

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 561 887**

51 Int. Cl.:

C07D 401/04 (2006.01)
C07D 403/04 (2006.01)
C07D 405/04 (2006.01)
C07D 409/04 (2006.01)
C07D 413/04 (2006.01)
C07D 417/04 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **24.07.2012 E 12737842 (0)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **25.11.2015 EP 2736897**

54 Título: **Ácidos picolínicos y piridimin-4-carboxílicos sustituidos, procedimiento para su preparación y su uso como herbicidas y reguladores del crecimiento de plantas**

30 Prioridad:

27.07.2011 EP 11175511

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

01.03.2016

73 Titular/es:

**BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH
(100.0%)
Alfred-Nobel-Strasse 10
40789 Monheim, DE**

72 Inventor/es:

**HOFFMANN, MICHAEL GERHARD;
BRÜNJES, MARCO;
DÖLLER, UWE;
DIETRICH, HANS-JÖRG;
HÄUSER-HAHN, ISOLDE;
ROSINGER, CHRISTOPHER HUGH;
GATZWEILER, ELMAR y
HEINEMANN, INES**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

Observaciones :

Véase nota informativa (Remarks) en el folleto original publicado por la Oficina Europea de Patentes

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).

ES 2 561 887 T3

DESCRIPCIÓN

Ácidos picolínicos y piridimin-4-carboxílicos sustituidos, procedimiento para su preparación y su uso como herbicidas y reguladores del crecimiento de plantas

5 La invención se refiere al área técnica de los herbicidas, especialmente al de los herbicidas para combatir selectivamente malas hierbas y gramíneas invasivas en cultivos de plantas útiles.

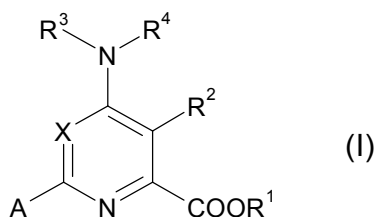
Se conoce de diferentes publicaciones que derivados de ácido picolínico y derivados de ácido piridimin-4-carboxílico sustituidos presentan propiedades herbicidas: en el documento WO 2003/011853 A1 se describen derivados polisustituidos de ácido 6-fenilpicolínico con efecto herbicida. Los documentos WO2009/029735 A1 y WO2010/125332 A1 describen efectos herbicidas para derivados polisustituidos de ácido 2-fenil-4-piridimin-carboxílico.

10 En el documento WO 2009/138712 A2 se divulgan ácidos picolínicos y piridimincarboxílicos sustituidos con restos heteroaromáticos con propiedades herbicidas. En los documentos WO 2007/080382 A1 y WO 2009/007751 A2 se describen ácidos picolínicos y piridimincarboxílicos sustituidos con restos heteroaromáticos con efectos farmacológicos.

Pero frecuentemente los compuestos descritos en estas publicaciones presentan una acción herbicida insuficiente y/o una selectividad insuficiente en cultivos de plantas útiles.

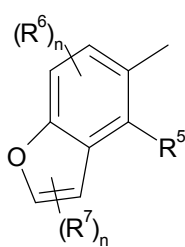
15 Hemos encontrado ácidos picolínicos y piridimin-4-carboxílicos sustituidos que son especialmente apropiados como herbicidas.

Un objeto de la presente invención proporciona ácidos picolínicos y piridimin-4-carboxílicos de fórmula general (I), sus N-óxidos o sus sales

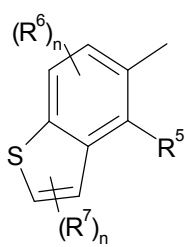


20 en la que

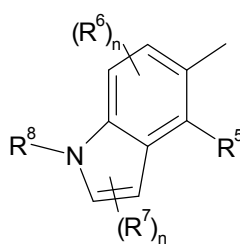
A significa un resto del grupo que se compone de A1 a A20,



