eotetranychus boreus*, *Eotetranychus geniculatus*, *Eotetranychus pruni*, *Eotetranychus sexmanaculatus*, *Eotetranychus smithi*, *Eotetranychus uncatatus*, *Oligonychus hondoensis*, *Oligonychus ilicis*, *Oligonychus karamatus*, *Oligonychus shinkajii*, *Panonychus citri*, *Panonychus mori*, *Panonychus ulmi*, *Tenuipalpus zhizhilashviliae*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus urticae*, *Tetranychus viennensis* o *Tuckerella pavoniformis*;

20 ácaros que pertenecen a la familia de Eriophyidae, tales como *Acaphylla theavagrans*, *Aceria paradianthi*, *Aceria tulipae*, *Aculops lycopersici*, *Aculops pelekassi*, *Aculus fockeui*, *Aculus schlechtendali*, *Calacarus carinatus*, *Calepitrimerus vitis*, *Colomerus vitis*, *Epitrimerus pyri*, *Eriophes kuko* o *Eriophyes chibaensis*;

25 ácaros que pertenecen a la familia de Astigmata, tales como *Acarus siro*, *Aleuroglyphus ovatus*, *Carpoglyphus lactis*, *Lardoglyphus konoii*, *Rhizoglyphus echinopus*, *Rhizoglyphus robini*, *Tyrophagus putrescentiae* o *Tyrophagus similis*;

30 ácaros que pertenecen a la familia de Tarsonemidae, tales como *Phytonemus pallidus*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Tarsonemus bilobatus* o *Tarsonemus waitei*;

35 ácaros que pertenecen a la familia de Eupodidae, tales como *Penthaleus erythrocephalus* o *Penthaleus major*;

40 ácaros que pertenecen a la familia de Ixodidae, tales como *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis japonica*, *Boophilus microplus*, *Dermacentor reticulatus*, *Dermacentor taiwanensis*, *Haemaphysalis flava*, *Ixodes ovatus*, *Ixodes persulcatus*, *Dermacentor reticulatus* o similares.

Además, los ácaros resistentes que tienen resistencias a acaricidas conocidos convencionalmente también están incluidos en los ejemplos anteriores de ácaros.

45 El compuesto de amina cíclico de la presente invención o sal del mismo provoca poco daño químico, demuestra niveles bajos de toxicidad en peces y animales de sangre caliente, y es un compuesto que tiene un grado particularmente elevado de seguridad.

[Acaricida]

45 El acaricida de la presente invención contiene como ingrediente activo del mismo al menos un tipo seleccionado del grupo que consiste en un compuesto de amina cíclico representado por la fórmula (I) o fórmula (II) o sal del mismo. En el acaricida de la presente invención, un tipo del compuesto de amina cíclico representado por la fórmula (I) o fórmula (II) o sal del mismo puede estar contenido solo, o dos o más tipos pueden estar contenidos en combinación.

50 Además, aunque el acaricida de la presente invención puede contener solamente el compuesto de amina cíclico representado por la fórmula (I) o fórmula (II) de la presente invención, o una sal del mismo, también puede contener un vehículo tal como un vehículo sólido, un vehículo líquido o un vehículo gaseoso. Además, el acaricida de la presente invención puede tener el compuesto de amina cíclico representado por la fórmula (I) o fórmula (II), o una sal del mismo, impregnado en un material base tal como un plato cerámico poroso o un tejido no tejido. Además, se puede añadir, según sea necesario, un tensioactivo u otro auxiliar.

55 El acaricida según la presente invención se puede formular en una forma capaz de ser adoptada típicamente por sustancias químicas agrícolas, a saber, en forma de un polvo dispersable en agua, gránulos, polvo, emulsión, polvo soluble en agua, suspensión, polvo granular dispersable en agua, preparación fluible, aerosol, niebla, agente de transpiración de calor, fumigante, cebo de veneno, o microcápsulas.

60 Los ejemplos de aditivos y vehículos usados como se formula una preparación sólida incluyen polvos vegetales tales como polvo o harina de haba de soja, polvos minerales finos tales como tierra de diatomeas, apatita, yeso, talco, ventonita, pirofilita o arcilla; y compuestos orgánicos e inorgánicos tales como benzoato de sodio, urea o sulfato de sodio.

65 Los ejemplos de disolventes usados cuando se formulan preparaciones líquidas incluyen fracciones del petróleo

tales como queroseno, xileno o nafta disolvente; ciclohexano, ciclohexanona, dimetilformamida, dimetilsulfóxido, alcoholes, acetona, metil isobutil cetona, aceites minerales, aceites vegetales y agua.

5 Los ejemplos de vehículos gaseosos usados cuando se formulan propelentes incluyen gas butano, LPG, éter dimetilico y dióxido de carbono gaseoso.

10 Los ejemplos de materiales base del cebo de veneno incluyen componentes del cebo tales como polvo de grano, aceite vegetal, azúcar o celulosa microcristalina, antioxidantes tales como dimetilhidroxitolueno o ácido nordihidroguayarético, conservantes tales como ácido deshidroacético, agentes que previenen la ingesta accidental para niños pequeños y mascotas tales como polvo de pimienta de Cayena, fragancias que atraen a insectos, tales como fragancia de queso o fragancia de cebolla.

15 Se puede añadir un tensioactivo a fin de obtener una forma uniforme y estable durante la formulación. Los ejemplos de tensioactivos incluyen tensioactivos no iónicos tales como polioxietilen alquil éteres, ésteres polioxietilénicos de ácidos grasos superiores, ésteres de ácidos grasos superiores con polioxietilen sorbitán, o polioxietilen triesteril fenil éteres, ésteres de sulfato de polioxietilen alquil fenil éteres, alquilnaftalenosulfonatos, policarboxilatos, lignosulfonatos, condensados formaldehídicos de alquilnaftalenosulfonatos, y copolímeros de isobutileno-anhídrido maleico.

20 En el caso de usar el acaricida de la presente invención en aplicaciones agrícolas, el contenido del compuesto de amina cíclico de la presente invención o sal del mismo en una preparación es preferiblemente 0,01% en peso a 90% en peso, y más preferiblemente 0,05% en peso a 85% en peso.

25 Un acaricida para uso agrícola que se suministra en forma de un polvo dispersable en agua, emulsión, suspensión, preparación fluible, polvo soluble en agua o polvo granular dispersable en agua se puede preparar en forma de una disolución, suspensión o emulsión diluyendo con agua hasta una concentración prescrita, y pulverizando entonces sobre plantas o el suelo. Además, un acaricida para uso agrícola que se suministra en forma de un polvo o gránulos se puede pulverizar directamente sobre plantas o el suelo.

30 Además, un acaricida para la prevención epidémica que se suministra en forma de una emulsión, polvo dispersable en agua o preparación fluible y similar se puede aplicar diluyendo con agua hasta una concentración prescrita. Además, se puede usar directamente un acaricida para prevención epidémica que se suministra en forma de una disolución oleosa, aerosol, niebla, cebo de veneno o lámina acaricida.

35 En el caso de usar el acaricida de la presente invención para controlar ácaros parásitos de animales de ganado tales como vacas o cerdos y mascotas tales como perros o gatos, el compuesto de amina cíclico de la presente invención se puede usar a una relación de 0,01 mg a 1000 mg por 1 kg de animal hospedante.

40 Un acaricida para controlar ácaros parasitarios de animales se puede aplicar usando un método veterinario conocido. Los ejemplos de tales métodos incluyen métodos en los que el acaricida se administra a un animal mediante un comprimido, cápsula, líquido de inmersión, aditivo alimentario, supositorio o inyección (inyección intramuscular, subcutánea, intravenosa o intraabdominal) cuando se administra con el fin de un control sistémico, métodos en los que una preparación líquida oleosa o acuosa se administra pulverizando, vertiendo en o mediante unción dorsal puntual cuando se administra con el fin de un control no sistémico, y métodos en los que el acaricida se mezcla con una resina y el producto amasado se moldea en una forma adecuada tal como un collar o etiqueta para la oreja, que entonces se pega al animal.

50 El acaricida de la presente invención se puede mezclar o usar en combinación con fungicidas, otros insecticidas o acaricidas, nematocidas, plaguicidas del suelo, reguladores de las plantas, sinérgicos, fertilizantes, mejoradores del suelo o piensos para animales, y similares.

55 Lo siguiente da ejemplos típicos de fungicidas, otros insecticidas o acaricidas, nematocidas, plaguicidas del suelo y reguladores de las plantas, capaces de ser usados mediante mezclamiento con el compuesto de la presente invención.

Fungicidas:

- 1) a base de bencimidazol: benomilo, carbendazim, fuberidazol, tiabendazol, tiofanato de metilo o similar;
- 60 2) fungicidas a base de dicarboxiimida: clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolina o similar;
- 3) fungicidas DMI: imdazalilo, oxpoconazol, pefurazoato, procloraz, triflumizol, triforina, pirifenox, fenarimol, nuarimol, azaconazol, bitertanol, bromconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipuconazol, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, etaconazol, furconazol-cis o similar;
- 65

ES 2 555 163 T3

- 4) a base de fenilamida: benalaxilo, furalaxilo, metalaxilo, metalaxilo-M, oxadixilo, ofurace o similar;
- 5) a base de aminas: aldimorf, dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidina, piperalina, espiroxamina o similar;
- 6) a base de fosfotiolato: EDDP, iprobenfós, pirazofós o similar;
- 7) a base de ditiolano: isoprotiolano o similar;
- 8) a base de carboxamida: benodanilo, boscalida, carboxina, fenfurano, flutolanilo, furametpir, mepronilo, oxicarboxina, pentiopirad, tfluzamida o similar;
- 9) a base de hidroxí(2-amino)pirimidina: bupirimato, dimetirimol, etirimol o similar;
- 10) fungicidas AP (a base de anilinopirimidinas): ciprodinilo, mepanipirim, pirimetanilo o similar;
- 11) a base de N-fenilcarbamato: dietofencarb o similar;
- 12) fungicidas QoI (a base de inhibidores de Qo): azoxistrobina, picoxistrobina, piraclostrobina, kresoxim-metilo, trifloxistrobina, dimoxistrobina, metominostrobin, orisastrobina, famoxadona, fluoxastrobina, fenamidona, metominofeno o similar;
- 13) PP (a base de fenilpirrol): fempiconilo, fludioxonilo o similar;
- 14) a base de quinolina: quinoxifeno o similar;
- 15) fungicidas AH (a base de hidrocarburos aromáticos): bifenilo, cloroneb, diclorano, quintozeno, tecnazeno, tolclofós-metilo o similar;
- 16) a base de MBI-R: ftalida, piroquilona, triciclazol o similar;
- 17) a base de MBI-D: carpropamida, diclocimet, fenoxanilo o similar;
- 18) agentes SBI: fenhexamida, piributicarb, terbinafina o similar;
- 19) fenilureas: pencicurón o similar;
- 20) fungicidas Qil (inhibidores de Qi): ciazofamida o similar;
- 21) a base de benzamida: zoxamida o similar;
- 22) a base de enopiranurona: blastidina, mildiomicina o similar;
- 23) a base de hexopiranosilo: kasugamicina o similar;
- 24) a base de glucopiranosilo: estreptomycin, validamicina o similar;
- 25) a base de cianoacetoamida: cimoxanilo o similar;
- 26) a base de carbamato: idocarb, propamocarb, protiocarb, policarbamato o similar;
- 27) agentes de desacoplamiento: binapacril, dinocap, ferimzona, fluazinam o similar;
- 28) compuestos de estaño orgánico: acetato de trifenilestaño, cloruro de trifenilestaño, hidróxido de trifenilestaño o similar;
- 29) ésteres de fosfato: ácido fosfónico, tolclofós-metilo, fosetilo o similar;
- 30) a base de ftalamida: tecloftalam o similar;
- 31) a base de benzotriazina: triazóxido o similar;
- 32) a base de bencenosulfonamida: flusulfamida o similar;
- 33) piridazinonas: diclomezina o similar;

- 34) fungicida CAA a base de (amida carboxílica): dimetomorf, flumorf, bentiavalicarb, iprovalicarb, mandipropamida o similar;
- 5 35) tetraciclinas: oxitetraciclina o similar;
- 36) a base de tiocarbamato: metasulfocarb o similar; y
- 10 37) otros compuestos: etridiazol, polioxinas, ácido oxolínico, hidroxiisoxazol, octinolina, siltiofam, diflumetorim, acibenzolar-s-metilo, probenazol, tiadinilo, etaboxam, ciflufenamida, proquinazida, metrafenona, fluopicolida, hidróxido cúprico, cobre orgánico, azufre, ferbam, manzeb, maneb, metiram, propineb, tiuram, zineb, ziram, captano, captafol, folpet, clorotalonilo, diclofluanida, toliifluanida, dodina, guazatina, acetato de iminoctadina, dodecibencenosulfonato de iminoctadina, anilazina, ditionón, cloropicrina, dazomet, sal sódica de metam, quinometionat, ciprofuram, siltiofam, agrobacterium, fluoroimida.

15 Los ejemplos de insecticidas, acaricidas, nematocidas y plaguicidas del suelo incluyen:

- 20 1) a base de (tio)fosfatos orgánicos: tales como acefato, azametifós, azinfós-metilo, clorpirifós, clorpirifós-metilo, clorfenvinfós, diazinón, diclorvós, dicrotofós, dimetoato, disulfotón, etiona, EPN, fenamifós, fenitrothiona, fentiona, isoxationa, malationa, metamidofós, metidationa, metil parationa, mevinfós, monocrotofós, oxidemetón-metilo, paraoxon, parationa, fentoato, fosadona, fosmet, fosfamidona, forato, foxim, pirimifós-metilo, profenofós, protiofós, sulprofós, tetraclorvinfós, terbufós, triazofós, triclorfona, fostiazato, fosfocarb, cadusafós, disulfotón, demetón-s-metilo, BRP, CYAP, etoprofós, quinalfós, dimetilvinfós, vamidotona, piraclofós, o similar;
- 25 2) a base de carbamatos: alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, carbarilo, carbofurano, carbosulfán, fenoxicarb, fenotiocarb, metiocarb, metomilo, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, triazamato, etiofencarb, fenobucarb, MIPC, MPMC, MTMC, piridafentiona, furatiocarb, XMC o similar;
- 30 3) a base de piretroides: aletrina, bifentrina, ciflutrina, cihalotrina, cifenotrina, cipermetrina, alfacipermetrina, betacipermetrina, zetacipermetrina, deltametrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, imiprotrina, lambdacialotrina, permetrina, praletrina, piretrina I y II, resmetrina, silafluofeno, tau-fluvalinato, teflutrina, tetrametrina, tralometrina, transflutrina, proflutrina, dimeflutrina, acrinatrina, cicloprotrina, halfenprox, flucitrinato o similar;
- 35 4) reguladores del crecimiento:
- a) inhibidores de la síntesis de quitina: clorfluazurón, diflubenzurón, fluciclozurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, teflubenzurón, triflumurón, bistriflurón, nobifumurón, buprofezina, diofenolano, hexitiazox, etoxazol, clofentezina o similar;
- 40 b) antagonistas de ecdisona: halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida, azadiractina, cromafenozida o similar;
- 45 c) sustancias similares a hormonas juveniles: piriproxifeno, metopreno o fenoxicarb;
- d) inhibidores de la biosíntesis de lípidos: espiroclifeno, espiromesifeno, espirotetramat o similar;
- 50 5) compuestos agonistas/antagonistas de nicotina: acetamiprida, clotianidina, dinotefurano, imidacloprida, nitenpiram, tiacloprida, tiametoxam o similar;
- 6) compuestos antagonistas de GABA: acetoclor, endosulfano, etiprol, fipronilo, vaniliprol, pirafuprol, piriprol o similar;
- 55 7) insecticidas lactónicos macrocíclicos: abamectina, emamectina, milbemectina, lepimectina, espinosad, ivermectina o similar;
- 8) compuestos METI I: fenazaquina, piridaben, tebufenpirad, tolfenpirad, flufenirim o similar;
- 60 9) compuestos METI II y III: acequinocilo, fluaciprim, hidrametimón o similar;
- 10) compuestos de agentes de desacomplamiento: clorfenapir o similar;
- 65 11) compuestos inhibidores de la fosforilación oxidativa: cihexitina, diafentiurón, óxido de fenbutatina, propargita o similar;

- 12) compuestos de interrupción de la muda: ciromazina o similar;
- 13) compuestos inhibidores de oxidasas de función mixta: butóxido de piperonilo o similar;
- 5 14) compuestos bloqueadores de los canales de sodio: indoxacarb, metaflumizona;
- 15) plaguicidas microbianos: agentes BT, agentes víricos patogénicos de insectos, agentes fúngicos patogénicos de insectos, agentes fúngicos patogénicos de nematodos, o similares;
- 10 16) otros compuestos: benclotiaz, bifenazato, cartap, flonicamida, piradalilo, pimetrozina, azufre, tiociclám, flubendiamida, cienopirafeno, flupirazofós, ciflumetofeno, amidoflumet, bensultap, dicofol, tetradifon, fenpiroximato, amitraz, clordimeform, triazamato, pimetrozina, pirimidifeno, 1,3-dicloropropeno, clofentenzina, fluacipirim, rotenona, DCIP, fenisobromolato, benzomato, metaldehído, clorantraniliprol, espinetoram, pirifluquinzaona o similar.

15 Los ejemplos de reguladores del crecimiento vegetal incluyen:

ácido abscísico, ácido indolbutírico, uniconazol, eticlozato, etefón, cloxifonac, clormequat, extracto de clorela, peróxido de calcio, cianamida, diclorprop, giberelina, daminozida, alcohol decílico, trinexapac-etilo, mepiquat-cloruro, paclobutrazol, cera de parafina, butóxido de piperonilo, pirafufen etilo, flurprimidol, prohidrojasmona, prohexadiona-calcio, bencilaminopurina, pendimetalina, forclorfenurón, maleato de hidrazida de potasio, 1-naftilacetoamida, 4-CPA, MCPB, colina, sulfato de oxiquinolina, eticlozato, butralina, 1-metilciclopropeno, hidrocloreuro de aviglicina y similares.

25 Ejemplos

A continuación se proporciona una explicación con mayor detalle de la presente invención indicando sus ejemplos. Sin embargo, el alcance de la presente invención no está limitado por los ejemplos siguientes.