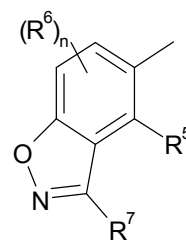
A1



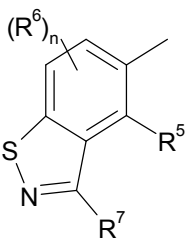
A2



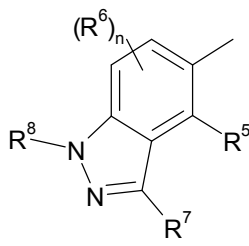
A3



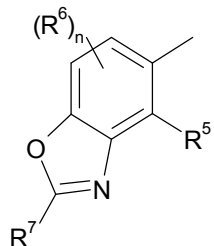
A4



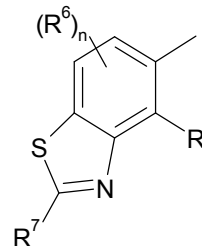
A5



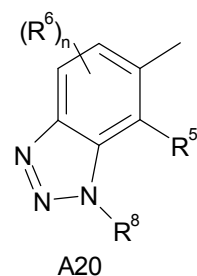
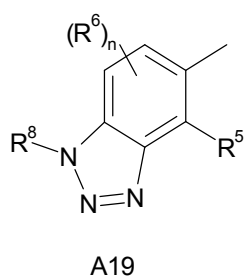
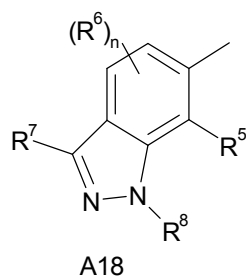
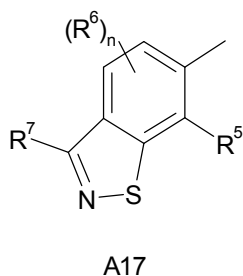
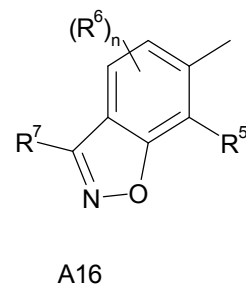
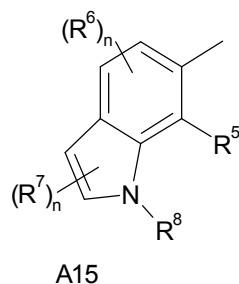
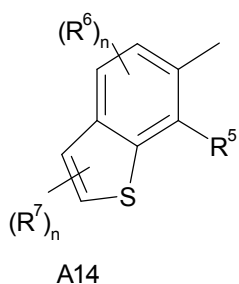
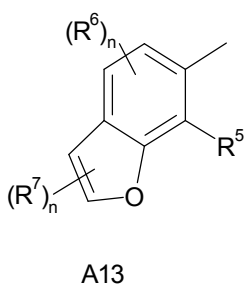
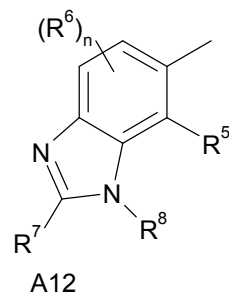
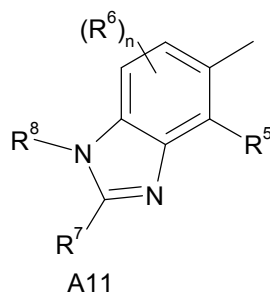
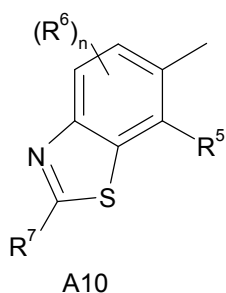
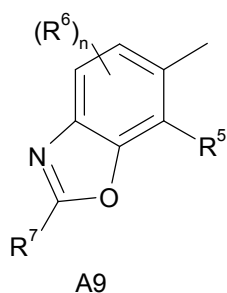
A6



A7



A8



5

R¹ significa hidrógeno o alquilo (C₁-C₄),

R² significa cloro,

R³ significa hidrógeno,

R⁴ significa hidrógeno,

10 R⁵ significa hidrógeno, halógeno, OH, NH₂, CN, alquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), alquilamino (C₁-C₃) o ciclopropilo,

R⁶ significa hidrógeno, halógeno, OH, NH₂, CN, alquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), ciclopropilo o vinilo,

R⁷ significa hidrógeno, halógeno, alquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), alquiltio (C₁-C₃), ciclopropilo, alquilamino (C₁-C₃) o fenilo,

R⁸ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₃), fenilo o alquilcarbonilo (C₁-C₃),

15 X significa N, CH, CCl, CF o CBr,

n significa 0, 1 o 2.

Alquilo significa restos hidrocarburo saturados, de cadena lineal o ramificada con 1 a 10 átomos de carbono, p. ej., alquilo C₁-C₆ como metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metil-propilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-di-metilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metil-pentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo,

20

2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo y 1-etil-2-metilpropilo.

Haloalquilo significa grupos alquilo de cadena lineal o ramificada con 1 a 8 átomos de carbono, pudiendo estar en estos grupos los átomos de hidrógeno sustituidos algunos o todos con átomos de halógeno, p. ej., haloalquilo C₁-C₂ como

5 clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoretilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoretilo, 2-cloro,2-difluoretilo, 2,2-dicloro-2-fluoretilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo y 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo.

Alquenilo significa restos hidrocarburo insaturados, de cadena lineal o ramificada con 2 a 8 átomos de carbono y un

10 doble enlace en una posición cualquiera, p. ej., alquenilo C₂-C₆ como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-

Alquinilo significa restos hidrocarburo de cadena lineal o ramificada con 2 a 8 átomos de carbono y un triple enlace en una posición cualquiera, p. ej., alquinilo C₂-C₆ como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo (o propargilo), 1-butinilo, 2-butinilo, 3-

25 butinilo, 1-metil-2-propinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 3-metil-1-butinilo, 1-metil-2-butinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 3-metil-1-pentinilo, 4-metil-1-pentinilo, 1-metil-2-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 1,1-dimetil-2-butinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 3,3-dimetil-1-butinilo, 1-etil-2-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3-butinilo y 1-etil-1-metil-2-propinilo.

Alcoxi significa restos alcoxi saturados, de cadena lineal o ramificada con 1 a 8 átomos de carbono, p. ej., alcoxi C₁-C₆ como metoxi, etoxi, propoxi, 1-metiletoxi, butoxi, 1-metil-propoxi, 2-metilpropoxi, 1,1-dimetiletoxi, pentoxi, 1-metilbutoxi, 2-

30 metilbutoxi, 3-metilbutoxi, 2,2-di-metilpropoxi, 1-etilpropoxi, hexoxi, 1,1-dimetilpropoxi, 1,2-dimetilpropoxi, 1-metilpentoxi, 2-metilpentoxi, 3-metilpentoxi, 4-metilpentoxi, 1,1-dimetilbutoxi, 1,2-dimetilbutoxi, 1,3-dimetilbutoxi, 2,2-dimetilbutoxi, 2,3-dimetilbutoxi, 3,3-dimetilbutoxi, 1-etilbutoxi, 2-etilbutoxi, 1,1,2-trimetilpropoxi, 1,2,2-trimetilpropoxi, 1-etil-1-metilpropoxi y 1-etil-2-metilpropoxi; halogenoalcoxi significa grupos alcoxi de cadena lineal o ramificada con 1 a 8 átomos de carbono (como se indicó anteriormente), pudiendo en estos grupos los átomos de hidrógeno estar sustituidos algunos o todos por átomos de halógeno tal como se indicó anteriormente, p. ej., halogenoalcoxi C₁-C₂ como clorometoxi, bromometoxi, diclorometoxi, triclorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 1-cloroetoxi, 1-bromoetoxi, 1-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2,2-difluoretoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoretoxi, 2-cloro,2-difluoretoxi, 2,2-dicloro-2-fluoretoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, pentafluoro-etoxi y 1,1,1-trifluoroprop-2-oxi.

Alquiltio significa restos alquiltio saturados, de cadena lineal o ramificada con 1 a 8 átomos de carbono, p. ej., alquiltio C₁-C₆ como metiltio, etiltio, propiltio, 1-metileltio, butiltio, 1-metil-propiltio, 2-metilpropiltio, 1,1-dimetileltio, pentiltio, 1-

45 metilbutiltio, 2-metilbutiltio, 3-metilbutiltio, 2,2-di-metilpropiltio, 1-etilpropiltio, hexiltio, 1,1-dimetilpropiltio, 1,2-dimetilpropiltio, 1-metilpentiltio, 2-metilpentiltio, 3-metilpentiltio, 4-metilpentiltio, 1,1-dimetilbutiltio, 1,2-dimetilbutiltio, 1,3-dimetilbutiltio, 2,2-dimetilbutiltio, 2,3-dimetilbutiltio, 3,3-dimetilbutiltio, 1-etilbutiltio, 2-etilbutiltio, 1,1,2-trimetilpropiltio, 1,2,2-trimetilpropiltio, 1-etil-1-metilpropiltio y 1-etil-2-metilpropiltio;

Halogenoalquiltio significa grupos alquiltio de cadena lineal o ramificada con 1 a 8 átomos de carbono (como se indicó anteriormente), pudiendo estar en estos grupos los átomos de hidrógeno sustituidos algunos o todos con átomos de halógeno tal como se indicó anteriormente, p. ej., haloalquiltio C₁-C₂ como clorometiltio, bromometiltio, diclorometiltio, triclorometiltio, fluorometiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, clorofluorometiltio, diclorofluorometiltio, clorodifluorometiltio, 1-cloroetiltio, 1-bromoetiltio, 1-fluoroetiltio, 2-fluoroetiltio, 2,2-difluoretiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio, 2-cloro-2-fluoretiltio, 2-

50 cloro,2-difluoretiltio, 2,2-dicloro-2-fluoretiltio, 2,2,2-tricloroetiltio, pentafluoretiltio y 1,1,1-trifluoroprop-2-iltio.

Arilo significa fenilo o naftilo.

Los compuestos de la fórmula (I) también se pueden presentar, dependiendo entre otros del tipo de sustituyentes, como

isómeros o mezclas de isómeros geométricos y/u ópticos en diferente composición que eventualmente se pueden separar de la manera habitual. La presente invención proporciona tanto los isómeros puros como también las mezclas de isómeros, su preparación y su uso y los medios que los contienen. Pero por simplicidad en adelante siempre se referirá a compuestos de la fórmula (I), aunque ello se refiera tanto a los compuestos puros como también a las mezclas con diferentes proporciones de compuestos isoméricos.

Un equivalente de ión metálico es un ión metálico con una carga positiva como Na^+ , K^+ , $(\text{Mg}^{2+})_{1/2}$, $(\text{Ca}^{2+})_{1/2}$, MgH^+ , CaH^+ , $(\text{Al}^{3+})_{1/3}$, $(\text{Fe}^{2+})_{1/2}$ o $(\text{Fe}^{3+})_{1/3}$.

Halógeno es flúor, cloro, bromo o yodo.

En el caso de que un grupo está polisustituido con restos, ello significa que este grupo está sustituido con uno o varios de los diferentes representantes de los restos iguales o diferentes mencionados.

Según el tipo de sustituyentes anteriormente definidos, los compuestos de la fórmula (I) presentan propiedades ácidas o básicas y pueden formar sales, eventualmente también sales internas o aductos con ácidos inorgánicos u orgánicos o con bases o con iones metálicos. Si los compuestos de la fórmula (I) portan grupos amino, alquilamino u otros grupos que inducen propiedades básicas, estos compuestos pueden hacerse reaccionar con ácidos dando sales o se convierten directamente en sales mediante el procedimiento de síntesis.