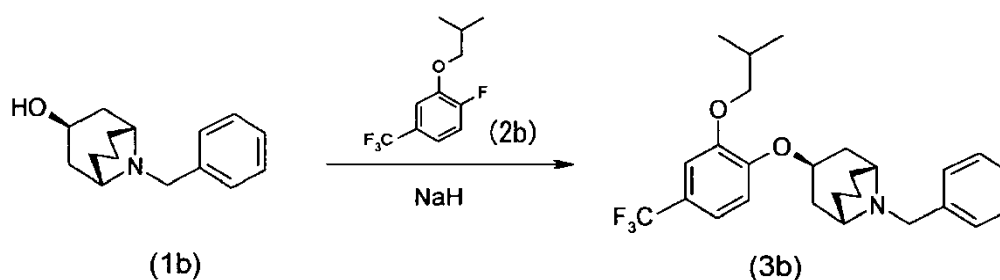
30

Ejemplo 1

Producción de

35 3-endo-[2-i-butoxi-4-(trifluorometil)fenoxi]-9-[5-(trifluorometil)-2-piridiloxi]-9-azabicyclo[3.3.1]nonano (Compuesto nº H-1)

[Fórmula química 13]



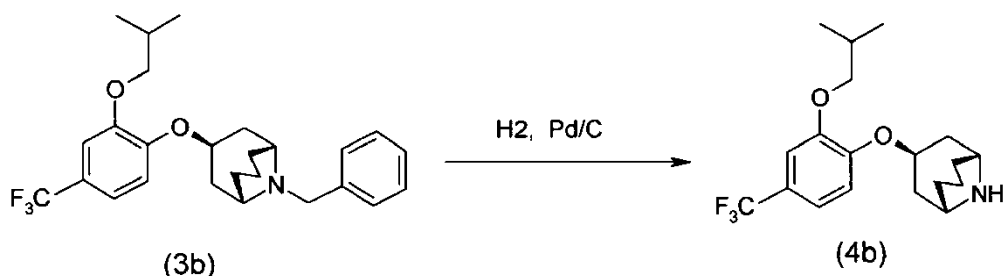
40

3-endo-9-bencil-9-azabicyclo[3.3.1]nonan-3-ol (Compuesto (1b)) se sintetizó mediante el método descrito en el documento WO 2007/039563.

45 Una disolución N,N-dimetilformamídica (14 ml) del compuesto (1b) (1,35 g) y 4-fluoro-3-i-butoxibenzotrifluoruro (compuesto (2b)) (1,38 g) se calentó hasta 90°C, seguido de la adición de hidruro de sodio al 60% (0,35 g) y agitación durante 2 horas. La mezcla resultante se enfrió entonces hasta la temperatura ambiente, se vertió en agua, y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó con sulfato de magnesio anhidro, se filtró, y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna para obtener el compuesto diana (3b) (2,04 g).

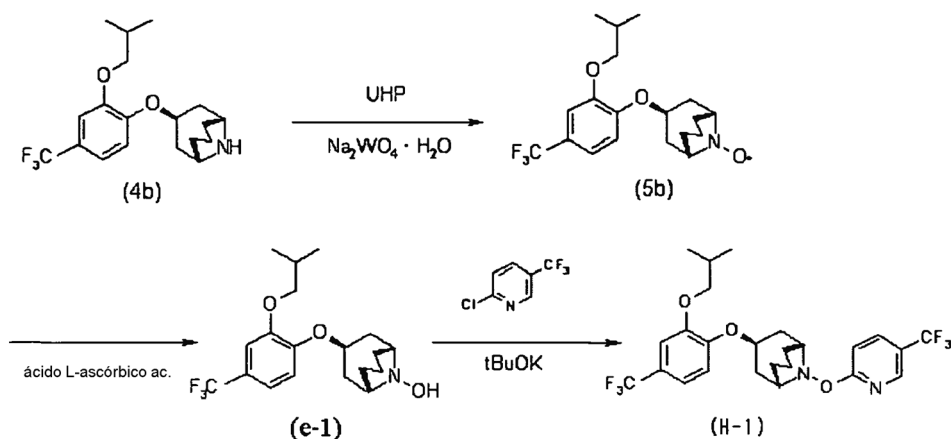
50

[Fórmula química 14]



- 5 Se añadió paladio al 10%-carbono (0,4 g) a una disolución etanólica (20 ml) del compuesto (3b) (2,04 g). La suspensión resultante se calentó a 50°C en una atmósfera de hidrógeno durante 5 horas. La suspensión se enfrió entonces y se filtró sobre elite, y el filtrado se separó por destilación a presión reducida. El compuesto obtenido (4b) se usó en la reacción siguiente sin purificación posterior.

10 [Fórmula química 15]

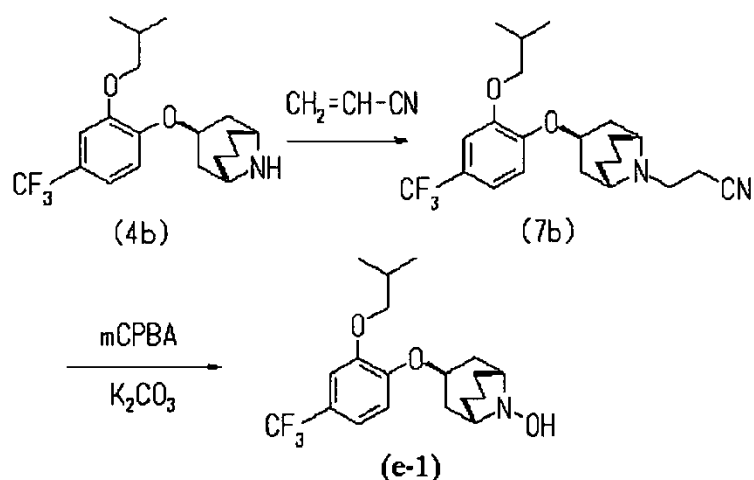


- 15 Se añadió sal sódica hidratada del ácido volfrámico (0,13 g) a una disolución en acetonitrilo (14 ml) del compuesto bruto (4b) (1,41 g) a temperatura ambiente, seguido de agitación durante 30 minutos. La mezcla resultante se enfrió entonces hasta 0°C, seguido de la adición de un aducto de urea-peróxido de hidrógeno (UHP, 0,75 g). La mezcla resultante se agitó a 0°C durante 45 minutos y después se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Se añadió agua a la mezcla, seguido de la extracción con cloroformo. La capa orgánica se secó y se concentró con carbonato de potasio anhidro. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna para obtener compuesto (5b) (0,57). El
- 20 Compuesto (5b) se diluyó entonces con cloroformo y se trató con ácido ascórbico acuoso para obtener un compuesto bruto (e-1) (0,37 g). A continuación, se añadió t-butoxipotasio (tetrahidrofurano 1M, 1,11 ml) a una disolución tetrahidrofuránica (4 ml) del compuesto bruto (e-1) (0,37 g) y 2-cloro-5-(trifluorometil)piridina (0,18 g) a 0°C en una atmósfera de nitrógeno, seguido del calentamiento hasta la temperatura ambiente y agitación durante 2 horas. Se añadió agua a la mezcla resultante, y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó con sulfato de magnesio anhidro, se filtró, y se concentró a presión reducida. El
- 25 residuo se purificó mediante cromatografía en columna para obtener el compuesto diana H-1 (0,27 g).

Ejemplo 2

- 30 Producción de 3-endo-[2-i-butoxi-4-(trifluorometil)fenoxi]-9-hidroxi-9-azabicyclo[3.3.1]nonano (compuesto nº e-1)

[Fórmula química 16]

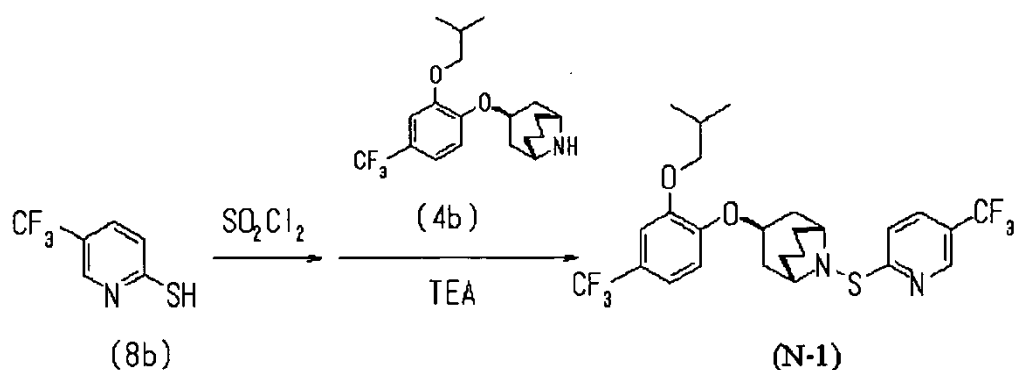


- 5 Se añadió acrilonitrilo (9,07 g) a una disolución metanólica (300 ml) del compuesto bruto (4b) (30,23 g) a temperatura ambiente, seguido de agitación toda la noche. El disolvente se concentró a presión reducida, y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 4:1 hasta 6:4) para obtener el compuesto (7b) (30,4 g, aceite viscoso).
- 10 Se añadieron carbonato de potasio (15,5 g) y ácido metacloroperbenzoico (pureza del 70%, 23,71 g) a una disolución en cloruro de metileno (600 ml) del compuesto (7b) (30,4 g) a temperatura ambiente, seguido de la agitación de la mezcla resultante durante 4 horas. Se añadió sulfato de magnesio anhidro (10 g) a la mezcla, y la mezcla se filtró, seguido de la concentración del disolvente a presión reducida. El residuo se diluyó con acetato de etilo, se lavó con ácido ascórbico acuoso, después con agua, se secó con sulfato de magnesio anhidro, se filtró, y se concentró a presión reducida. Se añadió hexano al residuo para recuperar y obtener de ese modo un compuesto bruto (e-1) (17,79 g). Además, su licor madre se purificó mediante cromatografía en columna para obtener un compuesto cristalino (e-1) (8,12 g, punto de fusión de 112-115°C).

Ejemplo 3

Producción de 3-endo-[2-*i*-butoxi-4-(trifluorometil)fenoxi]-9-[5-(trifluorometil)-2-piridiltio]-9-azabicyclo[3.3.1]nonano (compuesto n° N-1)

[Fórmula química 17]



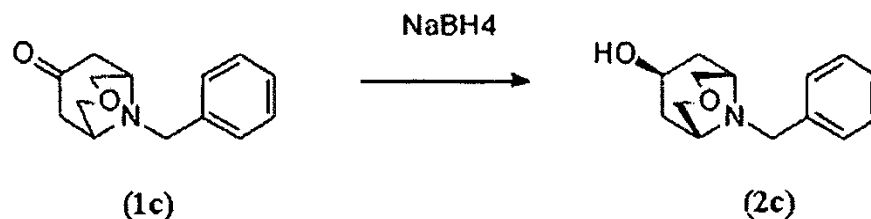
- Una disolución en cloruro de metileno (10 ml) del compuesto (8b) (0,55 g), que se puede producir mediante métodos bien conocidos, se enfrió hasta 0°C en una atmósfera de nitrógeno seguido de la adición de cloruro de sulfuro (0,46 g). La mezcla resultante se agitó durante 1 hora, seguido de la concentración a presión reducida. Una disolución obtenida diluyendo el residuo con cloruro de metileno (10 ml) se añadió en gotas a una disolución en cloruro de metileno (10 ml) del compuesto bruto (4b) (1,0 g) y trietilamina (0,34 g) mientras se enfriaba con hielo, seguido del calentamiento lento hasta la temperatura ambiente y simplemente agitando toda la noche. La mezcla resultante se vertió en agua, seguido de la extracción con cloroformo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó con sulfato de magnesio anhidro, se filtró, y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en

columna en gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 9:1) para obtener el compuesto diana (N-1) (1,36 g, aceite viscoso).

Ejemplo 4

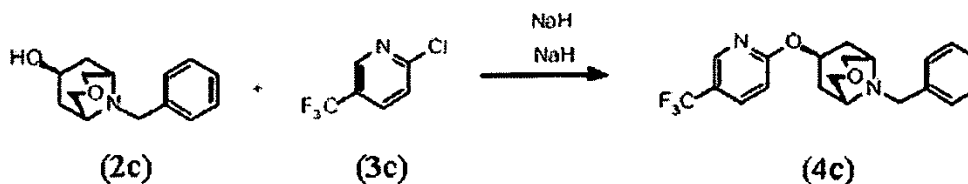
Producción de 3-oxa-7-endo-[5-(trifluorometil)-2-piridiloxi]-9-[2-isopropoxycarbonil-4-(trifluorometil)fenoxi]-9-azabicyclo[3.3.1]nonano (compuesto nº (K-12))

[Fórmula química 18]



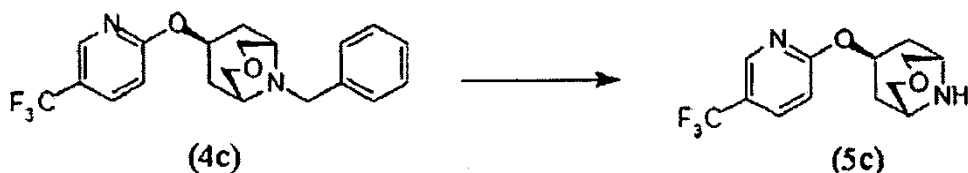
Se sintetizó 9-bencil-3-oxa-9-azabicyclo[3.3.1]nonano-7-ona (1c) mediante el método descrito en el documento WO 2007/022502. Se añadió borohidruro de sodio (0,785 g) a una disolución etanólica (50 ml) del compuesto (1c) (4 g) a temperatura ambiente, seguido de la agitación de la mezcla resultante durante 3 horas. La mezcla se enfrió entonces y se concentró a presión reducida, seguido del vertido en agua y extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó con sulfato de magnesio anhidro, se filtró, y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna para obtener el compuesto (2c) (3,62 g).

[Fórmula química 19]



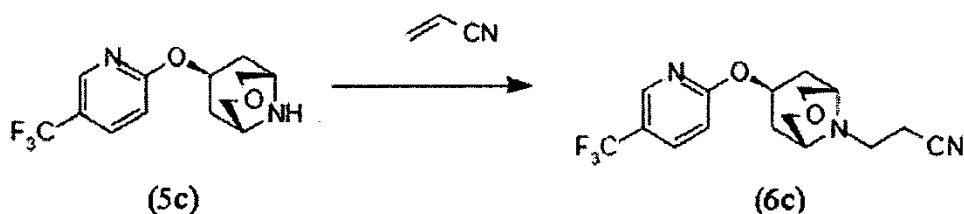
Una disolución en DMF (30 ml) del compuesto (2c) (2,45 g) y 2-cloro-5-(trifluorometil)piridina (2,86 g) se calentó hasta 80°C, seguido de la adición de hidruro de sodio al 60% (0,42 g) a la disolución. La mezcla resultante se agitó durante 30 minutos, seguido de la adición de hidruro de sodio al 60% (0,42 g). La mezcla resultante simplemente se agitó entonces durante 2 horas. Después, la mezcla se enfrió hasta la temperatura ambiente, se vertió en agua, seguido de la extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó con sulfato de magnesio anhidro, se filtró, y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna para obtener el compuesto (4c) (3,05 g).

[Fórmula química 20]



Se añadió hidróxido de paladio al 20%-carbono (0,92 g) a una disolución etanólica (50 ml) del compuesto (4c) (3,05 g), seguido del calentamiento de la suspensión resultante a 50°C durante 6 horas. La mezcla resultante se enfrió entonces y se filtró sobre celita, y el filtrado se separó por destilación a presión reducida. El compuesto obtenido (5c) se usó en la reacción siguiente sin purificación posterior.

[Fórmula química 21]



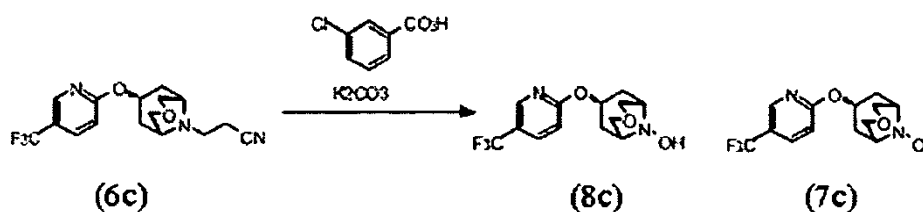
- 5 Se añadió acrilonitrilo (1,06 g) a una disolución metanólica (50 ml) del compuesto bruto (5c) (2,3 g) a temperatura ambiente, seguido de la agitación toda la noche. El disolvente se concentró a presión reducida, y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener el compuesto (6c) (2,11 g).

Compuesto (6c): p.f. 87-90°C

- 10 RMN 1H (CDCl₃, δ ppm) 8,41(s, 1H), 7,73(d, 1H), 6,81(d, 1H), 5,47-5,40(m, 1H), 3,87(d, 2H), 3,60(d, 2H), 2,98(t, 2H), 2,84(d, 2H), 2,50-2,42(m, 4H), 1,87(d, 1H), 1,82(d, 1H)

[Fórmula química 22]

15



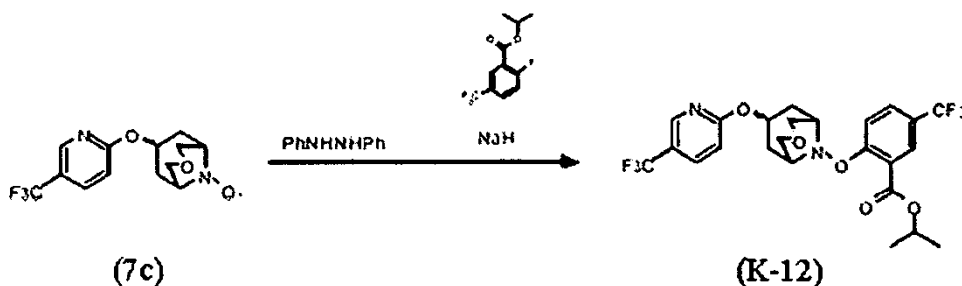
- 20 Se añadieron ácido meta-cloroperbenzoico (pureza del 70%, 0,58 g) y carbonato de potasio (0,4 g) a una disolución en cloruro de metileno (20 ml) del compuesto (6c) (0,76 g) a temperatura ambiente, seguido de la agitación durante una hora. Se añadió sulfato de magnesio anhidro a la mezcla, y la mezcla se filtró sobre celita, seguido de la concentración del disolvente a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna para obtener el compuesto (7c) (0,38) y el compuesto (8c) (0,2 g).