Ejemplos de ácidos inorgánicos son ácido halogenhídricos como fluorhídrico, clorhídrico, bromhídrico y yodhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico y ácido nítrico y sales ácidas como NaHSO_4 y KHSO_4 . Ácidos orgánicos son por ejemplo ácido fórmico, ácido carbónico y ácidos alcanóicos como ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido tricloroacético y ácido propiónico así como ácido glicólico, ácido tiocianico, ácido láctico, ácido succínico, ácido cítrico, ácido benzoico, ácido cinámico, ácido oxálico, ácidos alquilsulfónicos (ácidos sulfónicos con restos alquilo de cadena lineal o ramificada con 1 a 20 átomos de carbono), ácidos arilsulfónicos o sulfónicos (restos aromáticos como fenilo y naftilo que portan uno o dos grupos de ácido sulfónico), ácidos alquilfosfónicos (ácidos fosfónicos con restos alquilo de cadena lineal o ramificada con 1 a 20 átomos de carbono), ácidos arilfosfónicos o difosfónicos (restos aromáticos como fenilo y naftilo que portan uno o dos restos de ácido fosfónico), pudiendo los restos alquilo o bien arilo portar sustituyentes adicionales, p. ej., ácido p-toluensulfónico, ácido salicílico, ácido p-aminosalicílico, ácido 2-fenoxibenzoico, ácido 2-acetoxibenzoico, etc.

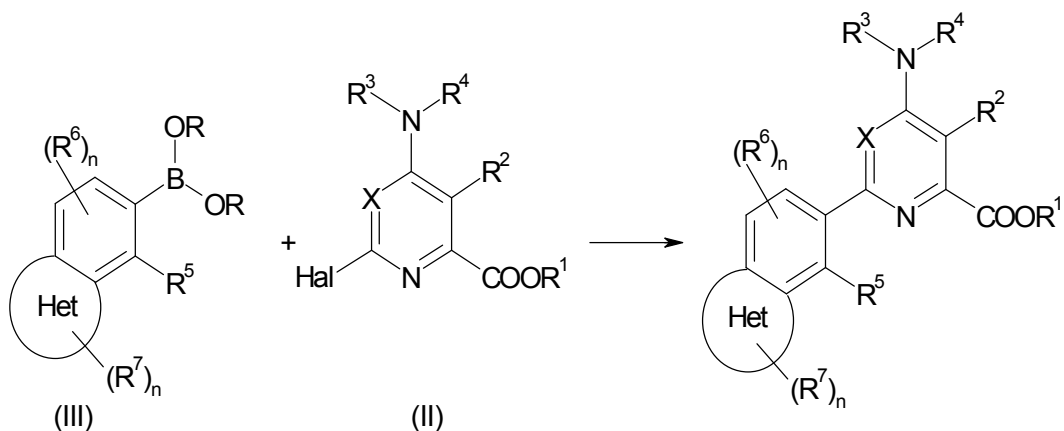
Como iones metálicos se tienen en cuenta especialmente los iones de los elementos del segundo grupo principal, especialmente calcio y magnesio, del tercero y cuarto grupo principal, especialmente aluminio, estaño y plomo, así como del primer al octavo grupo secundario, especialmente cromo, manganeso, hierro, cobalto, níquel, cobre, cinc y otros. Son especialmente preferentes los iones metálicos de los elementos del cuarto período. Los metales pueden estar disponibles en las distintas valencias que les corresponden.

Si los compuestos de la fórmula (I) portan grupos hidroxilo, carboxi u otros grupos que inducen propiedades ácidas, estos compuestos se pueden transformar en sales usando bases. Bases adecuadas son por ejemplo hidróxidos, carbonatos, hidrocarbonatos de los metales alcalinos y alcalinotérreos, especialmente los de sodio, potasio, magnesio y calcio, además amoníaco, aminas primarias, secundarias y terciarias con grupos alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_4$), mono-, di- y trialcanolaminas de alcoholes ($\text{C}_1\text{-C}_4$), colina así como clorocolina.

Los compuestos de la fórmula general (I) dependiendo de la naturaleza y el enlace de los sustituyentes pueden estar presentes como estereoisómeros. Si, por ejemplo, existen uno o más átomos de carbono asimétricos o sulfóxidos, estos pueden ser enantiómeros y diaestereómeros. Los estereoisómeros se pueden obtener de las mezclas resultantes de la preparación usando procedimientos de separación usuales, por ejemplo mediante técnicas de separación cromatográfica. También es posible preparar estereoisómeros selectivamente usando reacciones estereoselectivas empleando materiales de partida y/o materiales auxiliares ópticamente activos. La invención también se refiere a todos los estereoisómeros y mezclas de los mismos incluidos en la fórmula general (I) pero no definidos específicamente.

En todas las fórmulas indicadas a continuación los sustituyentes y símbolos, salvo que se indique lo contrario, tienen el mismo significado que se describió en la fórmula (I).

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden preparar por ejemplo de acuerdo con el esquema siguiente mediante la reacción de acoplamiento catalizada con paladio de un compuesto halógeno (II) con un derivado de ácido borónico (III). En este esquema Het representa los heterociclos condensados en el anillo fenilo de los grupos A1 a A24. R representa hidrógeno o alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_3$).