Compuesto (8c): p.f. 110-113°C

- 25 RMN 1H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida 21,2°C) 8,43(s, 1H), 7,73(d, 1H), 6,80(d, 1H), 5,68-5,61(m, 0,7H), 5,39-5,36(m, 0,3H), 4,38(d, 0,5H), 3,79(s, 3H), 3,37(d, 0,5H), 3,24(d, 1,5H), 3,11(d, 0,5H), 2,75-2,53(m, 2H), 2,17-2,05(brd, 0,5H), 1,78-1,72(d, d, 1,5H)

[Fórmula química 23]

30



- 35 Se añadió 1,2-difenilhidrazina (0,14 g) a una disolución en THF (5 ml) del compuesto (7c) (0,38 g) a temperatura ambiente, seguido de agitación de la mezcla resultante durante 30 minutos. Se añadió hidruro de sodio al 60% (0,06 g) a la mezcla, seguido de la agitación durante 10 minutos. Después, se añadió una disolución en THF (5 ml) de éster isopropílico del ácido 2-fluoro-5-(trifluorometil)benzoico (0,314 g) a la mezcla resultante, seguido de agitación durante una hora. La mezcla se vertió entonces en agua, y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó con sulfato de magnesio anhidro, se filtró, y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna para obtener el compuesto diana (compuesto nº (K-12)) (0,27 g, aceite
- 40

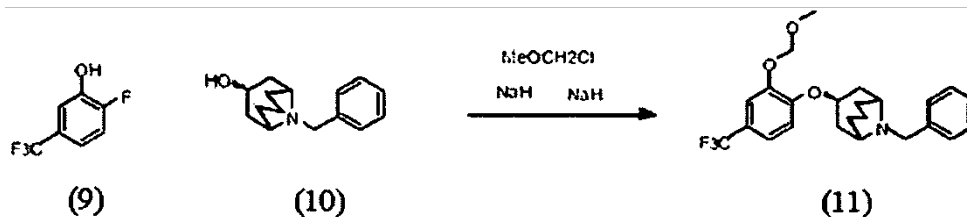
viscoso).

Ejemplo 5

5 Producción de

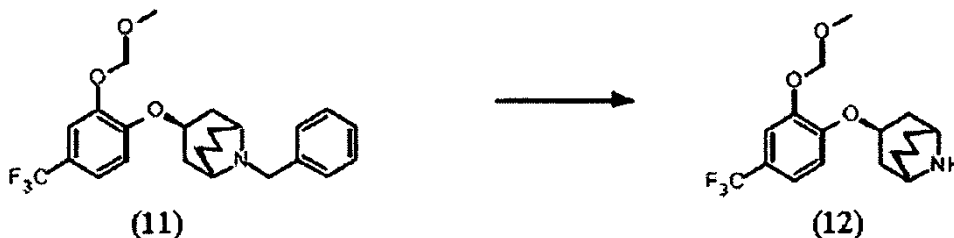
3-endo-[2-butoxi-4-(trifluorometil)fenoxi]-9-[5-(trifluorometil)-2-piridiloxi]-9-azabicyclo[3.3.1]nonano (compuesto nº (H-54))

10 [Fórmula química 24]



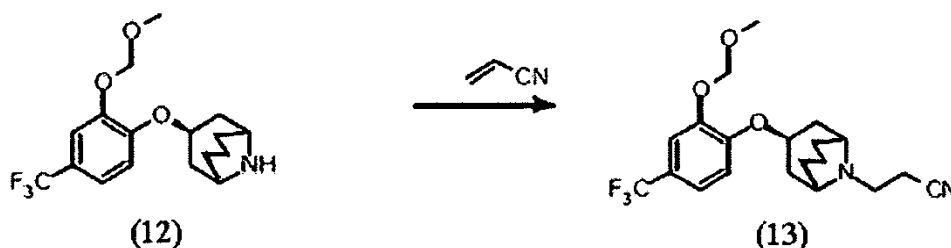
15 Se añadió hidruro de sodio al 60% (0,75 g) a una disolución en DMF (20 ml) de 2-fluoro-5-(trifluorometil)fenol (2,83 g) mientras se enfriaba con hielo. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos, y se añadió éter clorometílico (1,39 g) en gotas a la mezcla mientras se enfriaba con hielo. La mezcla se calentó entonces hasta la temperatura ambiente y se agitó durante 30 minutos, y después se calentó hasta 80°C y se agitó adicionalmente durante una hora. Se añadieron compuesto (10) (4 g) e hidruro de sodio al 60% (0,94 g) a la mezcla resultante, seguido de agitación durante 3 horas. La mezcla se enfrió entonces hasta la temperatura ambiente, se vertió en agua, y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó con sulfato de magnesio anhidro, se filtró, y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna para obtener el compuesto diana (11) (6,29 g).

25 [Fórmula química 25]



30 Se añadió hidróxido de paladio al 20%-carbono (1,25 g) a una disolución etanólica (100 ml) de compuesto (11) (6,27 g). La suspensión resultante se calentó a 50°C en una atmósfera de hidrógeno durante 2 horas, seguido de agitación a temperatura ambiente toda la noche. La mezcla se filtró después sobre celita, y el filtrado se separó por destilación a presión reducida. El compuesto obtenido (12) se usó en la reacción siguiente sin purificación posterior.

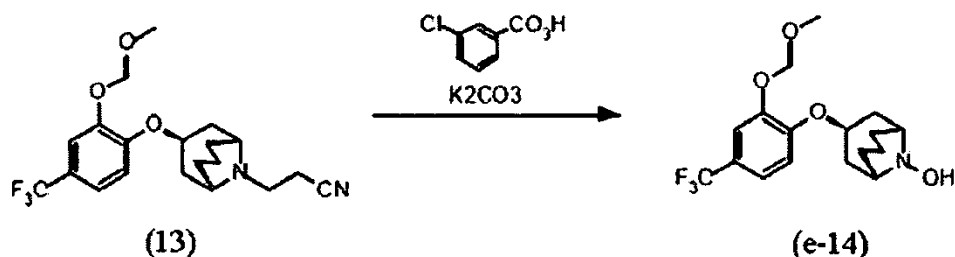
[Fórmula química 26]



35 Se añadió acrilonitrilo (1,45 g) a una disolución metanólica (50 ml) del compuesto bruto (12) (4,71 g) a temperatura ambiente, seguido de agitación toda la noche. El disolvente se concentró a presión reducida, y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener compuesto (13) (5,09 g, aceite viscoso).

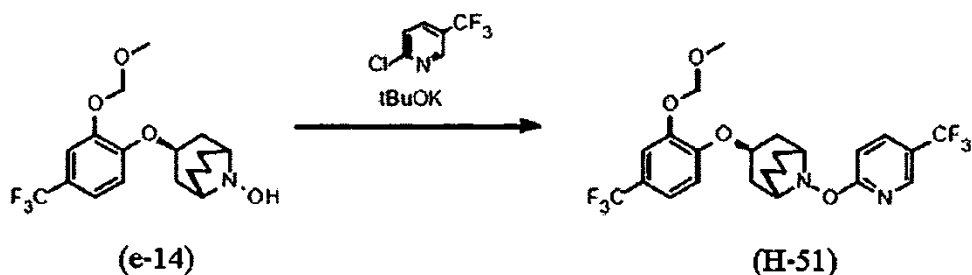
40

[Fórmula química 27]



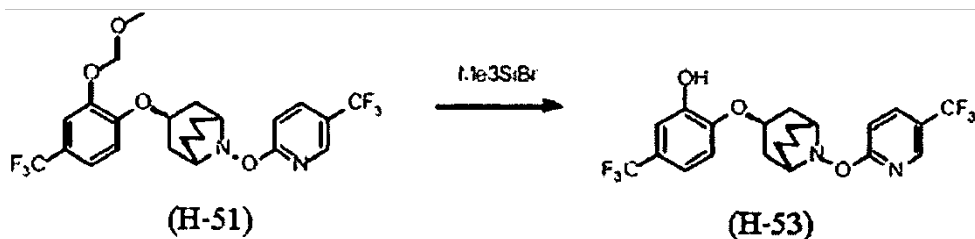
- 5 Se añadieron ácido meta-cloroperbenzoico (pureza del 70%, 1,2 g) y carbonato de potasio (0,78 g) a una disolución en cloruro de metileno (30 ml) del compuesto (13) (1,5 g) a temperatura ambiente, seguido de agitación de la mezcla resultante durante 2 horas. Se añadió sulfato de magnesio anhidro (10 g) a la mezcla, y la mezcla se filtró, seguido de concentración del disolvente a presión reducida. El residuo se diluyó con cloruro de metileno, se lavó con ácido ascórbico acuoso, después con agua, se secó con sulfato de magnesio anhidro, se filtró, y se concentró a presión
- 10 reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna para obtener el compuesto (e-14) (1,35 g).

[Fórmula química 28]



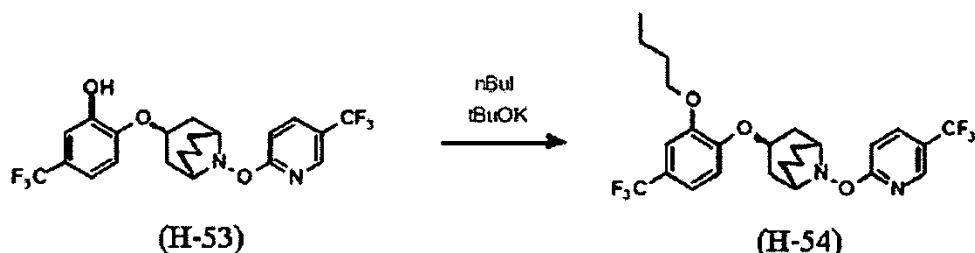
- 15 Se añadió t-butoxipotasio (THF 1M, 3,6 ml) a una disolución en THF (20 ml) del compuesto (e-14) (1,3 g) y 2-cloro-5-(trifluorometil)piridina (0,65 g) a 0°C en una atmósfera de nitrógeno, seguido de calentamiento hasta la temperatura ambiente y agitación durante 2 horas. La mezcla resultante se vertió entonces en agua, y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó con sulfato de magnesio anhidro, se filtró, y se concentró a presión
- 20 reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna para obtener el compuesto (H-51) (0,67 g, aceite viscoso).

[Fórmula química 29]



- 25 Se añadió lentamente bromotrimetilsilano (0,302 g) a una disolución en cloruro de metileno (5 ml) del compuesto (H-51) (0,25 g) en una atmósfera de nitrógeno a -30°C. La mezcla resultante se agitó entonces a -30°C durante una hora, seguido de 2 horas para calentar hasta 0°C. La mezcla se vertió entonces en agua fría, seguido de la
- 30 extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó con sulfato de magnesio anhidro, se filtró, y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna para obtener el compuesto (H-53) (0,13 g, p.f. 141-144°C).

[Fórmula química 30]

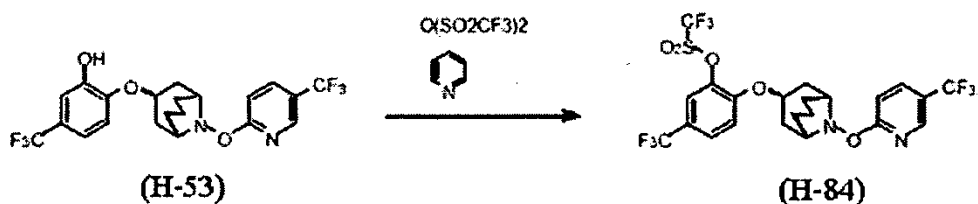


- 5 Se añadió t-butoxipotasio (0,085 g) a una disolución en THF (6 ml) del compuesto (H-53) (0,35 g) y 1-yodobutano (0,14 g) mientras se enfriaba con hielo. Después, la mezcla se calentó hasta la temperatura ambiente, y después se calentó hasta 50°C y se agitó toda la noche. La mezcla resultante se enfrió entonces hasta la temperatura ambiente, se vertió en agua, y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó con sulfato de magnesio anhidro, se filtró, y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna para obtener el compuesto diana (compuesto nº (H-54)) (0,24 g, aceite viscoso).
- 10

Ejemplo 6

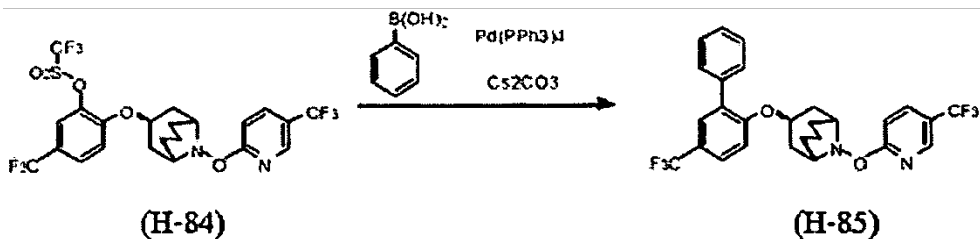
- 15 Producción de 3-endo-[2-fenil-4-(trifluorometil)fenoxi]-9-[5-(trifluorometil)-2-piridiloxi]-9-azabiclo[3.3.1]nonano (compuesto nº(H-85))

[Fórmula química 31]



- 20 Se añadió lentamente ácido trifluorometanosulfónico anhidro (3,66 g) a una disolución en cloruro de metileno (50 ml) del compuesto (H-53) (5 g) y piridina (2,14 g) mientras se enfriaba con hielo. Después, la mezcla se calentó hasta la temperatura ambiente y se agitó toda la noche. La mezcla resultante se vertió entonces en agua fría y se extrajo con cloruro de etileno. La capa orgánica se lavó con agua, se secó con sulfato de magnesio anhidro, se filtró, y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna para obtener el compuesto (H-84) (3,7 g, p.f. 127-130°C).
- 25

[Fórmula química 32]



- 30 Se añadieron agua (2 ml), carbonato de cesio (0,88 g), ácido fenilborónico (0,098 g) y tetraquis(trifenilfosfina)paladio (0) (0,078 g) a una disolución en THF (4 ml) del compuesto (H-84) (0,4 g) en una atmósfera de nitrógeno. La mezcla resultante se calentó entonces hasta 80°C y se agitó toda la noche. La mezcla se enfrió entonces hasta la temperatura ambiente, se vertió en agua, y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó con sulfato de magnesio anhidro, se filtró, y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna para obtener el compuesto diana (compuesto nº (H-85)) (0,2 g, aceite viscoso).
- 35

- 40 En las tablas 1-5 se muestran los compuestos de amina cíclicos de la presente invención, que se pueden producir mediante los métodos de producción descritos anteriormente.

Además, $(R^{10})_m$, $(R^{11})_n$, A, $(R^{21})_r$, y $Cy^2-(R^{20})_p$ en la tabla 1 representan los sustituyentes del compuesto de amina cíclico representado por la fórmula (Ig).

5 $(R^{10})_m$, $(R^{11})_n$, A, $(R^{21})_r$, y $Cy^2-(R^{20})_p$ en la tabla 2 representan los sustituyentes del compuesto de amina cíclico representado por la fórmula (Ih).

$(R^{10})_m$, $(R^{11})_n$, A, $(R^{21})_r$, Cy^1 , Cy^2 , y $(R^{20})_p$ en la tabla 3 representan los sustituyentes del compuesto de amina cíclico representado por la fórmula (Ii).

10 $(R^{10})_m$, $(R^{11})_n$, A, $(R^{21})_r$, Cy^1 , Cy^2 , y $(R^{20})_p$ en la tabla 4 representan los sustituyentes del compuesto cíclico representado por la fórmula (Ij).

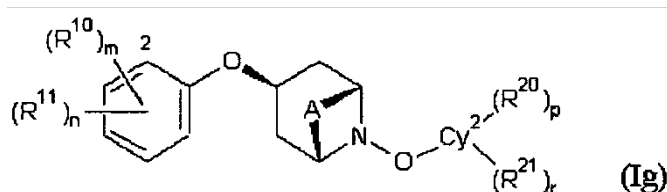
15 $(R^{10})_m$, $(R^{11})_n$, A, $(R^{21})_r$, Cy^1 , Cy^2 , y $(R^{20})_p$ en la tabla 5 representan los sustituyentes del compuesto de amina cíclico representado por la fórmula (Ik).

$(R^{10})_m$, $(R^{11})_n$, A, $(R^{21})_r$, Cy^1 , Cy^2 , y $(R^{20})_p$ en la tabla 6 representan los sustituyentes del compuesto de amina cíclico representado por la fórmula (Il).

20 Además, en las tablas 1-6, los valores numéricos mostrados frente a los sustituyentes representan los sitios de sustitución. Además, Et representa un grupo etilo, Me representa un grupo metilo, ⁿBu representa un grupo n-butilo, ⁱBu representa un grupo i-butilo, ^sBu representa un grupo s-butilo, ^tBu representa un grupo t-butilo, ⁿPen representa un grupo n-pentilo, ⁿHex representa un grupo n-hexilo, ^cPr representa un grupo ciclopropilo, ^cBu representa un grupo ciclobutilo, ^cPen representa un grupo ciclopentilo, ^cHex representa un grupo ciclohexilo.

25

[Fórmula química 33]



30 [Tabla 1]

Tabla 1

Nº	$(R^{10})_m$	$(R^{11})_n$	A	$Cy^2-(R^{20})_p$	$(R^{21})_r$
H-1	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-2	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-3	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-4	2-(CO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-5	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	6-CF ₃ -piridazin-3-ilo	-
H-6	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	6-CF ₃ -piridazin-3-ilo	-
H-7	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	6-CF ₃ -piridazin-3-ilo	-
H-8	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₂	C ₃ H ₆	6-CF ₃ -piridazin-3-ilo	-
H-9	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pirimidin-2-ilo	-
H-10	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pirimidin-2-ilo	-
H-11	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pirimidin-2-ilo	-
H-12	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -pirimidin-2-ilo	-
H-13	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -tiazol-2-ilo	-
H-14	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -tiazol-2-ilo	-
H-15	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -tiazol-2-ilo	-
H-16	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -tiazol-2-ilo	-
H-17	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -[1,3,4]tiadiazol-2-ilo	-
H-18	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -[1,3,4]tiadiazol-2-ilo	-
H-19	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -[1,3,4]tiadiazol-2-ilo	-
H-20	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -[1,3,4]tiadiazol-2-ilo	-
H-21	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _r	(R ²¹) _r
H-22	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-23	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-24	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-25	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	6-CF ₃ -piridazin-3-ilo	-

[Tabla 2]

Tabla 1 (Continuación)

5

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _r	(R ²¹) _r
H-26	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	6-CF ₃ -piridazin-3-ilo	-
H-27	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	6-CF ₃ -piridazin-3-ilo	-
H-28	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	6-CF ₃ -piridazin-3-ilo	-
H-29	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pirimidin-2-ilo	-
H-30	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pirimidin-2-ilo	-
H-31	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pirimidin-2-ilo	-
H-32	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pirimidin-2-ilo	-
H-33	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -tiazol-2-ilo	-
H-34	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -tiazol-2-ilo	-
H-35	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -tiazol-2-ilo	-
H-36	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -tiazol-2-ilo	-
H-37	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -[1,3,4]tiadiazol-2-ilo	-
H-38	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -[1,3,4]tiadiazol-2-ilo	-
H-39	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -[1,3,4]tiadiazol-2-ilo	-
H-40	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -[1,3,4]tiadiazol-2-ilo	-
H-41	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CN-piridin-2-ilo	-
H-42	2-(OE ⁻)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-43	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-44	2-(OC-H ₂ ^o Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CN-piridin-2-ilo	-
H-45	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CN-piridin-2-ilo	-
H-46	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CN-piridin-2-ilo	-
H-47	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	6-CN-piridazin-3-ilo	-
H-48	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	6-CN-piridazin-3-ilo	-
H-49	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	6-CN-piridazin-3-ilo	-
H-50	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	6-CN-piridazin-3-ilo	-

[Tabla 3]

Tabla 1 (Continuación)

10

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-51	2-(OCH ₂ OMe)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-52	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	6-CN-piridazin-3-ilo	-
H-53	2-OH	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-54	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-55	2-([1,3]Dioxolan-2-ilo)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-56	2-(CH ₂ O ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-57	2-(CH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-58	2-(CH ₂ OE)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-59	2-(NH ⁱ Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-60	2-(O ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-61	2-(O ^o Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-62	2-(OCO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-63	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-64	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-65	2-(OCH ₂ CH=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-66	2-(OCH ₂ ⁱ Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-67	2-(OCH ₂ CH=CCl ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-68	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-69	2-(OCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-70	2-(OCH ₂ ^o Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-71	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-72	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-73	2-(CO ₂ ^t Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-74	2-(CO ₂ Et)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-75	2-(OCH ₂ ^t Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -6-Cl-piridin-2-ilo	-

[Tabla 4]

Tabla 1 (Continuación)

5

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-76	2-(OCH ₂ ^t Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	3-CF ₂ -6-Cl-piridin-2-ilo	-
H-77	2-(OAc)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-78	2-(OCH ₂ [2,2-Cl ₂ -3-Ph- ^s Pr])	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-79	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-80	2-(OCH ₂ CH(OH)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-81	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-82	2-(O ⁶ Pen)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-83	2-(OCONH ^t Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-84	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-85	2-Ph	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-86	2-(piridin-3-ilo)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-87	2-(S ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-88	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-89	2-(O ⁿ Pr)	4-Cl	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-90	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₄ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-91	2-(OCH ₂ ^t Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-

[Tabla 5]

Tabla 1 (Continuación)

10

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-92	2-(OCH ₃), 3- ⁿ Pr	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-93	2-(OCH(CH ₃)CH ₂)-3	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-94	2- ⁿ Bu	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-95	2- ^t Pen	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-96	2-(CH ₂ CH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-97	2-(CH=N-OH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-98	2-(CH=N-OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-99	2-(CO ^t Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-100	2-(OCH ₂ OAc)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-101	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-102	2-(OCH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-103	2-(OCH ₂ F)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-104	2-(OCH ₂ -(piridin-3-ilo))	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-105	2-(OCH ₂ -(tetrahidrofuran-2-ilo))	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-106	2-(OCH ₂ CO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-107	2-(OCH ₂ CON(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-108	2-(OC ₂ H ₄ NO ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-109	2-(OC ₂ H ₄ Si(CH ₃) ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-110	2-(SCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-111	2-(SCH ₂ C=CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-112	2-(SO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-

[Tabla 6]

Tabla 1 (Continuación)

15

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-113	2-(SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-114	2-(OF)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-115	2-(O-(piridin-3-ilo))	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-116	2-NH ₂	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-117	2-(N(CH ₃) ^t Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-118	2-(NHCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-119	2-(NHCH ₂ C=CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-120	2-(NHAc)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-121	2-(NHSO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-122	2-(NHSO ₂ F)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-123	2-(CONH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-124	2-(O-N=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-125	2-(SF)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-126	2-(S-(piridin-3-ilo))	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-127	2-(CS ^{Pr})	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-128	2-(CO(S ^{Pr}))	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-129	2-(CS(O ^{Pr}))	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-130	2-(CS ₂ ^{Pr})	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-131	2-(Si(CH ₃) ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-132	2-NO ₂	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-133	2-(OCH ₂ CH ₂) ₃	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-134	2-(OCH ₂ CH ₂ O) ₃	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-135	2-(OCH ₂ O) ₃	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-136	2-(CH ₂ OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-137	2-(CH ₂ OCH ₂ CN)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-

[Tabla 7]

Tabla 1 (Continuación)

5

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-138	2-(CH ₂ OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-139	2-(CH ₂ OCH ₂ O ^c Pen)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-140	2-(CH ₂ OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-141	2-(CH ₂ OCH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-142	2-(CH ₂ OCH ₂ SO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-143	2-(CH ₂ OCH ₂ F)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-144	2-(CH ₂ OCH ₂ -(piridin-3-ilo))	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-145	2-(CH ₂ OCH ₂ [tetrahidrofuran-2-ilo])	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-146	2-(CH ₂ SCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-147	2-(CH ₂ SCH ₂ CN)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-148	2-(CH ₂ SCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-149	2-(CH ₂ SCH ₂ O ^c Pen)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-150	2-(CH ₂ SCH ₂ Ac)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-151	2-(CH ₂ SCH ₂ F)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-152	2-(CH ₂ SCH ₂ -(piridin-3-ilo))	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-153	2-(CH ₂ SCH ₂ [tetrahidrofuran-2-ilo])	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-

[Tabla 8]

Tabla 1 (Continuación)

10

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-154	2-(CO ₂ CH ₂ [tetrahidrofuran-2-ilo])	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-155	2-(espiro[2.2]pent-1-ilo)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-156	2-(1-CH ₃ -espiro[2.2]pent-1-ilo)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-157	2-(1-HOCH ₂ -espiro[2.2]pent-1-ilo)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-158	2-(espiro[2.2]pent-1-iloxi)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-159	2-(espiro[2.2]pent-1-ilometoxi)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-160	2-(2- ^c Pr- ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-161	2-(2- ^c Pr- ^c PrO)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-162	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -piridin-2-ilo	-
H-163	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -piridin-2-ilo	-
H-164	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -piridin-2-ilo	-
H-165	2-(CO ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -piridin-2-ilo	-
H-166	2-(O ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -piridin-2-ilo	-
H-167	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -piridin-2-ilo	-
H-168	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -piridin-2-ilo	-

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-169	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -piridin-2-ilo	-

[Tabla 9]

Tabla 1 (Continuación)

5

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-170	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -piridin-2-ilo	-
H-171	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -piridin-2-ilo	-
H-172	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-SF ₅	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -piridin-2-ilo	-
H-173	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-SF ₅	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -piridin-2-ilo	-
H-174	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-SF ₅	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -piridin-2-ilo	-
H-175	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-SF ₅	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -piridin-2-ilo	-
H-176	2-(O _n Pr)	4-SF ₅	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -piridin-2-ilo	-
H-177	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-SF ₅	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -piridin-2-ilo	-
H-178	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-SF ₅	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -piridin-2-ilo	-
H-179	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-SF ₅	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -piridin-2-ilo	-
H-180	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-SF ₅	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -piridin-2-ilo	-
H-181	2-(O ⁿ Pr)	4-SF ₅	C ₃ H ₆	5-SF ₅ -piridin-2-ilo	-
H-182	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CN	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-183	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CN	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-184	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CN	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-185	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CN	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-186	2-(O ⁿ Pr)	4-CN	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-187	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-Cl-piridin-2-ilo	-
H-188	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-Cl-piridin-2-ilo	-
H-189	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-Cl-piridin-2-ilo	-
H-190	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-Cl-piridin-2-ilo	-

[Tabla 10]

Tabla 1 (Continuación)

10

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-191	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-Cl-piridin-2-ilo	-
H-192	2 ⁿ Bu	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-193	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-194	2-(CH ₂ O ¹ Pr)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-195	2-(CH ₂ OEt)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-196	2-(OEt)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-197	2-(O ⁿ Pr)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-198	2-(O ¹ Pr)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-199	2-(O ⁿ Bu)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-200	2-(O ^s Bu)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-201	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-202	2-(OCH ₂ ¹ Bu)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-203	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-204	2-(OCH ₂ CN)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-205	2-(OCH ₂ CH(OH)CH ₃)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-206	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃)CH ₃)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-207	2-(OCH ₂ OCH ₃)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-208	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-209	2-(OCH ₂ Ac)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-210	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-211	2-(OCH ₂ CH=C(CH ₃) ₂)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-212	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-

[Tabla 11]

Tabla 1 (Continuación)

15

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-213	2-(OAc)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-214	2-(OCO ¹ Pr)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-215	2-(OCONH ¹ Pr)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-216	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-217	2-(NHCH ₂ Pr)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-218	2-(CO ₂ Et)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-219	2-(S ⁿ Pr)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-220	2-([1,3]dioxolan-2-ilo)	4-Br	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-221	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CH(CF ₃) ₂	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-222	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CH(CF ₃) ₂	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-223	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃ CH ₃))	4-CF(CF ₃) ₂	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-224	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF(CF ₃) ₂	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-225	2-(O ⁿ Pr)	4-C(CF ₃) ₂ OCH ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-226	2- ⁿ Bu	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-227	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-228	2-(CH ₂ O ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-229	2-(CH ₂ OEt)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-230	2-(OEt)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-231	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-232	2-(O ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-233	2-(O ¹ Bu)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-234	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-235	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-

[Tabla 12]

Tabla 1 (Continuación)

5

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-236	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-237	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-238	2-(OCH ₂ ¹ Bu)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-239	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-240	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-241	2-(OCH ₂ CH(OH)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-242	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-243	2-(OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-244	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-245	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-246	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-247	2-(OCH ₂ CH=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-248	2-(OCH ₂ C=CH)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-249	2-(OAc)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-250	2-(OCO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-251	2-(OCONH ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-252	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-253	2-(NHCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-254	2-(CO ₂ Et)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-255	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-256	2-(S ⁿ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-

[Tabla 13]

Tabla 1 (Continuación)

10

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-257	2-([1,3]dioxolan-2-ilo)	4-CF ₃	CH ₂ N(CH ₃)CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-258	2- ⁿ Bu	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-259	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-260	2-(CH ₂ O ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-261	2-(CH ₂ OEt)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-262	2-(OEt)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-263	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-264	2-(O ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-265	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-266	2-(O ^s Bu)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-267	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-268	2-(OCH ₂ ¹ Bu)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-269	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-270	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-271	2-(OCH ₂ CH(OH)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-272	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-273	2-(OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-274	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-275	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-276	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-277	2-(OCH ₂ CH=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-

[Tabla 14]

Tabla 1 (Continuación)

5

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-278	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-279	2-(OAc)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-280	2-(OCO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-281	2-(OCONH ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-282	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-283	2-(NHCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-284	2-(CO ₂ Et)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-285	2-(S ⁿ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-286	2-([1,3]dioxolan-2-ilo)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-287	2 ⁿ Bu	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-288	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-289	2-(CH ₂ O ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-290	2-(CH ₂ OEt)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-291	2-(OEt)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-292	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-293	2-(O ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-294	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-295	2-(O ^s Bu)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-296	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-297	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-298	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-299	2-(OCH ₂ ¹ Bu)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-300	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-301	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-

[Tabla 15]

Tabla 1 (Continuación)

10

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-302	2-(OCH ₂ CH(OH)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-303	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-304	2-(OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-305	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-306	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-307	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-308	2-(OCH ₂ CH=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-309	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-310	2-(OAc)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-311	2-(OCO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-312	2-(OCONH ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-313	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-314	2-(NHCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-315	2-(CO ₂ Et)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-316	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-317	2-(S ⁿ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-318	2-([1,3]dioxolan-2-ilo)	4-CF ₃	CH ₂ CF ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-319	2- ⁿ Su	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-320	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-

[Tabla 16]

Tabla 1 (Continuación)

5

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-321	2-(CH ₂ O ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-322	2-(CH ₂ OEt)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-323	2-(OEt)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-324	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-325	2-(O ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-326	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-327	2-(O ^s Bu)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-328	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-329	2-(OCH ₂ ¹ Bu)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-330	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-331	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-332	2-(OCH ₂ CH(OH)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-333	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-334	2-(OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-335	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-336	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-337	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-338	2-(OCH ₂ CH=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-339	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-340	2-(OAc)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-341	2-(OCO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-

[Tabla 17]

Tabla 1 (Continuación)

10

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-342	2-(OCONH ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-343	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-344	2-(NHCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-345	2-(CO ₂ Et)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-346	2-(S ⁿ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-347	2-([1,3]dioxolan-2-ilo)	4-CF ₃	CH ₂ SCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-348	2- ⁿ Bu	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-349	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-350	2-(CH ₂ O ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-351	2-(CH ₂ OEt)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-352	2-(OEt)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-353	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-354	2-(O ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-355	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-356	2-(O ^s Bu)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-357	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-358	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-359	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-360	2-(OCH ₂ ¹ Bu)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-361	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-362	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-363	2-(OCH ₂ CH(OH)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-

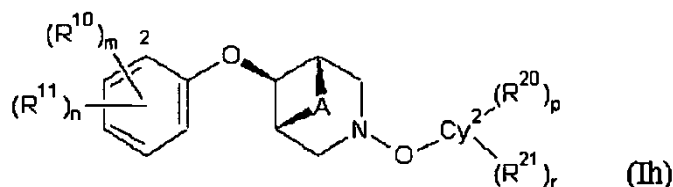
[Tabla 18]

Tabla 1 (Continuación)

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
H-364	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-365	2-(OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-366	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-367	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-368	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-369	2-(OCH ₂ CH=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-370	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-371	2-(OAc)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-372	2-(OCO ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-373	2-(OCONH ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-374	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-375	2-(NHCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-376	2-(CO ₂ Et)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-377	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-378	2-(S ⁿ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
H-379	2-([1,3]dioxolan-2-ilo)	4-CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-

5

[Fórmula química 34]



10 [Tabla 19]

Tabla 2

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
J-21	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-22	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-23	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-24	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-25	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	6-CF ₃ -piridazin-3-ilo	-
J-26	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	6-CF ₃ -piridazin-3-ilo	-
J-27	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	6-CF ₃ -piridazin-3-ilo	-
J-28	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	6-CF ₃ -piridazin-3-ilo	-
J-29	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -pirimidin-2-ilo	-
J-30	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -pirimidin-2-ilo	-
J-31	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -pirimidin-2-ilo	-
J-32	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -pirimidin-2-ilo	-
J-33	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -tiazol-2-ilo	-
J-34	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -tiazol-2-ilo	-
J-35	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -tiazol-2-ilo	-
J-36	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -tiazol-2-ilo	-
J-37	2-(OH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -[1.3.4]tiadiazol-2-ilo	-
J-38	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -[1.3.4]tiadiazol-2-ilo	-
J-39	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -[1.3.4]tiadiazol-2-ilo	-
J-40	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	5-CF ₃ -[1.3.4]tiadiazol-2-ilo	-
J-41	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-42	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-43	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-44	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	S-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-45	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	6-CF ₃ -piridazin-3-ilo	-

[Tabla 20]

Tabla 2 (continuación)

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ² -(R ²⁰) _o	(R ²¹) _r
J-46	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	6-CF ₃ -piridazin-3-ilo	-
J-47	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	6-CF ₃ -piridazin-3-ilo	-
J-48	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	6-CF ₃ -piridazin-3-ilo	-
J-49	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pirimidin-2-ilo	-
J-50	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pirimidin-2-ilo	-
J-51	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pirimidin-2-ilo	-
J-52	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -pirimidin-2-ilo	-
J-53	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -tiazol-2-ilo	-
J-54	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -tiazol-2-ilo	-
J-55	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -tiazol-2-ilo	-
J-56	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -tiazol-2-ilo	-
J-57	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -[1,3,4]-tiadiazol-2-ilo	-
J-58	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -[1,3,4]-tiadiazol-2-ilo	-
J-59	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -[1,3,4]-tiadiazol-2-ilo	-
J-60	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ -[1,3,4]-tiadiazol-2-ilo	-

5

[Tabla 21]

Tabla 2 (continuación)

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ₂ -(R ²⁰) _p	(R ²¹) _r
J-61	2-(CO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-62	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CN-piridin-2-ilo	-
J-63	2-(OEt)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-64	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-65	2-(OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-66	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	6-CN-piridazin-3-ilo	-
J-67	2-OH	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-68	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-69	2-([1,3]dioxolan-2-ilo)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-70	2-(CH ₂ O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-71	2-(CH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-72	2-(CH ₂ OEt)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-73	2-(NHCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-74	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-75	2-(O ^s Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-76	2-(OCO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-77	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-78	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-79	2-(OCH ₂ CH=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-80	2-(OCH ₂ ¹ Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-81	2-(OCH ₂ CH=CCl ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-82	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-83	2-(OCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-84	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-85	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-86	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-87	2-(CO ₂ Et)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-

10

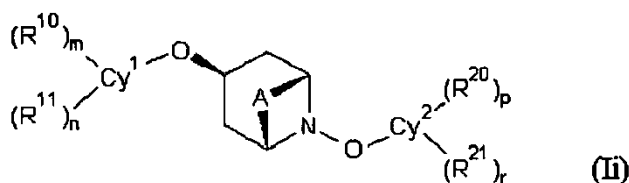
[Tabla 22]

Tabla 2 (continuación)

J-88	2-(OAc)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-89	2-(OCH ₂ [2,2-Cl ₂ -3-F ^c Pr])	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-90	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-91	2-(OCH ₂ CH(OH)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-92	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-93	2-(O ^c Pen)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-94	2-(OCONH ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-

J-88	2-(OAc)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-95	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-96	2-F	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-97	2-(piridin-3-ilo)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-98	2-(S ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-99	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-100	2-(O ⁿ Pr)	4-Cl	C ₃ H ₆	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-101	2-(O ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₄ H ₈	5-CF ₃ -piridin-2-ilo	-
J-102	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-Cl	CH ₂ OCH ₂	5-CF ₃ piridin-2-ilo	-

[Fórmula química 35]



5

[Tabla 23]

Tabla 3

Nº	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
K-5	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-6	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃
K-7	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
K-8	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-9	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-10	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃
K-11	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
K-12	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-18	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-19	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃
K-20	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
K-21	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-22	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-23	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃
K-24	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
K-25	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-30	piridin-2-ilo	-	5-CN	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-31	piridin-2-ilo	-	5-CN	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃
K-32	piridin-2-ilo	-	5-CN	C ₃ H ₆	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
K-33	piridin-2-ilo	-	5-CN	C ₃ H ₆	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-34	piridin-2-ilo	-	5-CN	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
K-35	piridin-2-ilo	-	5-CN	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃
K-36	piridin-2-ilo	-	5-CN	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
K-37	piridin-2-ilo	-	5-CN	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃

10

[Tabla 24]

Tabla 3 (Continuación)