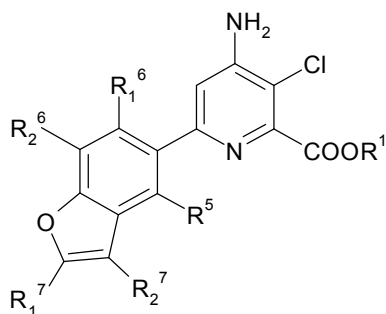


5 Los compuestos halógenos de la fórmula (II) se conocen por ejemplo de los documentos WO2001051468 A1 y WO2007082076 A1 o se pueden preparar según procedimientos en sí conocidos por el experto en la técnica. Los derivados del ácido borónico de la fórmula (III) se pueden obtener comercialmente o se pueden preparar según procedimientos en sí conocidos para el experto en la técnica.

Son preferentes los compuestos de la fórmula (I) indicados en las Tablas 1 a 44 que se pueden preparar de manera análoga a los procedimientos mencionados en el presente documento. Las abreviaturas usadas significan:

Et = etilo Me = metilo Pr = propilo Ph = fenilo

10 Tabla 1: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A1, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁶	R ⁷	R ⁷
1.001	H	H	H	H	H	H
1.002	H	F	H	H	H	H
1.003	H	F	H	H	Cl	H
1.004	H	F	H	H	H	Cl
1.005	H	F	H	H	Cl	Cl
1.006	H	F	H	H	Ph	H
1.007	H	F	H	H	Ph	Cl

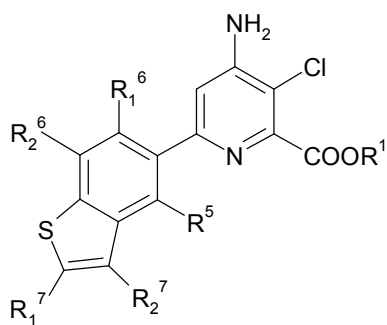
(continuación)

1.008	H	F	H	H	Ph	F
1.009	H	F	H	H	Me	H
1.010	H	F	H	H	Me	Cl
1.011	H	F	H	H	Me	F
1.012	Me	H	H	H	H	H
1.013	Me	F	H	H	H	H
1.014	Me	F	H	H	Cl	H
1.015	Me	F	H	H	H	Cl
1.016	Me	F	H	H	Cl	Cl
1.017	Me	F	H	H	H	F
1.018	Me	F	H	H	Ph	H
1.019	Me	F	H	H	Ph	Cl
1.020	Me	F	H	H	Ph	F
1.021	Me	F	H	H	Me	H
1.022	Me	F	H	H	Me	Cl
1.023	Me	F	H	H	Me	F
1.024	Et	H	H	H	H	H
1.025	Et	Cl	H	H	H	H
1.026	Et	Cl	H	H	Cl	H
1.027	Et	Cl	H	H	H	Cl
1.028	Et	Cl	H	H	Cl	Cl
1.029	Et	Cl	H	H	H	F
1.030	Et	Cl	H	H	Ph	H
1.031	Et	Cl	H	H	Ph	Cl
1.032	Et	Cl	H	H	Ph	F
1.033	Et	Cl	H	H	Me	H
1.034	Et	Cl	H	H	Me	Cl
1.035	Et	Cl	H	H	Me	F
1.036	H	F	F	H	H	H
1.037	H	F	H	F	H	H
1.038	Me	H	F	H	H	H

(continuación)

1.039	H	H	F	H	H	H
1.040	K	H	F	H	H	H
1.041	Me	H	Cl	H	H	H
1.042	H	H	Cl	H	H	H
1.043	K	H	Cl	H	H	H
1.044	Me	H	H	F	H	H
1.045	H	H	H	F	H	H
1.046	K	H	H	F	H	H
1.047	Me	H	H	Cl	H	H
1.048	H	H	H	Cl	H	H
1.049	K	H	H	Cl	H	H
1.050	K	F	H	H	H	H
1.051	Me	Cl	H	H	H	H
1.052	H	Cl	H	H	H	H
1.053	Na	Cl	H	H	H	H

Tabla 2: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A2, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



5

Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁶	R ⁷	R ⁷
2.001	H	H	H	H	H	H
2.002	H	F	H	H	H	H
2.003	H	F	H	H	Cl	H
2.004	H	F	H	H	H	Cl

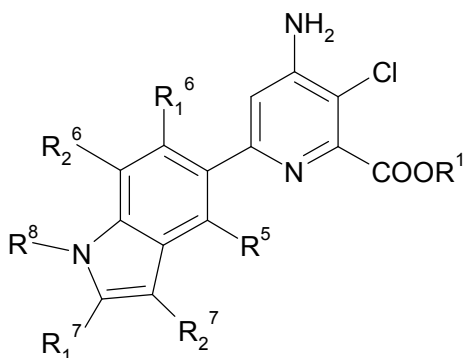
(continuación)

2.005	H	F	H	H	Cl	Cl
2.006	H	F	H	H	Ph	H
2.007	H	F	H	H	Ph	Cl
2.008	H	F	H	H	Ph	F
2.009	H	F	H	H	Me	H
2.010	H	F	H	H	Me	Cl
2.011	H	F	H	H	Me	F
2.012	Me	H	H	H	H	H
2.013	Me	F	H	H	H	H
2.014	Me	F	H	H	Cl	H
2.015	Me	F	H	H	H	Cl
2.016	Me	F	H	H	Cl	Cl
2.017	Me	F	H	H	H	F
2.018	Me	F	H	H	Ph	H
2.019	Me	F	H	H	Ph	Cl
2.020	Me	F	H	H	Ph	F
2.021	Me	F	H	H	Me	H
2.022	Me	F	H	H	Me	Cl
2.023	Me	F	H	H	Me	F
2.024	Et	H	H	H	H	H
2.025	Et	Cl	H	H	H	H
2.026	Et	Cl	H	H	Cl	H
2.027	Et	Cl	H	H	H	Cl
2.028	Et	Cl	H	H	Cl	Cl
2.029	Et	Cl	H	H	H	F
2.030	Et	Cl	H	H	Ph	H
2.031	Et	Cl	H	H	Ph	Cl
2.032	Et	Cl	H	H	Ph	F
2.033	Et	Cl	H	H	Me	H
2.034	Et	Cl	H	H	Me	Cl
2.035	Et	Cl	H	H	Me	F

(continuación)

2.036	H	F	F	H	H	H
2.037	H	F	H	F	H	H
2.038	Me	H	F	H	H	H
2.039	H	H	F	H	H	H
2.040	K	H	F	H	H	H
2.041	Me	H	Cl	H	H	H
2.042	H	H	Cl	H	H	H
2.043	K	H	Cl	H	H	H
2.044	Me	H	H	F	H	H
2.045	H	H	H	F	H	H
2.046	K	H	H	F	H	H
2.047	Me	H	H	Cl	H	H
2.048	H	H	H	Cl	H	H
2.049	K	H	H	Cl	H	H
2.050	K	F	H	H	H	H
2.051	Me	Cl	H	H	H	H
2.052	H	Cl	H	H	H	H
2.053	K	Cl	H	H	H	H

Tabla 3: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A3, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



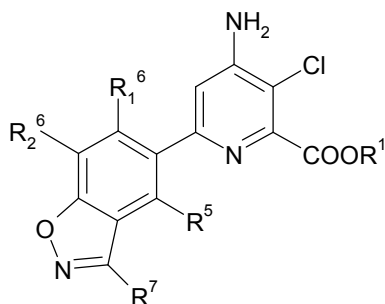
ES 2 561 887 T3

Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ₁ ⁷	R ₂ ⁷	R ⁸
3.001	H	H	H	H	H	H	H
3.002	H	F	H	H	H	H	Me
3.003	H	F	H	H	Cl	H	H
3.004	H	F	H	H	H	Cl	Me
3.005	H	F	H	H	Cl	Cl	Me
3.006	H	F	H	H	Ph	H	Me
3.007	H	F	H	H	Ph	Cl	H
3.008	H	F	H	H	Ph	F	H
3.009	H	F	H	H	Me	H	H
3.010	H	F	H	H	Me	Cl	Me
3.011	H	F	H	H	Me	F	Me
3.012	Me	H	H	H	H	H	Me
3.013	Me	F	H	H	H	H	H
3.014	Me	F	H	H	Cl	H	H
3.015	Me	F	H	H	H	Cl	Me
3.016	Me	F	H	H	Cl	Cl	Me
3.017	Me	F	H	H	H	F	Me
3.018	Me	F	H	H	Ph	H	H
3.019	Me	F	H	H	Ph	Cl	H
3.020	Me	F	H	H	Ph	F	H
3.021	Me	F	H	H	Me	H	H
3.022	Me	F	H	H	Me	Cl	Me
3.023	Me	F	H	H	Me	F	H
3.024	Et	H	H	H	H	H	Me
3.025	Et	Cl	H	H	H	H	Me
3.026	Et	Cl	H	H	Cl	H	Me
3.027	Et	Cl	H	H	H	Cl	Me
3.028	Et	Cl	H	H	Cl	Cl	Me
3.029	Et	Cl	H	H	H	F	Me
3.030	Et	Cl	H	H	Ph	H	H
3.031	Et	Cl	H	H	Ph	Cl	H

(continuación)

3.032	Et	Cl	H	H	Ph	F	H
3.033	Et	Cl	H	H	Me	H	H
3.034	Et	Cl	H	H	Me	Cl	H
3.035	Et	Cl	H	H	Me	F	Me
3.036	H	F	F	H	H	H	H
3.037	H	F	H	F	H	H	H

Tabla 4: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A4, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



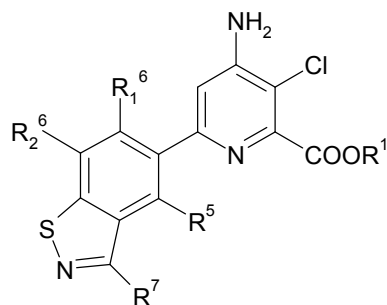
5

Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁵	R ⁷
4.001	H	H	H	H	H
4.002	H	F	H	H	H
4.003	H	F	H	H	F
4.004	H	F	H	H	Cl
4.005	H	F	H	H	Me
4.006	H	Cl	H	H	H
4.007	H	Cl	H	H	F
4.008	H	Cl	H	H	Cl
4.009	H	Cl	H	H	Me
4.010	Me	H	H	H	H
4.011	Me	F	H	H	H
4.012	Me	F	H	H	F
4.013	Me	F	H	H	Cl
4.014	Me	Cl	H	H	H