Nº	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
K-38	piridin-3-ilo	2-(O ⁿ Pr)	6-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-39	pirazol-5-ilo	1 ⁻ⁿ Bu	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-40	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ ¹ Pr)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-41	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ ^c Pr)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-42	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ OCH ₂ OCH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-43	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-44	pirazol-5-ilo	1-(CH(OCH ₃)CH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-45	pirazol-5-ilo	1-(CO ₃ ¹ Pr)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-46	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃

Nº	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
K-47	pirazol-5-ilo	1-([1,3]dioxolan-2-ilo)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-48	pirazol-5-ilo	2-(CH ₂ ¹ Pr)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-49	pirazol-5-ilo	2-(CH ₂ ^c Pr)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-50	pirazol-5-ilo	2- ⁿ Bu	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-51	pirazol-5-ilo	2-(CH ₂ OCH ₂ OCH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-52	pirazol-5-ilo	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-53	pirazol-5-ilo	2-(CH(OCH ₃)CH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-54	pirazol-5-ilo	2-(CO ₂ ¹ Pr)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-55	pirazol-5-ilo	2-(CH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-56	pirazol-5-ilo	2-([1.3]dioxolan-2-ilo)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-57	pirazol-5-ilo	1.3-(CH ₃) ₂	-	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-58	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Bu-3-CH ₃	-	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-59	pirazol-5-ilo	1-CH ₃	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-60	pirazol-5-ilo	1-Et	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-61	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Pr	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-62	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Pen	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃

Tabla [25]

Tabla 3 (Continuación)

5

Nº	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
K-63	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Hex	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-64	pirazol-5-ilo	1- ¹ Pr	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-65	pirazol-5-ilo	1- ¹ Bu	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-66	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH=CH ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-67	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CN)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-68	pirazol-5-ilo	1-((CH ₂) ₃ CN)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-69	pirazol-5-ilo	1-Bn	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-70	pirazol-5-ilo	1-(2-Cl-Bn)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-71	pirazol-5-ilo	1-Ph	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-72	pirazol-5-ilo	1-(3-Cl-Ph)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-73	pirazol-5-ilo	1-(3,5-Cl ₂ -Ph)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-74	pirazol-5-ilo	1-(Py-2-ilo)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-75	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Bu	3-CF ₃ 4-Cl	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-76	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Bu	3-CF ₃ 4-Br	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-77	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Bu-4-Ph	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-78	pirazol-5-ilo	1-CH ₃ -4-(CHO)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-79	pirazol-5-ilo	1-CH ₃ -4-(CH=NOCH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-80	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Bu-4-(CHO)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-81	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Bu-3-Ph	-	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-82	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Bu-3-(3-Cl-Ph)	-	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-83	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Bu-3-(4-Cl-Ph)	-	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-84	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Bu-3-(3,4-Cl ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-85	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Bu-3-(3,5-Cl ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃

[Tabla 26]

Tabla 3 (Continuación)

10

Nº	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
K-86	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Bu	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CN
K-87	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Bu	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	5-NO ₂	-
K-88	pirazol-5-ilo	1-(3-CF ₃ -Ph)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-89	pirazol-5-ilo	1-(3-CH ₃ -Ph)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-90	pirazol-5-ilo	1-(Py-2-il)3-(3,4,5-F ₃ -Ph)	-	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-91	pirazol-5-ilo	1-(Py-2-il)3-(3,5-F ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-92	pirazol-5-ilo	1-(3-Cl-Py-2-ilo)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-93	pirazol-5-ilo	1-(6-CH ₃ -Py-2-ilo)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-94	pirazol-5-ilo	1-(4-CF ₃ -tiazol-2-ilo)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-95	pirazol-5-ilo	1.4-(CH ₃) ₂	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-96	pirazol-5-ilo	1-CH ₃ -4-(CH ₂ OH)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-97	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Bu-4-CH ₃	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃

N°	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
K-98	pirazol-5-ilo	1-nBu 3-(3.5-(CF ₃) ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-99	pirazol-5-ilo	1-nBu-3-(3.5-F ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-100	pirazol-5-ilo	1-nBu-3-(3.4.5-F ₃ -Ph)	-	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-101	pirazol-5-ilo	1.4-(CH ₃) ₂ -3-(CO ₂ Et)	-	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-102	pirazol-5-ilo	1-CH ₃	4-Cl ₃ -CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-103	pirazol-5-ilo	-	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-104	pirazol-5-ilo	1-(C(O) ^c Bu)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-105	pirazol-5-ilo	1-(Py-2-il)-3-(3.5-Cl ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-106	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ OCH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃

[Tabla 27]

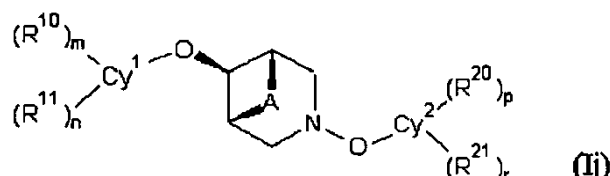
N°	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
K-107	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ OEt)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-108	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH ₂ OCH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-109	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH ₂ OEt)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-110	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH(OEt) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-111	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-112	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH ₂ CH(OEt) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-113	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ ([1,3]dioxolan-2-ilo))	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-114	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ (tetrahydro-furan-2-ilo))	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-115	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH ₂ ([1,3]dioxolan-2-ilo))	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-116	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH ₂ ([1,3]dioxolan-2-ilo))	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-117	pirazol-5-ilo	1-Ac	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-118	pirazol-5-ilo	1-(C(=O)Et)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-119	pirazol-5-ilo	1-(C(=O) ⁿ Pr)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-120	pirazol-5-ilo	1-(C(=O) ⁿ Bu)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-121	pirazol-5-ilo	1-(C(=O)Ph)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-122	pirazol-5-ilo	1-(CO ₂ CH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-123	pirazol-5-ilo	1-(CO ₂ Et)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-124	pirazol-5-ilo	1-(CO ₂ ⁿ Pr)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-125	pirazol-5-ilo	1-(CO ₂ ⁿ Bu)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-126	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CHO)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-127	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH ₂ CHO)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃

5 [Tabla 28]

Tabla 3 (Continuación)

N°	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
K-128	pirazol-5-ilo	1-CH ₃ -4-(CH=NOH)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-129	pirazol-5-ilo	1-CH ₃ -4-(CH=NOEt)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-130	pirazol-5-ilo	3-(3.5-F ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-131	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH(OCH ₃) ₂)-3-(3.5-F ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-132	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ ([1,3]dioxolan-2-ilo))-3-(3.5-F ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-133	pirazol-5-ilo	1-(Py-2-ilo)-3-(tiofen-2-ilo)	-	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-134	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-135	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH ₂ CH(Et) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
K-136	pirazol-5-ilo	1- ¹ Pen	3-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃

10 [Fórmula química 36]



[Tabla 29]

N°	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
L-5	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ Pr)	4-CF ₃

Nº	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
L-6	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃
L-7	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
L-8	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
L-9	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
L-10	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
L-11	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
L-12	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
L-18	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
L-19	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃
L-20	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
L-21	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
L-22	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
L-23	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃
L-24	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
L-25	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃

[Tabla 30]

Tabla 4 (Continuación)

5

Nº	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
L-26	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(CO ₂ CH ₃)	4-CF ₃
L-27	piridin-2-ilo	-	5-CN	C ₃ H ₆	F	2-(OCH ₂ Pr)	4-CF ₃
L-28	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OEt)	4-CF ₃
L-29	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃
L-30	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃
L-31	piridazin-3-ilo	-	6-CN	C ₃ H ₆	F	2-(OCH ₂ Pr)	4-CF ₃
L-32	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-OH	4-CF ₃
L-33	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃
L-34	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-([1,3]dioxolan-2-ilo)	4-CF ₃
L-35	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(CH ₂ O ⁱ Pr)	4-CF ₃
L-36	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(CH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃
L-37	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(CH ₂ OEt)	4-CF ₃
L-38	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(NHCH ₂ Pr)	4-CF ₃
L-39	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(O ⁱ Pr)	4-CF ₃
L-40	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(O ^s Bu)	4-CF ₃
L-41	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OCO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
L-42	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃
L-43	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃
L-44	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OCH ₂ CH=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃
L-45	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OCH ₂ ⁱ Bu)	4-CF ₃
L-46	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OCH ₂ CH=CCl ₂)	4-CF ₃
L-47	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃
L-48	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂)	4-CF ₃
L-49	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-CF ₃
L-50	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃

[Tabla 31]

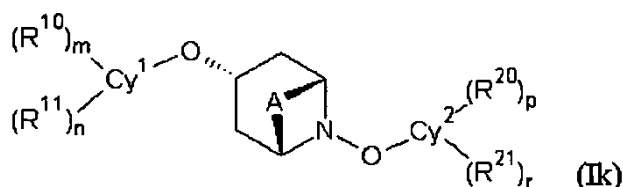
Tabla 4 (Continuación)

10

Nº	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
L-51	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-CF ₃
L-52	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(CO ₂ Et)	4-CF ₃
L-53	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OAc)	4-CF ₃
L-54	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OCH ₂ [2,2-Cl ₂ -3-F ^c Pr])	4-CF ₃
L-55	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃
L-56	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OCH ₂ CH(OH)CH ₃)	4-CF ₃
L-57	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
L-58	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(O ^c Pen)	4-CF ₃
L-59	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OCONH ⁱ Pr)	4-CF ₃
L-60	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃
L-61	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-F	4-CF ₃

Nº	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
L-62	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(piridin-3-ilo)	4-CF ₃
L-63	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(S ⁿ Pr)	4-CF ₃
L-64	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃
L-65	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(O ⁿ Pr)	4-Cl
L-66	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₄ H ₈	F	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃
L-67	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	F	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-Cl

[Fórmula química 37]



5

[Tabla 32]

Tabla 5

Nº	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
M-5	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-6	Ph	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-7	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-8	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-9	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-10	Ph	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-11	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₂)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-12	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-17	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃
M-18	Ph	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃
M-19	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃
M-20	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃
M-21	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃
M-22	Ph	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃
M-23	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃
M-24	Ph	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃

10

[Tabla 33]

Tabla 5 (Continuación)

Nº	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
M-25	F	2-(CO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-26	F	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CN
M-27	F	2-(OEt)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-28	F	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-29	F	2-(OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-30	F	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridazin-3-ilo	-	6-CN
M-31	F	2-OH	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-32	F	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-33	F	2-([1,3]dioxolan-2-ilo)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-34	F	2-(CH ₂ O ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-35	F	2-(CH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-36	F	2-(CH ₂ OEt)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-37	F	2-(NHCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-38	F	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-39	F	2-(O ^s Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-40	F	2-(OCO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-41	F	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃

15

[Tabla 34]

Tabla 5 (Continuación)

Nº	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ₂	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
M-42	F	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-43	F	2-(OCH ₂ CH=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-44	F	2-(OCH ₂ ^t Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-45	F	2-(OCH ₂ CH=CCl ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-46	F	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-47	F	2-(OCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-48	F	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-49	F	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-50	F	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-51	F	2-(CO ₂ Et)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-52	F	2-(OAc)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-53	F	2-(OCH ₂ [2,2-Cl ₂ -3-F ^c Pr])	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-54	F	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-55	F	2-(OCH ₂ CH(OH)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-56	F	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-57	F	2-(O ^c Pen)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-58	F	2-(OCONH ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃

[Tabla 35]

5

Tabla 5 (Continuación)

Nº	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
M-59	F	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-60	F	2-F	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-61	F	2-(piridin-3-ilo)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-62	F	2-(S ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-63	F	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-64	F	2-(O ⁿ Pr)	4-Cl	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-65	F	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₄ H ₈	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-66	F	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-Cl	CH ₂ OCH ₂	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-67	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
M-68	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃
M-69	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
M-70	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
M-71	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	F	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
M-72	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	F	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃
M-73	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	F	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
M-74	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	F	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
M-75	Piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃

[Tabla 36]

10

Tabla 5 (Continuación)

Nº	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
M-76	Piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃
M-77	Piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
M-78	Piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	F	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃
M-79	Piridazin-3-	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	F	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃

N°	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
	ilo						
M-80	Piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	F	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃
M-81	Piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	F	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
M-82	Piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	F	2-(CO ₂ ^f Pr)	4-CF ₃
M-83	Pirazol-5-ilo	1- ⁿ Bu	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-84	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-85	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Pen	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-86	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Hex	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-87	pirazol-5-ilo	1- ⁱ Pr	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-88	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH=CH ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-89	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CN)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-90	pirazol-5-ilo	1-Bn	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-91	pirazol-5-ilo	1-(Py ^z -ilo)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃

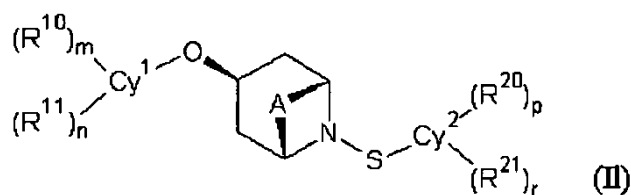
[Tabla 37]

Tabla 5 (Continuación)

N°	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
M-92	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Bu-3-(3,5-(CF ₃) ₂ -F)	-	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-93	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Bu-3-(3,5-F ₂ -F)	-	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-94	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Bu-3-(3,4,5-F ₃ -F)	-	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-95	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ OCH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-96	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ OEt)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-97	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH ₂ OCH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-98	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH ₂ OEt)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-99	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH(OEt) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-100	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-101	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH ₂ CH(OEt) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-102	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ ([1,3]dioxolan-2-ilo))	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
M-103	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH(OCH ₃) ₂)-3-(3,5-F ₂ -F)	-	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃

5

[Fórmula química 38]



10 [Tabla 38]

Tabla 6

N°	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
N-1	Ph	2-(OCH ₂ ^f Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-2	Ph	2-(OCH ₂ ^f Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-3	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-4	Ph	2-(CO ₂ ^f Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-5	Ph	2-(OCH ₂ ^f Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-6	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-7	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-8	Ph	2-(CO ₂ ^f Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-9	Ph	2-(OCH ₂ ^f Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃
N-10	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃
N-11	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃
N-12	Ph	2-(CO ₂ ^f Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₅	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃
N-13	Ph	2-(OCH ₂ ^f Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃

N°	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
N-14	Ph	2-(OCH ₂ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃
N-15	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃ CH ₃))	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃

Tabla 39

Tabla 6 (Continuación)

5

N°	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
N-16	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃
N-17	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
N-18	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃
N-19	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
N-20	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
N-21	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
N-22	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃
N-23	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
N-24	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
N-25	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
N-26	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃
N-27	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
N-28	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	C ₃ H ₆	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
N-29	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
N-30	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(OCH ₂ ⁶ Pr)	4-CF ₃

[Tabla 40]

Tabla 6 (Continuación)

10

N°	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
N-31	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	CF ₂ OCH ₂	Ph	2-(CH ₂ OC)-(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃
N-32	piridazin-3-ilo	-	6-CF ₃	CH ₂ OCH ₂	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃
N-33	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Bu	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-34	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-35	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Pen	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-36	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Hex	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-37	pirazol-5-ilo	1-Pr	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-38	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH=CH ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-39	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CN)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-40	pirazol-5-ilo	1-Bn	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-41	pirazol-5-ilo	1-(Py-2-ilo)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-42	pirazol-5-ilo	1- _n Bu 3-(3,5-(CF ₃) ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-43	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Bu 3-(3,5-F ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-44	pirazol-5-ilo	1- ⁿ Bu 3-(3,4,5-F ₃ -Ph)	-	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-45	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ OCH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃

[Tabla 41]

Tabla 6 (Continuación)

15

N°	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A	Cy ²	(R ²¹) _r	(R ²⁰) _p
N-46	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ OEt)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-47	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH ₂ OCH ₃)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-48	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH ₂ OEt)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-49	pirazol-5-ilo	1-CH ₂ CH(OEt) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-50	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-51	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH ₂ CH(OEt) ₂)	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-52	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ [(1,3]dioxolan-2-ilo))	3-CF ₃	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃
N-53	pirazol-5-ilo	1-(CH ₂ CH(OCH ₃) ₂) 3-(3,5-F ₂ -Ph)	-	C ₃ H ₆	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃

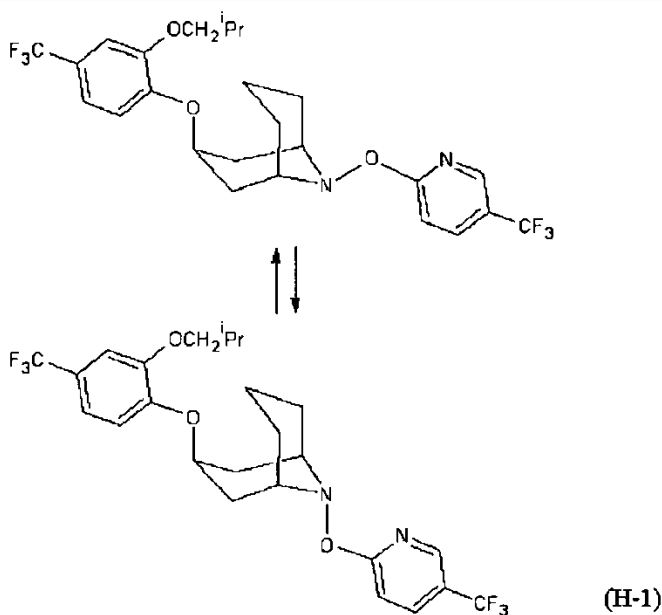
Más abajo se muestran las constantes físicas de algunos de los compuestos mostrados en las tablas 1-6. Además, "vis" significa "aceite viscoso".

Compuesto H-1: vis; RMN ^1H (CDCl_3 , δ ppm, temperatura de medida 25°C) 8,49 (s, 1H), 7,90-7,86 (m, 1H), 7,39 (d, 0,8H), 7,26 (d, 0,2H), 7,15 (d, 1H), 7,08 (s, 1H), 6,91 (d, 1H), 4,91-4,89 (m, 0,8H), 4,65 (m, 0,2H), 3,78 (d, 2H), 3,59 (brs, 2H), 2,76-2,30 (m, 3H), 2,16-2,04 (m, 3H), 1,83-1,67 (m, 4H), 1,41-1,37 (m, 1H), 1,07 (similar a d, 6H)

- 5 Además, se estima que el Compuesto H-1 es una mezcla de dos compuestos, que son isómeros conformacionales y están representados por las siguientes fórmulas. Uno de los compuestos es un compuesto en el que la distancia entre la posición 7 de metileno y la posición 9 de piridiloxi en el anillo de 9-azabicyclo[3.3.1]nonano es más pequeña, y el otro es un compuesto en el que la distancia entre la posición 7 de metileno y la posición 9 de piridil oxilo en el anillo de 9-azabicyclo[3.3.1]nonano es más grande.