(continuación)

4.015	Me	Cl	H	H	F
4.016	Me	Cl	H	H	Cl
4.017	Me	Cl	H	H	Me
4.018	Et	H	H	H	H
4.019	Et	F	H	H	H
4.020	Et	Cl	H	H	H
4.021	Et	F	H	H	Me
4.022	Et	Cl	H	H	Me
4.023	H	F	F	H	H
4.024	H	F	H	F	H

Tabla 5: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A5, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



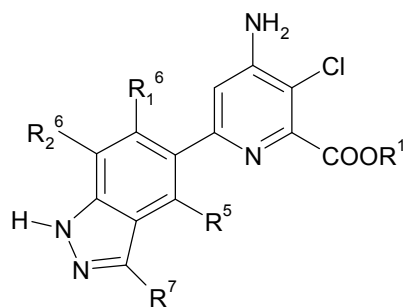
5

Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁶	R ⁷
5.001	H	H	H	H	H
5.002	H	F	H	H	H
5.003	H	F	H	H	F
5.004	H	F	H	H	Cl
5.005	H	F	H	H	F
5.006	H	Cl	H	H	H
5.007	H	Cl	H	H	F
5.008	H	Cl	H	H	Cl
5.009	H	Cl	H	H	Me
5.010	Me	H	H	H	H

(continuación)

5.011	Me	F	H	H	H
5.012	Me	F	H	H	Cl
5.013	Me	Cl	H	H	H
5.014	Me	Cl	H	H	F
5.015	Me	Cl	H	H	Cl
5.016	Me	Cl	H	H	Me
5.017	Et	H	H	H	H
5.018	Et	F	H	H	H
5.019	Et	Cl	H	H	H
5.020	Et	F	H	H	Me
5.021	Et	Cl	H	H	Me
5.022	H	F	F	H	H
5.023	H	F	H	F	H

Tabla 6: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A6, R⁸, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



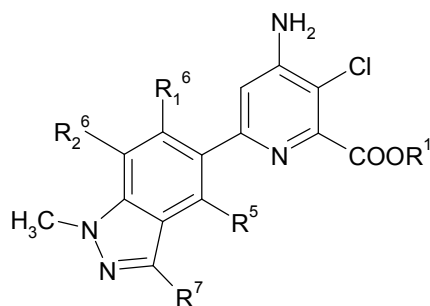
5

Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ¹ ₆	R ² ₆	R ⁷
6.001	H	H	H	H	H
6.002	H	F	H	H	H
6.003	H	F	H	H	Me
6.004	H	F	H	H	Et
6.005	H	H	H	H	Me
6.006	H	Cl	H	H	H

(continuación)

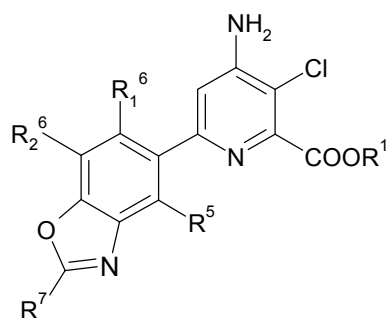
6.007	H	Cl	H	H	Me
6.008	H	Cl	H	H	Et
6.009	Me	H	H	H	H
6.010	Me	H	H	H	Me
6.011	Me	F	H	H	H
6.012	Me	F	H	H	Me
6.013	Me	F	H	H	Et
6.014	Me	Cl	H	H	H
6.015	Me	Cl	H	H	Me
6.016	Me	Cl	H	H	Et
6.017	Me	H	H	H	Me
6.018	Et	H	H	H	H
6.019	Et	H	H	H	Me
6.020	Et	H	H	H	Et
6.021	Et	F	H	H	H
6.022	Et	F	H	H	Me
6.023	Et	F	H	H	Et
6.024	Et	Cl	H	H	H
6.025	Et	Cl	H	H	Me
6.026	Et	Cl	H	H	Et
6.027	H	F	F	H	H
6.028	H	F	H	F	H

Tabla 7: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A6, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno, R⁸ representa metilo y R² representa cloro:



Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ⁷
7.001	H	H	H	H	H
7.002	H	F	H	H	H
7.003	H	F	H	H	Me
7.004	H	F	H	H	Et
7.005	H	H	H	H	Me
7.006	H	Cl	H	H	H
7.007	H	Cl	H	H	Me
7.008	H	Cl	H	H	Et
7.009	Me	H	H	H	H
7.010	Me	H	H	H	Me
7.011	Me	F	H	H	H
7.012	Me	F	H	H	Me
7.013	Me	F	H	H	Et
7.014	Me	Cl	H	H	H
7.015	Me	Cl	H	H	Me
7.016	Me	Cl	H	H	Et
7.017	Me	H	H	H	Me
7.018	Et	H	H	H	H
7.019	Et	H	H	H	Me
7.020	Et	H	H	H	Et
7.021	Et	F	H	H	H
7.022	Et	F	H	H	Me
7.023	Et	F	H	H	Et
7.024	Et	Cl	H	H	H
7.025	Et	Cl	H	H	Me
7.026	Et	Cl	H	H	Et
7.027	H	F	F	H	H
7.028	H	F	H	F	H