10

[Fórmula química 39]



- 15 Compuesto H-2: vis; RMN ^1H (CDCl_3 , δ ppm, temperatura de medida $20,2^\circ\text{C}$) 8,49 (s, 1H), 7,88 (dd, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,17 (d, 1H), 7,08 (s, 1H), 6,95 (d, 1H), 5,00-4,92 (m, 0,8H), 4,67 (m, 0,2H), 3,87 (d, 2H), 3,59 (brs, 2H), 2,75-2,41 (m, 3H), 2,14-2,05 (m, 2H), 1,83-1,71 (m, 3H), 1,43-1,24 (m, 3H), 0,66-0,60 (m, 2H), 0,39-0,35 (m, 2H)

- 20 Compuesto H-5: vis; RMN ^1H (CDCl_3 , δ ppm, temperatura de medida: $22,7^\circ\text{C}$) 7,77 (d, 1H), 7,68 (d, 1H), 7,17 (d, 1H), 7,08 (s, 1H), 6,91 (d, 1H), 4,95-4,90 (m, 0,7H), 4,63 (m, 0,3H), 3,78 (d, 2H), 3,62 (brs, 2H), 2,80-2,43 (m, 2H), 2,19-2,03 (m, 2H), 1,85-1,75 (m, 2H), 1,41-1,37 (m, 1H), 1,05 (d, 6H)

- 25 Compuesto H-41: vis; RMN ^1H (CDCl_3 , δ ppm, temperatura de medida: $20,7^\circ\text{C}$) 8,53 (d,1H), 7,90 (dd, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,16 (d, 1H), 7,08 (s, 1H), 6,90 (s, 1H), 4,90-4,85 (m, 0,7H), 4,60 (m, 0,3H), 3,78 (d, 2H), 3,58 (brs, 2H), 2,74-2,40 (m, 3H), 2,18-2,05 (m, 3H), 1,82-1,72 (m, 3H), 1,41-1,34 (m, 2H), 1,06 (d, 6H)

- 30 Compuesto H-42: vis; RMN ^1H (CDCl_3 , δ ppm, temperatura de medida: $22,3^\circ\text{C}$) 8,49 (s,1H), 7,88 (dd, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,17 (d, 1H), 7,09 (s, 1H), 6,95 (d, 1H), 4,98-4,94 (m, 0,8H), 4,60 (m, 0,2H), 4,10 (q, 2H), 3,59 (brs, 2H), 2,74-2,40 (m, 3H), 2,11-2,05 (m, 2H), 1,81-1,69 (m, 3H), 1,49-1,37 (m, 5H)

- Compuesto H-43: vis; RMN ^1H (CDCl_3 , δ ppm, temperatura de medida: $21,3^\circ\text{C}$) 8,49 (s,1H), 7,87 (dd, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,17 (d, 1H), 7,09 (s, 1H), 6,92 (d, 1H), 4,95-4,90 (m, 0,9H), 4,60 (m, 0,1H), 3,98 (t, 2H), 3,59 (brs, 2H), 2,75-2,40 (m, 3H), 2,14-2,04 (m, 2H), 1,89-1,69 (m, 6H), 1,41-1,36 (m, 1H), 1,08 (t, 3H)

- 35 Compuesto K-8: vis; RMN ^1H (CDCl_3 , δ ppm, temperatura de medida: $21,0^\circ\text{C}$) 8,44 (d,1H), 8,04 (d, 1H), 7,79-7,63 (m, 3H), 6,81 (d, 1H), 5,78 (m, 0,7H), 5,50 (m, 0,3H), 5,32-5,24 (m, 1H), 3,57 (brs, 2H), 2,78-2,68 (m, 2H), 2,42-1,90 (m, 4H), 1,77-1,60 (m, 2H), 1,45-1,26 (m, 8H)

- 40 Compuesto K-12: vis; RMN ^1H (CDCl_3 , δ ppm, temperatura de medida: $20,8^\circ\text{C}$) 8,43 (s,1H), 8,07 (d, 1H), 7,76 (dd, 1H), 7,68 (d, 1H), 7,26 (s, 1H), 6,84 (d, 1H), 5,69-5,64 (m, 0,7H), 5,51 (m, 0,3H), 5,33-5,24 (m, 1H), 4,47 (d, 0,5H), 4,00 (dd, 3,5H), 3,54-3,27 (d, d, d, 2H), 2,85-2,68 (m, 2H), 2,27 (d, 0,3H), 1,91 (d, 1,7H), 1,41 (d, 6H)

ES 2 555 163 T3

- Compuesto H-51: vis; RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,2°C) 8,49 (s, 1H), 7,88 (dd, 1H), 7,40-7,35 (d,d, total 2H), 7,26 (s, 1H), 6,98 (d, 1H), 5,22 (s, 2H), 5,06-5,01 (m, 1H), 3,62 (brs, 2H), 3,53 (s, 3H), 2,75-2,65 (m, 2H), 2,50-2,39 (m, 1H), 2,14-2,04 (m, 2H), 1,79-1,67 (m, 3H), 1,45-1,33 (m, 2H)
- 5 Compuesto H-52: punto de fusión [107-110°C]
- Compuesto H-53: punto de fusión [141-144°C]
- 10 Compuesto H-54: vis; RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,3°C) 8,49 (s, 1H), 7,88 (dd, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,17 (d, 1H), 7,08 (s, 1H), 6,92 (d, 1H), 4,93-4,91 (m, 1H), 4,01 (t, 2H), 3,59 (brs, 2H), 2,74-2,40 (m, 3H), 2,14-2,05 (m, 2H), 1,86-1,74 (m, 5H), 1,70-1,49 (m, 2H), 1,41-1,39 (m, 2H), 1,01 (t, 3H)
- 15 Compuesto H-55: vis; RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,3°C) 8,50 (s, 1H), 7,88 (dd, 1H), 7,80 (s, 1H), 7,58 (d, 1H), 7,36 (d, 1H), 6,99 (d, 1H), 6,16 (s, 1H), 5,12-5,09 (m, 1H), 4,19-4,01 (m, 4H), 3,64 (brs, 2H), 2,77-2,03 (m, 3H), 1,80-1,66 (m, 3H), 1,47-1,35 (m, 2H)
- 20 Compuesto H-56: RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 22,1°C) 8,51 (s, 1H), 7,89 (dd, 1H), 7,71 (s, 1H), 7,49 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 6,92 (d, 1H), 5,08-5,04 (m, 1H), 4,57 (s, 2H), 3,77-3,67 (m, brs, total 3H), 2,79-2,69 (m, 2H), 2,44-2,02 (m, 3H), 1,80-1,59 (m, 3H), 1,48-1,44 (m, 2H), 1,25 (d, 6H)
- 25 Compuesto H-57: vis; RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,3°C) 8,50 (s, 1H), 7,88 (dd, 1H), 7,66 (s, 1H), 7,51 (d, 1H), 7,39 (d, 1H), 6,93 (d, 1H), 5,07-5,03 (m, 1H), 4,52 (s, 2H), 3,65 (brs, 2H), 3,50 (s, 3H), 2,79-2,68 (m, 2H), 2,40-2,02 (m, 3H), 1,80-1,61 (m, 3H), 1,40-1,30 (m, 2H)
- 30 Compuesto H-58: vis; RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,3°C) 8,50 (s, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,69 (s, 1H), 7,50 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 6,93 (d, 1H), 5,04 (m, 1H), 4,57 (s, 2H), 3,66-3,58 (brs, q, total 4H), 2,78-2,68 (m, 2H), 2,40-2,04 (m, 3H), 1,79-1,60 (m, 3H), 1,40-1,33 (m, 2H), 1,26 (t, 3H)
- 35 Compuesto H-59: vis; RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,3°C) 8,50 (s, 1H), 7,88 (dd, 1H), 7,36 (s, 1H), 6,87 (d, 1H), 6,78 (s, 1H), 6,74 (d, 1H), 5,05-5,01 (m, 1H), 4,41 (brt, 1H), 3,64 (brs, 2H), 2,98 (t, 2H), 2,80-2,70 (m, 2H), 2,44-1,90 (m, 4H), 1,80-1,65 (m, 3H), 1,49-1,43 (m, 2H), 1,01 (d, 6H)
- 40 Compuesto H-60: vis; RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,2°C) 8,49 (s, 1H), 7,87 (dd, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,18 (d, 1H), 7,13 (s, 1H), 6,94 (d, 1H), 4,97-4,92 (m, 1H), 4,59-4,50 (m, 1H), 3,59 (brs, 2H), 2,74-2,41 (m, 3H), 2,14-2,05 (m, 2H), 1,81-1,69 (m, 3H), 1,42-1,35 (m,d, total 8H)
- 45 Compuesto H-61: vis; RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,7°C) 8,49 (s, 1H), 7,87 (dd, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,16 (d, 1H), 7,10 (d, 1H), 6,93 (d, 1H), 4,95-4,91 (m, 1H), 4,36-4,30 (m, 1H), 3,58 (brs, 2H), 2,74-2,40 (m, 3H), 2,13-2,04 (m, 2H), 1,81-1,56 (m, 5H), 1,41-1,33 (m, 2H), 1,31 (d, 3H), 1,00 (t, 3H)
- 50 Compuesto H-62: vis; RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,6°C) 8,49 (s, 1H), 7,88 (dd, 1H), 7,48 (d, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,36 (s, 1H), 7,06 (d, 1H), 5,09-5,06 (m, 1H), 5,01-4,93 (m, 1H), 3,62 (brs, 2H), 2,76-2,66 (m, 2H), 2,40-2,05 (m, 3H), 1,77-1,61 (m, 3H), 1,38 (d, 6H), 1,45-1,33 (m, 2H)
- 55 Compuesto H-63: vis; RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 19,7°C) 8,50 (s, 1H), 7,89 (d, 1H), 7,46 (d, 1H), 7,41-7,38 (d, s, total 2H), 7,19-7,02 (m, 1H), 5,11-5,04 (m, 1H), 4,45 (d, 1H), 3,63 (brs, 2H), 2,76-2,66 (m, 2H), 2,44-2,20 (m, 1H), 2,11-2,05 (m, 2H), 1,80-1,63 (m, 3H), 1,49-1,44 (m, 2H)
- 60 Compuesto H-64: vis; RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 22,2°C) 8,49 (s, 1H), 7,88 (dd, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,20 (d, 1H), 7,10 (s, 1H), 6,96 (d, 1H), 6,11-6,02 (m, 1H), 5,49-5,28 (m, 2H), 5,00-4,99 (m, 1H), 4,60 (d, 2H), 3,61 (brs, 2H), 2,75-2,30 (m, 3H), 1,82-1,69 (m, 3H), 1,45-1,35 (m, 2H)
- 65 Compuesto H-65: vis; RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 22,0°C) 8,49 (s, 1H), 7,87 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,17 (d, 1H), 7,10 (s, 1H), 6,96 (d, 1H), 5,47 (t, 2H), 5,01-4,95 (m, 1H), 4,58 (d, 2H), 3,59 (brs, 2H), 2,73-2,40 (m, 3H), 2,14-2,02 (m, 2H), 1,77 (d, 6H), 1,79-1,68 (m, 3H), 1,41-1,37 (m, 2H)
- 70 Compuesto H-66: vis; RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,7°C) 8,49 (s, 1H), 7,88 (dd, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,16 (d, 1H), 7,07 (s, 1H), 6,88 (d, 1H), 4,87-4,82 (m, 1H), 3,65 (s, 2H), 3,58 (brs, 2H), 2,78-2,63 (m, 2H), 2,50-2,41 (m, 1H), 2,17-2,05 (m, 2H), 1,82-1,71 (m, 3H), 1,43-1,36 (m, 2H), 1,08 (s, 9H)
- 75 Compuesto H-67: vis; RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,7°C) 8,49 (s, 1H), 7,88 (dd, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,24 (d, 1H), 7,11 (s, 1H), 6,97 (d, 1H), 6,18 (t, 1H), 5,08-5,00 (m, 1H), 4,72 (d, 2H), 3,62 (brs, 2H), 2,74-2,64 (m, 2H), 2,49-2,36 (m, 1H), 2,15-2,04 (m, 2H), 1,80-1,66 (m, 3H), 1,45-1,33 (m, 2H)

ES 2 555 163 T3

- Compuesto H-68: vis; RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,7°C) 8,49 (s, 1H), 7,87 (dd, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,27-7,25 (d, s, total 2H), 6,98 (d, 1H), 5,09-5,01 (m, 1H), 4,77 (s, 2H), 3,63 (brs, 2H), 2,74-2,59 (m, 2H), 2,54 (s, 1H), 2,53-2,35 (m, 1H), 2,13-2,01 (m, 2H), 1,81-1,67 (m, 3H), 1,45-1,33 (m, 2H)
- 5 Compuesto H-69: vis; RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,9°C) 8,49 (s, 1H), 7,87 (dd, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,17 (d, 1H), 7,10 (s, 1H), 6,93 (d, 1H), 5,14 (s, 1H), 5,00 (s, 1H), 4,98-4,93 (m, 1H), 4,48 (s, 2H), 3,59 (brs, 2H), 2,76-2,40 (m, 3H), 2,15-2,03 (m, 2H), 1,85 (s, 3H), 1,80-1,70 (m, 3H), 1,43-1,34 (m, 2H)
- 10 Compuesto H-70: vis; RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,5°C) 8,49 (s, 1H), 7,88 (dd, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,16 (d, 1H), 7,07 (s, 1H), 6,90 (d, 1H), 4,90-4,88 (m, 1H), 3,89-3,77 (m, 2H), 3,59 (brs, 2H), 2,76-2,30 (m, 3H), 2,20-2,05 (m, 2H), 1,92-1,55 (m, 6H), 1,40-1,26 (m, 2H), 1,06 (d, 3H), 0,97 (t, 3H)
- 15 Compuesto H-71: vis; RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,8°C) 8,50 (s, 1H), 7,89 (dd, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,30 (s, 1H), 7,06 (d, 1H), 5,17-5,13 (m, 1H), 4,86 (s, 2H), 3,68 (brs, 2H), 2,77-2,66 (m, 2H), 2,46-2,02 (m, 3H), 1,80-1,62 (m, 3H), 1,50-1,45 (m, 2H)
- 20 Compuesto H-72: RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,1°C) 8,49 (s, 1H), 7,88 (dd, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,32 (s, 1H), 7,25 (d, 1H), 6,98 (d, 1H), 5,33 (q, 1H), 5,04-5,02 (m, 1H), 3,63 (brs, 2H), 3,44 (s, 3H), 2,76-2,65 (m, 2H), 2,50-2,40 (m, 1H), 2,17-2,07 (m, 2H), 1,80-1,68 (m, 3H), 1,53 (d, 3H), 1,50-1,30 (m, 2H)
- Compuesto H-73: punto de fusión [87-89°C]
- Compuesto H-74: punto de fusión [93-97°C]
- 25 Compuesto H-75: punto de fusión [102-105°C]
- Compuesto H-76: punto de fusión [114-117°C]
- 30 Compuesto H-77: RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,3°C) 8,50 (s, 1H), 7,88 (dd, 1H), 7,48 (d, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,32 (s, 1H), 7,04 (d, 1H), 5,30-5,01 (m, 1H), 3,62 (brs, 2H), 2,77-2,67 (m, 2H), 2,46-2,10 (m, 3H), 2,26 (s, 3H), 1,77-1,41 (m, 5H)
- 35 Compuesto H-78: RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,2°C) 8,48 (s, 1H), 7,86 (dd, 1H), 7,38-7,23 (m, 8H), 6,97 (d, 1H), 4,99-4,95 (m, 1H), 4,50 (q, 1H), 4,37 (d, 2H), 3,56 (brs, 2H), 2,73 (d, 1H), 2,73-2,64 (m, 2H), 2,54-2,47 (m, 1H), 2,09-1,99 (m, 2H), 1,74-1,68 (m, 3H), 1,47-1,35 (m, 2H)
- 40 Compuesto H-79: RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,8°C) 8,50 (s, 1H), 7,88 (dd, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,28 (d, 1H), 7,04 (s, 1H), 6,98 (d, 1H), 5,07-5,04 (m, 1H), 4,57 (s, 2H), 3,60 (brs, 2H), 2,78-2,35 (m, 3H), 2,35 (s, 3H), 2,27-2,07 (m, 2H), 1,79-1,61 (m, 3H), 1,58-1,40 (m, 2H)
- 45 Compuesto H-80: RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,4°C) 8,49 (s, 1H), 7,88 (dd, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,21 (d, 1H), 7,14 (s, 1H), 6,97 (d, 1H), 5,14-5,10 (m, 1H), 4,23-4,19 (m, 1H), 4,09-4,03 (m, 1H), 3,87-3,82 (m, 1H), 3,63 (brs, 2H), 2,96 (d, 1H), 2,75-2,41 (m, 3H), 2,13-2,06 (m, 2H), 1,79-1,60 (m, 3H), 1,4
- 50 Compuesto H-81: RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 22,0°C) 8,49 (s, 1H), 7,88 (dd, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,18 (d, 1H), 7,10 (s, 1H), 6,92 (d, 1H), 4,95-4,93 (m, 1H), 4,04-4,01 (m, 1H), 3,94-3,89 (m, 1H), 3,78-3,73 (m, 1H), 3,60 (brs, 2H), 3,46 (s, 3H), 2,76-2,50 (m, 3H), 2,11-2,04 (m, 2H), 1,80-1,68 (m, 3H), 1,4
- 55 Compuesto H-82: RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,7°C) 8,49 (s, 1H), 7,87 (dd, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,15 (d, 1H), 7,13 (s, 1H), 6,92 (d, 1H), 4,90-4,84 (m, 1H), 4,83-4,79 (m, 1H), 3,58 (brs, 2H), 2,74-2,60 (m, 2H), 2,41-2,08 (m, 3H), 1,91-1,63 (m, 11H), 1,38-1,34 (m, 2H)
- 60 Compuesto H-83: RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 21,2°C) 8,49 (s, 1H), 7,87 (dd, 1H), 7,44 (d, 1H), 7,38-7,36 (m, 2H), 7,03 (d, 1H), 5,07 (m, 1H), 4,95 (d, 1H), 3,92-3,86 (m, 1H), 3,62 (brs, 2H), 2,75-2,65 (m, 2H), 2,44-2,01 (m, 3H), 1,77-1,61 (m, 3H), 1,43-1,34 (m, 2H). 1,30 (d, 6H)
- 65 Compuesto H-84: punto de fusión [127-130°C]
- 60 Compuesto H-85: RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 23,3°C) 8,48 (s, 1H), 7,86 (dd, 1H), 7,58-7,52 (m, 4H), 7,49-7,33 (m, 4H), 7,03 (d, 1H), 5,02 (m, 1H), 3,53 (brs, 2H), 2,71-2,61 (m, 2H), 2,25-1,89 (m, 3H), 1,62-1,51 (m, 3H), 1,50-1,40 (m, 2H).
- 65 Compuesto H-86: RMN ¹H (CDCl₃, δ ppm, temperatura de medida: 23,1°C) 8,79 (s, 1H), 8,59 (t, 1H), 8,49 (s, 1H), 7,89-7,81 (m, 1H), 7,65-7,57 (dd, s, total 2H), 7,38-7,34 (m, 2H), 7,09 (d, 1H), 5,11 (m, 1H), 3,56 (brs, 2H), 2,74-2,64 (m, 2H), 2,25-1,90 (m, 3H), 1,70-1,54 (m, 3H), 1,26-1,00 (m, 2H).

Compuesto H-87: RMN ^1H (CDCl_3 , δ ppm, temperatura de medida: 21,8°C) 8,50 (s, 1H), 7,89 (dd, 1H), 7,41-7,36 (d, d, s, total 3H), 6,90 (d, 1H), 5,07-5,05 (m, 1H), 3,64 (brs, 2H), 2,87 (t, 2H), 2,75-2,68 (m, 2H), 2,45-2,08 (m, 3H), 1,83-1,42 (m, 7H), 1,08 (t, 3H)

5 Compuesto H-88: RMN ^1H (CDCl_3 , δ ppm, temperatura de medida: 22,0°C) 8,33 (s, 1H), 7,74 (dd, 1H), 7,58 (d, 1H), 7,47 (s, 1H), 7,32 (d, 1H), 7,18 (d, 1H), 5,80-5,66 (m, 1H), 5,30-5,05 (m, 3H), 3,68 (brs, 2H), 2,97-2,85 (m, 2H), 2,77-2,39 (m, 2H), 2,39-2,00 (m, 3H), 1,79-1,26 (m, 5H)

10 Compuesto H-89: RMN ^1H (CDCl_3 , δ ppm, temperatura de medida: 23,5°C) 8,48 (s, 1H), 7,87 (dd, 1H), 7,37 (d, 1H), 6,91-6,83 (m, 3H), 4,82-4,77 (m, 1H), 3,94 (t, 2H), 3,57 (brs, 2H), 2,69-2,30 (m, 3H), 2,12-2,04 (m, 2H), 1,89-1,60 (m, 5H), 1,41-1,32 (m, 2H), 1,07 (t, 3H)

15 Compuesto H-90: RMN ^1H (CDCl_3 , δ ppm, temperatura de medida: 20,8°C) 8,49 (s, 1H), 7,91 (dd, 1H), 7,48 (d, 1H), 7,17 (d, 1H), 7,08 (s, 1H), 6,99 (d, 1H), 5,02-4,98 (m, 1H), 3,98 (t, 2H), 3,60-3,58 (m, 2H), 2,58-2,49 (m, 2H), 2,30-2,20 (m, 2H), 1,91-1,75 (m, 7H), 1,07 (t, 3H)

20 Compuesto H-29: RMN ^1H (CDCl_3 , δ ppm, temperatura de medida: 20,4°C) 8,50 (s, 1H), 7,89 (dd, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,16 (d, 1H), 7,09 (s, 1H), 7,03 (d, 1H), 4,97-4,95 (m, 1H), 3,97 (q, 4H), 3,79 (d, 2H), 3,58-3,33 (ddd, 2H), 2,74-2,65 (m, 2H), 2,19-2,12 (m, 1H), 1,98 (brd, 2H), 1,06 (d, 6H)

Compuesto J-42: punto de fusión [170-172°C]

25 Compuesto K-38: RMN ^1H (CDCl_3 , δ ppm, temperatura de medida: 21,5°C) 8,49 (s, 1H), 7,88 (dd, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,19 (d, 1H), 7,07 (d, 1H), 4,98-4,93 (m, 1H), 4,34 (t, 2H), 3,60 (brs, 2H), 2,75-2,30 (m, 3H), 2,14-2,07 (m, 2H), 1,86-1,67 (m, 5H), 1,44-1,38 (m, 2H), 1,04 (t, 3H)

Compuesto K-39: RMN ^1H (CDCl_3 , δ ppm, temperatura de medida: 22,3°C) 8,51 (s, 1H), 7,90 (dd, 1H), 7,38 (d, 1H), 5,78 (s, 1H), 5,10-4,80 (m, 1H), 4,00 (t, 2H), 3,66 (brs, 2H), 2,75-1,20 (m, 14H), 0,97 (t, 3H)

30 Compuesto N-1: RMN ^1H (CDCl_3 , δ ppm, temperatura de medida: 20,8°C) 8,64 (s, 1H), 7,85-7,81 (m, 1H), 7,74-7,69 (m, 1H), 7,17 (d, 1H), 7,08 (s, 1H), 6,92 (d, 1H), 4,69 (m, 1H), 3,80 (d, 2H), 3,36 (brs, 2H), 2,61-2,56 (m, 2H), 2,17-2,05 (m, 3H), 1,91-1,86 (m, 1H), 1,65-1,53 (m, 3H), 1,27-1,26 (m, 2H), 1,08 (d, 6H)

35 Compuesto H-92: RMN ^1H (CDCl_3 , δ ppm, temperatura de medida: 21,3°C) 8,50 (s, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,31 (d, 1H), 6,84 (d, 1H), 5,11-5,07 (m, 0,8H), 4,75 (m, 0,2H), 3,88 (s, 3H), 3,66 (brs, 2H), 2,77-2,67 (m, 4H), 2,50-2,25 (m, 1H), 2,13-2,04 (m, 3H), 1,80-1,48 (m, 6H), 1,02 (t, 3H)

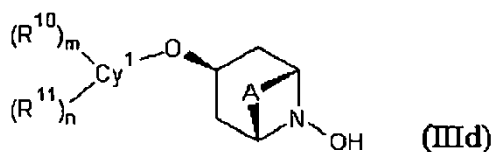
40 Compuesto H-93: RMN ^1H (CDCl_3 , δ ppm, temperatura de medida: 20,2°C) 8,49 (s, 1H), 7,87 (dd, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,05 (d, 1H), 6,85 (d, 1H), 5,20-4,80 (m, 2H), 3,61 (brs, 2H), 3,52-3,44 (m, 1H), 3,01-2,90 (m, 1H), 2,70-2,33 (m, 3H), 2,10-2,01 (m, 3H), 1,79-1,55 (m, 4H), 1,48 (d, 3H)

45 A continuación, en las tablas 15-20 se muestran ejemplos del compuesto de hidroxilamina adecuados para ser usados como un intermedio de producción del compuesto de amina cíclico de la presente invención. Además, estos compuestos de hidroxilamina son sustancias formadas en etapas intermedias de un método similar a los métodos de producción mostrados en los Ejemplos mencionados anteriormente.

En la tabla 7, $(\text{R}^{10})_m$, $(\text{R}^{11})_n$ y A representan el sustituyente en el compuesto de hidroxilamina representado por la fórmula (III d).

50 En la tabla 8, $(\text{R}^{10})_m$, $(\text{R}^{11})_n$ y A representan el sustituyente en el compuesto de hidroxilamina representado por la fórmula (III r).

[Fórmula química 40]



55

[Tabla 42]

Tabla 7

Nº	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
e-1	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-2	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-3	Ph	2-(OH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-4	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-5	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂
e-6	Ph	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂
e-7	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂
e-8	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂
e-9	Ph	2-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-11	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	C ₃ H ₆
e-12	piridin-2-ilo	-	5-CF ₃	CH ₂ OCH ₂
e-13	Ph	2-(CO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-14	Ph	2-(OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-15	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂
e-16	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-17	piridin-3-ilo	2-(O ⁿ Pr)	6-CF ₃	C ₃ H ₆
e-18	pirazol-5-ilo	1-(ⁿ Bu)	3-CF ₃	C ₃ H ₆

5

[Tabla 43]

Tabla 7 (Continuación)

Nº	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
e-20	Ph	2-(OEt)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-22	Ph	2-OH	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-23	Ph	2-(O ⁿ Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-24	Ph	2-([1,3]dioxolan-2-ilo)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-25	Ph	2-(CH ₂ O ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-26	Ph	2-(CH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-27	Ph	2-(CH ₂ OEt)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-28	Ph	2-(NHCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-29	Ph	2-(O ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-30	Ph	2-(O ^s Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-31	Ph	2-(OCO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-32	Ph	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-33	Ph	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-34	Ph	2-(OCH ₂ CH=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-35	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-36	Ph	2-(OCH ₂ CH=CCl ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-37	Ph	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-38	Ph	2-(OCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-39	Ph	2-(OCH ₂ ^s Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-40	Ph	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-41	Ph	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-42	Ph	2-(CO ₂ Et)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-43	Ph	2-(OAc)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-44	Ph	2-(OCH ₂ [2,2-Cl ₂ -3-F- ^c Pr])	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-45	Ph	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-46	Ph	2-(OCH ₂ CH(OH)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-47	Ph	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆

10

[Tabla 44]

Tabla 7 (Continuación)

Nº	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
e-48	Ph	2-(O ^c Pen)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-49	Ph	2-(OCONH ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-50	Ph	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆

Nº	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
e-51	Ph	2-F	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-52	Ph	2-(piridin-3-ilo)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-53	Ph	2-(S ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-54	Ph	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-55	Ph	2-(O ⁿ Pr)	4-Cl	C ₃ H ₆
e-56	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-Cl	CH ₂ OCH ₂
e-57	Ph	2 ⁿ Bu	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-58	Ph	2 ⁿ Pen	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-59	Ph	2-(CH ₂ CH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-60	Ph	2-(CH=N-OH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-61	Ph	2-(CH=N-OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-62	Ph	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-63	Ph	2-(OCH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-64	Ph	2-(OCH ₂ F)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-65	Ph	2-(OCH ₂ -(piridin-3-ilo))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-66	Ph	2-(OCH ₂ [tetrahidrofuran-2-ilo])	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-67	Ph	2-(SCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-68	Ph	2-(SCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-69	Ph	2-(SO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-70	Ph	2-(SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-71	Ph	2-(OF)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-72	Ph	2-(O-(piridin-3-ilo))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-73	Ph	2-NH ₂	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-74	Ph	2-(N(CH ₃) ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆

[Tabla 45]

Tabla 7 (Continuación)

5

Nº	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
e-75	Ph	2-(NHCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-76	Ph	2-(NHCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-77	Ph	2-(NHAc)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-78	Ph	2-(NH ₂ SO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-79	Ph	2-(NH ₂ SO ₂ F)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-80	Ph	2-(CONH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-81	Ph	2-(O-N=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-82	Ph	2-(SF)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-83	Ph	2-(S-(piridin-3-ilo))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-84	Ph	2-(CS ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-85	Ph	2-(CO(S ⁿ Pr))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-86	Ph	2-(CS(O ⁿ Pr))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-87	Ph	2-(CS ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-88	Ph	2-(Si(CH ₃) ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-89	Ph	2-NO ₂	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-90	Ph	2-(OCH ₂ CO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-91	Ph	2-(OCH ₂ CH ₂)-3	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-92	Ph	2-(OCH ₂ CH ₂ O)-3	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-93	Ph	2-(OCH ₂ O)-3	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-94	Ph	2-(CH ₂ OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-95	Ph	2-(CH ₂ OCH ₂ CN)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-96	Ph	2-(CH ₂ OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-97	Ph	2-(CH ₂ OCH ₂ O ⁿ Pen)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-98	Ph	2-(CH ₂ OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-99	Ph	2-(CH ₂ OCH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-100	Ph	2-(CH ₂ OCH ₂ SO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-101	Ph	2-(CH ₂ OCH ₂ F)	4-CF ₃	C ₃ H ₆

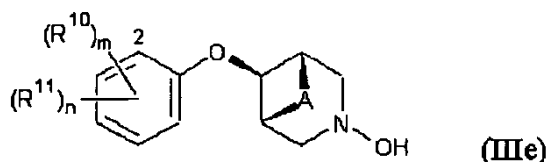
[Tabla 46]

Tabla 7 (Continuación)

Nº	Cy ¹	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
e-102	Ph	2-(CH ₂ OCH ₂ -(piridin-3-ilo))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-103	Ph	2-(CH ₂ OCH ₂ -[tetrahidrofuran-2-ilo])	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-104	Ph	3-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-105	Ph	3-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-106	Ph	3-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-107	Ph	3-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-108	Ph	3-(O ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
e-109	Ph	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CN	C ₃ H ₆
e-110	Ph	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CN	C ₃ H ₆
e-111	Ph	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CN	C ₃ H ₆
e-112	Ph	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CN	C ₃ H ₆
e-113	Ph	2-(O ¹ Pr)	4-CN	C ₃ H ₆

5

[Fórmula química 41]



10 [Tabla 47]

Tabla 8

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
f-5	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-6	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-7	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-8	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-9	2-(OCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂
f-10	2-(OCH ₂ ^o Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂
f-11	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂
f-12	2-(CO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	CH ₂ OCH ₂

15 [Tabla 48]

Tabla 8 (Continuación)

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
f-13	2-(OEt)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-14	2-OH	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-15	2-(O ¹ Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-16	2-([1,3]dioxolan-2-ilo)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-17	2-(CH ₂ O ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-18	2-(CH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-19	2-(CH ₂ OEt)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-20	2-(NHCH ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-21	2-(O ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-22	2-(O ¹ Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-23	2-(OCO ₂ ¹ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-24	2-(OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-25	2-(OCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-26	2-(OCH ₂ CH=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-27	2-(OCH ₂ ¹ Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-28	2-(OCH ₂ CH=CCl ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-29	2-(OCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-30	2-(OCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
f-31	2-(OCH ₂ ^S Bu)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-32	2-(OCH ₂ CN)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-33	2-(OCH(CH ₃)OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-34	2-(CO ₂ Et)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-35	2-(OAc)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-36	2-(OCH ₂ [2,2-Cl ₂ -3-F ^o Pr])	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-37	2-(OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-38	2-(OCH ₂ CH(OH)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆

[Tabla 49]

Tabla 8 (Continuación)

5

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
f-39	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-40	2-(O ^o Pen)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-41	2-(OCONH ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-42	2-(OSO ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-43	2-F	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-44	2-(piridin-3-ilo)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-45	2-(S ^o Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-46	2-(CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-47	2-(O ⁿ Pr)	4-Cl	C ₃ H ₆
f-48	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-Cl	CH ₂ OCH ₂
f-49	2- ⁿ Bu	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-50	2- ⁱ Pen	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-51	2-(CH ₂ CH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-52	2-(CH=N-OH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-53	2-(CH=N-OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-54	2-(OCH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-55	2-(OCH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-56	2-(OCH ₂ F)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-57	2-(OCH ₂ -(piridin-3-ilo))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-58	2-(OCH ₂ -[tetrahidrofuran-2-ilo])	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-59	2-(SCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-60	2-(SCH ₂ C=CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-61	2-(SO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-62	2-(SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-63	2-(OF)	4-CF ₃	C ₃ H ₆

[Tabla 50]

Tabla 8 (Continuación)

10

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
f-64	2-(O-(piridin-3-ilo))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-65	2-NH ₂	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-66	2-(N(CH ₃) ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-67	2-(NHCH ₂ CH=CH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-68	2-(NHCH ₂ C≡CH)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-69	2-(NHAc)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-70	2-(NHSO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-71	2-(NHSO ₂ F)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-72	2-(CONH ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-73	2-(O-N=C(CH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-74	2-(SF)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-75	2-(S-(piridin-3-ilo))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-76	2-(CS ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-77	2-(CO(S ⁱ Pr))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-78	2-(CS(O ⁱ Pr))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-79	2-(CS ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-80	2-(Si(CH ₃) ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-81	2-NO ₂	4-CF ₃	C ₃ H ₆

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
f-82	2-(OCH ₂ CO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-83	2-(OCH ₂ CH ₂)-3	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-84	2-(OCH ₂ CH ₂ O)-3	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-85	2-(OCH ₂ O)-3	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-86	2-(CH ₂ OCH ₂ CF ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-87	2-(CH ₂ OCH ₂ CN)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-88	2-(CH ₂ OCH ₂ OCH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-89	2-(CH ₂ OCH ₂ O ^c Pen)	4-CF ₃	C ₃ H ₆

[Tabla 51]

Tabla 8 (Continuación)

5

Nº	(R ¹⁰) _m	(R ¹¹) _n	A
f-90	2-(CH ₂ OCH ₂ Ac)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-91	2-(CH ₂ OCH ₂ CH(OCH ₃) ₂)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-92	2-(CH ₂ OCH ₂ SO ₂ CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-93	2-(CH ₂ OCH ₂ F)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-94	2-(CH ₂ OCH ₂ -(piridin-3-ilo))	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-95	2-(CH ₂ OCH ₂ -[tetrahidrofuran-2-ilo])	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-96	3-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-97	3-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-98	3-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-99	3-(CO ₂ ⁱ pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-100	3-(O ⁿ Pr)	4-CF ₃	C ₃ H ₆
f-101	2-(OCH ₂ ⁱ Pr)	4-CN	C ₃ H ₆
f-102	2-(OCH ₂ ^c Pr)	4-CN	C ₃ H ₆
f-103	2-(CH ₂ OCH(OCH ₃)CH ₃)	4-CN	C ₃ H ₆
f-104	2-(CO ₂ ⁱ Pr)	4-CN	C ₃ H ₆
f-105	2-(O ⁿ Pr)	4-CN	C ₃ H ₆

Más abajo se muestran las constantes físicas de algunos de los compuestos en las tablas 7-8.

10

Compuesto e-1: punto de fusión [112-115°C]

Compuesto e-2: punto de fusión [118-123°C]

Compuesto e-9: punto de fusión [94-100°C]

15

Compuesto e-11: punto de fusión [105-110°C]

Compuesto e-12: punto de fusión [110-113°C]

20

Compuesto e-13: RMN ¹H (CDCl₃, δppm, temperatura de medida 20,2°C) 8,02 (s, 1H), 7,70 (d, 1H), 7,05 (d, 1H), 5,70-5,66 (m, 1H), 3,96 (s, 3H), 3,52 (brs, 2H), 2,74-2,64 (m, 2H), 2,37-2,34 (m, 1H), 1,98-1,80 (m, 2H), 1,71-1,34 (m, 5H)

25

Compuesto e-14: RMN ¹H (CDCl₃, δppm, temperatura de medida 20,4°C) 7,34 (s, 1H), 7,23 (d, 1H), 6,95 (d, 1H), 5,21 (s, 2H), 5,08-5,00 (m, 1H), 3,56-3,51 (brs, s, total 5H), 2,70-2,60 (m, 2H), 2,38-2,26 (m, 1H), 2,02-1,96 (m, 2H), 1,71-1,57 (m, 3H), 1,40-1,33 (m, 2H)

Compuesto e-15: punto de fusión [104-107°C]

30

Compuesto e-16: punto de fusión [112-115°C]

Compuesto e-17: RMN ¹H (CDCl₃, δppm, temperatura de medida 21,7°C) 7,17 (d, 1H), 7,07 (d, 1H), 5,01-4,97 (m, 1H), 4,35 (t, 2H), 3,47 (brs, 2H), 2,65-1,23 (m, 12H), 1,03 (t, 3H)

35

Compuesto e-18: RMN ¹H (CDCl₃, δppm, temperatura de medida 22,6°C) 5,78 (s, 1H), 5,30-4,90 (m, 1H), 3,99 (t, 2H), 3,50 (brs, 2H), 2,66-2,29 (m, 3H), 1,96-1,15 (m, 11H), 0,95 (t, 3H)

Más abajo se muestran algunos ejemplos de preparación del acaricida según la presente invención. Sin embargo, los aditivos y las relaciones de adición no están limitadas a los ejemplos de preparación, y se pueden modificar a lo

largo de un amplio intervalo. Además, el término “partes” usado en los ejemplos de preparación indica “partes en peso”.

Ejemplo 1 de preparación	Polvo humectable
Compuesto de la presente invención	40 partes
Tierra de diatomeas	53 partes
Sulfato de alcohol graso	4 partes
Alquilnaftaleno sulfonato	3 partes

- 5 Lo anterior se mezcla uniformemente y se pulveriza finamente para obtener un polvo humectable que incluye 40% de ingrediente activo.

Ejemplo 2 de preparación	emulsión
Compuesto de la presente invención	30 partes
Xileno	33 partes
Dimetilformamida	30 partes
Polioxietilen alquilalil éter	7 partes

10 Lo anterior se mezcla y se disuelve para obtener una emulsión que incluye 30% de ingrediente activo.

Los siguientes ejemplos de ensayo demuestran que el compuesto de amina cíclico o sal del mismo según la presente invención es útil como un ingrediente activo de un acaricida.

Ejemplo 1 de Ensayo. Ensayo de eficacia frente a Tetranychus urticae

15 Se inocularon diecisiete ácaros Tetranychus urticae hembras adultas resistentes a fósforo orgánico sobre las primeras hojas de una planta de alubia plantada en un tiesto nº 3, 7 a 10 días después de la germinación. A continuación, se preparó una emulsión que tiene la fórmula indicada en el ejemplo 2 de preparación mencionado anteriormente. Esta emulsión se diluyó con agua hasta una concentración de compuesto de 125 ppm, después de lo cual los líquidos diluidos se pulverizaron sobre la planta de alubia. La planta de alubia se colocó entonces en una habitación de temperatura controlada a una temperatura de 25°C y humedad de 65%. Las tasas de mortalidad de los insectos adultos se investigaron 3 días después de la pulverización. El ensayo se repitió dos veces.

25 El ensayo mencionado anteriormente se llevó a cabo sobre emulsiones que contienen respectivamente los compuestos de amina cíclicos de Compuesto nº H-1, H-2, H-5, H-29, H-41, H-42, H-43, H-51, H-52, H-54, H-55, H-56, H-57, H-58, H-59, H-60, H-61, H-62, H-63, H-64, H-65, H-66, H-67, H-68, H-70, H-71, H-72, H-73, H-74, H-75, H-79, H-80, H-82, H-83, H-84, H-85, H-86, H-87, H-89, H-90, K-8, K-12, K-38, y K-39. Como resultado, las tasas de mortalidad de los insectos para todos los compuestos en el caso de diluir hasta una concentración de 125 ppm fueron 80% o mayores.

30 Además, la tasa de mortalidad de los insectos para el Compuesto nº H-81 en el caso de diluir hasta una concentración de 31 ppm fue también 80% o mayor.

Ejemplo 2 de ensayo. Ensayo de eficacia frente a Panonychus citri

35 Se inocularon diez ácaros Panonychus citri hembras adultas resistentes a acaricidas sobre una hoja de mandarina colocada en una cápsula de Petri. A continuación, se preparó una emulsión que tiene la fórmula indicada en el ejemplo 2 de preparación mencionado anteriormente. Esta emulsión se diluyó con agua hasta una concentración de compuesto de 125 ppm, después de lo cual los líquidos diluidos se pulverizaron sobre la hoja de mandarina con una torre de pulverización giratoria. La hoja de mandarina se colocó entonces en una habitación de temperatura controlada a una temperatura de 25°C y una humedad de 65%. Las tasas de mortalidad de insectos adultos se investigaron 3 días después de la pulverización.

45 El ensayo mencionado anteriormente se llevó a cabo en emulsiones que contienen respectivamente los compuestos de amina cíclicos de Compuesto nº H-1, H-2, H-5, H-29, H-41, H-42, H-43, H-51, H-55, H-57, H-58, H-62, H-64, H-66, H-69, H-72, H-73, H-74, H-75, H-81, H-82, H-83, H-84, H-85, H-87, H-89, H-90, K-8, K-12, K-38 y K-39. Como resultado, las tasas de mortalidad de insectos para todos los compuestos en el caso de diluir hasta una concentración de 125 ppm fueron 80% o mayores.

50 Además, las tasas de mortalidad de insectos para el Compuesto nº H-54, H-56, H-59, H-60, H-61, H-63, H-68, H-70, y H-80 en el caso de diluir hasta una concentración de 31 ppm también fueron 80% o mayores.

Ejemplo 3 de ensayo. Ensayo de actividad ovicida frente a huevos de Tetranychus urticae

Se inoculó un ácaro *Tetranychus urticae* hembra adulta sobre una hoja de una planta de alubia colocada en una cápsula de Petri para permitir que el ácaro ponga huevos durante 1 día. A continuación, se preparó una emulsión que tiene la fórmula indicada en el ejemplo 2 de preparación mencionado anteriormente. Esta emulsión se diluyó con agua hasta una concentración de compuesto de 125 ppm, después de lo cual el líquido diluido se pulverizó sobre la hoja de una planta de alubia con una torre de pulverización giratoria. La hoja de la planta de alubia se colocó entonces en una habitación de temperatura controlada a una temperatura de 25°C y una humedad de 65%. La tasa de mortalidad de los huevos se calculó investigando si los huevos que se pulverizaron con la emulsión eclosionaron o no.

El ensayo mencionado anteriormente se llevó a cabo sobre las emulsiones que contienen los compuestos de amina cíclicos de Compuesto nº: H-1, H-2, H-29, H-43, H-54, H-56, y H-73. Como resultado, las tasas de mortalidad de huevos para todos los compuestos en el caso de diluir hasta una concentración de 125 ppm fueron 80% o mayores.

Ejemplo 4 de ensayo. Ensayo de actividad ovicida frente a huevos de Panonychus citri

Se inoculó un ácaro *Panonychus citri* hembra adulta sobre una hoja de mandarina colocada en una cápsula de Petri para permitir que el ácaro ponga huevos durante 1 día. A continuación, se preparó una emulsión que tiene la fórmula indicada en el ejemplo 2 de preparación mencionado anteriormente. Esta emulsión se diluyó con agua hasta una concentración de compuesto de 125 ppm, después de lo cual el líquido diluido se pulverizó sobre la hoja de mandarina con una torre de pulverización giratoria. La hoja de mandarina se colocó entonces en una habitación de temperatura controlada a una temperatura de 25°C y una humedad de 65%. La tasa de mortalidad de los huevos se calculó investigando si los huevos pulverizados con la emulsión eclosionaron o no.

El ensayo mencionado anteriormente se llevó a cabo sobre las emulsiones que incluyen los compuestos de amina cíclicos de Compuesto nº: H-1, H-2, H-29, H-43, H-54, H-56, y H-73. Como resultado, las tasas de mortalidad de los huevos en el caso de diluir hasta una concentración de 125 ppm para todos los compuestos fueron 80% o mayores.

Ejemplo 5 de ensayo. Ensayo de potencia insecticida frente a Haemaphysalis longicornis

Un compuesto de la presente invención se diluyó con acetona para preparar una disolución de fármaco que tiene una concentración de 400 ppm. Se revistieron 118 µl de la disolución de fármaco sobre la superficie interna de un vial de vidrio de 20 ml, seguido de la volatilización de la acetona para formar una película delgada del compuesto de la presente invención sobre la superficie interna del vial de vidrio. Puesto que el área del vial de vidrio fue 47 cm², la cantidad de revestimiento de la disolución de fármaco por área de superficie interna fue 1 µg/cm². Se colocaron ocho garrapatas *Haemaphysalis longicornis* en forma de larva en el vial de vidrio, seguido del cierre del vial de vidrio y de su colocación en una habitación de temperatura controlada a 25°C. La tasa de mortalidad de los insectos se calculó después de 5 días.

Tasa de mortalidad de los insectos (%) = (número de garrapatas muertas/número de garrapatas liberadas) x 100

Como resultado, entre los compuestos bajo ensayo, los siguientes compuestos demostraron una tasa de mortalidad de los insectos de 80% o mayor.

Compuesto nº: H-5, H-29, H-43, H-55, H-63, H-73, H-83, H-90, J-42, K-38, K-39.

Ejemplo 6 de ensayo. Ensayo de potencia insecticida frente a pulga de gato

Un compuesto de la presente invención se diluyó con acetona para preparar una disolución de fármaco que tiene una concentración de 400 ppm. Se revistieron 118 µl de la disolución de fármaco sobre la superficie interna de un vial de vidrio de 20 ml, seguido de la volatilización de la acetona para formar una película delgada del compuesto de la presente invención sobre la superficie interna del vial de vidrio. Puesto que el área del vial de vidrio fue 47 cm², la cantidad de revestimiento de la disolución de fármaco por área de superficie interna fue 1 µg/cm². Se colocaron ocho pulgas de gato larvarias en el vial de vidrio, seguido del cierre del vial de vidrio y de su colocación en una habitación de temperatura controlada a 25°C. La tasa de mortalidad de los insectos se calculó después de 1 día.

Tasa de mortalidad de los insectos (%) = (número de insectos muertos/número de insectos liberados) x 100

Como resultado, entre los compuestos bajo ensayo, los siguientes compuestos demostraron una tasa de mortalidad de los insectos de 80% o mayor.

Compuesto nº: H-73, K-38, K-39.

A partir de los resultados anteriores, es manifiesto que el compuesto de amina cíclico o sal del mismo según la presente invención tiene una potencia insecticida superior frente a los ácaros.

Aplicabilidad industrial

5 El compuesto de amina cíclico o sal del mismo según la presente invención hace posible prevenir eficazmente los ácaros que son dañinos para cultivos agrícolas o son dañinos en términos de salud.

10 El compuesto de hidroxilamina o sal del mismo según la presente invención hace posible sintetizar fácilmente el compuesto de amina cíclico o sal del mismo según la presente invención. Por lo tanto, la presente invención es industrialmente útil.

independientemente un anillo, o se pueden unir juntos para formar un anillo, o se pueden unir con los átomos que constituyen Cy^2 para formar un anillo;

5 m representa el número de R^{10} y representa un número entero de 0 a 5, cuando m es 2 o más, los R^{10} pueden ser iguales o diferentes;

n representa el número de R^{11} y representa un número entero de 0 a 5, cuando n es 2 o más, los R^{11} pueden ser iguales o diferentes;

10 p representa el número de R^{20} y representa un número entero de 0 a 5, cuando p es 2 o más, los R^{20} pueden ser iguales o diferentes;

15 r representa el número de R^{21} y representa un número entero de 0 a 5, cuando r es 2 o más, los R^{21} pueden ser iguales o diferentes;

Y representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre.

2. Compuesto de amina cíclico o sal del mismo según la reivindicación 1, en el que

20 en la fórmula (I), Cy^1 representa un grupo fenilo, un grupo pirazolilo, un grupo tiadiazolilo, un grupo piridilo, un grupo pirimidinilo o un grupo piridazinilo, y Cy^2 representa un grupo fenilo, un grupo pirazolilo, un grupo tiadiazolilo, un grupo piridilo, un grupo pirimidinilo, o un piridazinilo.

3. Compuesto de amina cíclico o sal del mismo según la reivindicación 1 o 2, en el que

25 en la fórmula (I), R^{10} representa un grupo alquilo de C1-6, un grupo alcoxi C1-6-alquilo de C1-6, un grupo alcoxi C1-6-alcoxi C1-6-alquilo de C1-6, un grupo alquenilo de C2-6, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi de C1-6, un grupo haloalcoxi de C1-6, un grupo cicloalcoxi de C3-8, un grupo alquenil C2-6-oxi, un grupo haloalquenil C2-6-oxi, un grupo alquinil C2-6-oxi, un grupo haloalquinil C2-6-oxi, un grupo alcoxi C1-6-alcoxi de C1-6, un grupo cicloalquil C3-8-alcoxi de C1-6, un grupo ciano-alcoxi de C1-6, un grupo acil C1-7-alcoxi de C1-6, un grupo hidroxil-alcoxi de C1-6, un grupo acil C1-7-oxi, un grupo alcoxi C1-6-carbonilo, un grupo alquenil C2-6-oxicarbonilo, un grupo alquinil C2-6-oxicarbonilo, un grupo alcoxi C1-6-carboniloxi, un grupo alquil C1-6-aminocarboniloxi, un grupo arilo de C6-10, un grupo heterocíclico, un grupo haloalquil C1-6-sulfoniloxi, un grupo alquiliden C1-6-aminooxi, un grupo alcoxi C1-6-carbonilamino, un grupo aralquilo de C7-11 no sustituido o sustituido, un grupo aralquil C7-11-oxi no sustituido o sustituido, un grupo alquil C1-6-tio o un grupo nitro;

35 R^{11} representa un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo pentafluorosulfanilo, un grupo haloalquilo de C1-6, un grupo haloalquenilo de C2-6 o un grupo haloalquinilo de C2-6;

40 R^{20} representa un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo pentafluorosulfanilo, un grupo haloalquilo de C1-6, un grupo haloalquenilo de C2-6 o un grupo haloalquinilo de C2-6; y

45 R^{21} representa un grupo alquilo de C1-6, un grupo alcoxi C1-6-alquilo de C1-6, un grupo alcoxi C1-6-alcoxi C1-6-alquilo de C1-6, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi de C1-6, un grupo haloalcoxi de C1-6, un grupo haloalquenil C2-6-oxi, un grupo haloalquinil C2-6-oxi, un grupo alcoxi C1-6-alcoxi de C1-6, un grupo cicloalquil C3-8-alcoxi de C1-6, un grupo alcoxi C1-6-carbonilo, un grupo alquenil C2-6-oxicarbonilo, un grupo alquinil C2-6-oxicarbonilo, un grupo alquiliden C1-6-aminooxi, un grupo alcoxi C1-6-carbonilamino, un grupo aralquilo de C7-11 no sustituido o sustituido, un grupo aralquil C7-11-oxi no sustituido o sustituido, o un grupo nitro.

50 4. Compuesto de amina cíclico o sal del mismo según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en el que

en la fórmula (I), Cy^1 representa un grupo fenilo;

55 R^{1b} , R^{2b} , R^{3a} , R^{3b} , R^{4a} , R^{4b} y R^{5a} representan un átomo de hidrógeno;

60 R^{1a} y R^{2a} se unen juntos para formar un grupo alquileo de C3-6 no sustituido o sustituido, un grupo alquenileno de C3-6 no sustituido o sustituido, un grupo representado por la fórmula: $-CH_2OCH_2-$, un grupo representado por la fórmula: $-CH_2SCH_2-$, un grupo representado por la fórmula: $-CH_2C(=O)CH_2-$, o un grupo representado por la fórmula: $-CH_2NR^6CH_2-$ (con la condición de que R^6 represente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1-6 no sustituido o sustituido, un grupo acilo de C1-7 no sustituido o sustituido o un grupo alcoxi C1-6-carbonilo no sustituido o sustituido);

Cy^2 representa un grupo piridin-2-ilo;

65 Y representa un átomo de oxígeno;

alquilo de C1-6, un grupo sililo trisustituido con arilo de C6-10, un grupo ciano, un grupo nitro o un átomo de halógeno;

5 R^{10} y R^{11} de Cy^1 pueden formar independientemente un anillo, o se pueden unir juntos para formar un anillo, o se pueden unir con los átomos que constituyen Cy^1 para formar un anillo;

m representa el número de R^{10} y representa un número entero de 0 a 5, cuando m es 2 o más, los R^{10} pueden ser iguales o diferentes;

10 n representa el número de R^{11} y representa un número entero de 0 a 5, cuando n es 2 o más, los R^{11} pueden ser iguales o diferentes.

8. Compuesto de hidroxilamina o sal del mismo según la reivindicación 7, en el que

15 en la fórmula (III), Cy^1 representa un grupo fenilo, un grupo pirazolilo, un grupo tiadiazolilo, un grupo piridilo, un grupo pirimidinilo o un grupo piridazinilo.

9. Compuesto de hidroxilamina o sal del mismo según la reivindicación 7 u 8, en el que

20 en la fórmula (III), R^{10} representa un grupo alquilo de C1-6, un grupo alcoxi C1-6-alquilo de C1-6, un grupo alcoxi C1-6-alcoxi C1-6-alquilo de C1-6, un grupo alquenoilo de C2-6, un grupo hidroxi, un grupo alcoxi de C1-6, un grupo haloalcoxi de C1-6, un grupo cicloalcoxi de C3-8, un grupo alquenoil C2-6-oxi, un grupo haloalquenoil C2-6-oxi, un grupo alquinoil C2-6-oxi, un grupo haloalquinoil C2-6-oxi, un grupo alcoxi C1-6-alcoxi de C1-6, un grupo cicloalquil C3-8-alcoxi de C1-6, un grupo ciano-alcoxi de C1-6, un grupo acil C1-7-alcoxi de C1-6, un grupo hidroxi-alcoxi de C1-6, un grupo acil C1-7-oxi, un grupo alcoxi C1-6-carbonilo, un grupo alquenoil C2-6-oxicarbonilo, un grupo alquinoil C2-6-oxicarbonilo, un grupo alcoxi C1-6-carboniloxi, un grupo alquil C1-6-aminocarboniloxi, un grupo arilo de C6-10, un grupo heterociclilo, un grupo haloalquil C1-6-sulfoniloxi, un grupo alquiliden C1-6-aminooxi, un grupo alcoxi C1-6-carbonilamino, un grupo aralquilo de C7-11 no sustituido o sustituido, un grupo aralquil C7-11-oxi no sustituido o sustituido, un grupo alquil C1-6-tio o un grupo nitro; y

30 R^{11} representa un grupo ciano, un átomo de halógeno, un grupo pentafluorosulfanilo, un grupo haloalquilo de C1-6, un grupo haloalquenoilo de C2-6 o un grupo haloalquinoilo de C2-6.