Tabla 8: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A7, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:

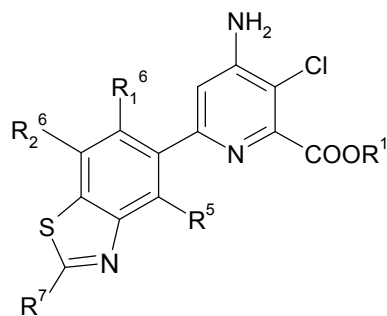


Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ⁷
8.001	H	H	H	H	H
8.002	H	H	H	H	Me
8.003	H	H	H	H	Ph
8.004	H	H	H	H	SMe
8.005	H	F	H	H	H
8.006	H	F	H	H	Me
8.007	H	F	H	H	Ph
8.008	H	F	H	H	SMe
8.009	H	Cl	H	H	H
8.010	H	Cl	H	H	Me
8.011	H	Cl	H	H	Ph
8.012	H	Cl	H	H	SMe
8.013	Me	H	H	H	H
8.014	Me	H	H	H	Me
8.015	Me	H	H	H	Ph
8.016	Me	H	H	H	SMe
8.017	Me	F	H	H	H
8.018	Me	F	H	H	Me
8.019	Me	F	H	H	Ph
8.020	Me	F	H	H	SMe
8.021	Me	Cl	H	H	H
8.022	Me	Cl	H	H	Me
8.023	Me	Cl	H	H	Ph
8.024	Me	Cl	H	H	SMe

(continuación)

8.025	Et	H	H	H	H
8.026	Et	H	H	H	Me
8.027	Et	H	H	H	Ph
8.028	Et	H	H	H	SMe
8.029	Et	F	H	H	H
8.030	Et	F	H	H	Me
8.031	Et	F	H	H	Ph
8.032	Et	F	H	H	SMe
8.033	Et	Cl	H	H	H
8.034	Et	Cl	H	H	Me
8.035	Et	Cl	H	H	Ph
8.036	Et	Cl	H	H	SMe
8.037	H	F	F	H	H
8.038	H	F	H	F	H

Tabla 9: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A8, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



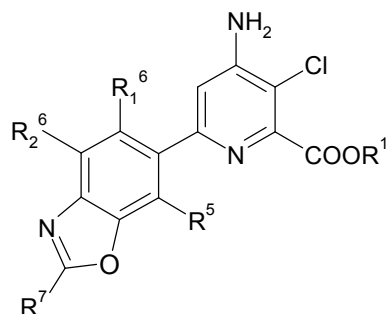
5

Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁶	R ⁷
9.001	H	H	H	H	H
9.002	H	H	H	H	Me
9.003	H	H	H	H	Ph
9.004	H	H	H	H	SMe
9.005	H	F	H	H	H

(continuación)

9.006	H	F	H	H	Me
9.007	H	F	H	H	Ph
9.008	H	F	H	H	SMe
9.009	H	Cl	H	H	H
9.010	H	Cl	H	H	Me
9.011	H	Cl	H	H	Ph
9.012	H	Cl	H	H	SMe
9.013	Me	H	H	H	H
9.014	Me	H	H	H	Me
9.015	Me	H	H	H	Ph
9.016	Me	H	H	H	SMe
9.017	Me	F	H	H	H
9.018	Me	F	H	H	Me
9.019	Me	F	H	H	Ph
9.020	Me	F	H	H	SMe
9.021	Me	Cl	H	H	H
9.022	Et	H	H	H	H
9.023	Et	H	H	H	Me
9.024	Et	H	H	H	Ph
9.025	Et	H	H	H	SMe
9.026	Et	F	H	H	H
9.027	Et	F	H	H	Me
9.028	Et	F	H	H	Ph
9.029	Et	F	H	H	SMe
9.030	Et	Cl	H	H	H
9.031	Et	Cl	H	H	Me
9.032	Et	Cl	H	H	Ph
9.033	Et	Cl	H	H	SMe
9.034	H	F	F	H	H
9.035	H	F	H	F	H

Tabla 10: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A⁹, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:

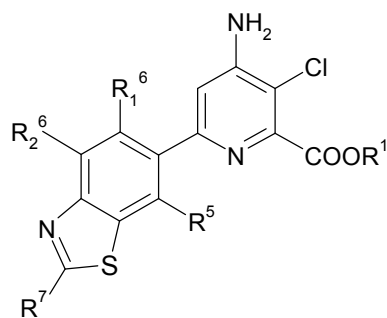


Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ⁷
10.001	H	H	H	H	H
10.002	H	H	H	H	Me
10.003	H	H	H	H	Ph
10.004	H	H	H	H	SMe
10.005	H	F	H	H	H
10.006	H	F	H	H	Me
10.007	H	F	H	H	Ph
10.008	H	F	H	H	SMe
10.009	H	Cl	H	H	H
10.010	H	Cl	H	H	Me
10.011	H	Cl	H	H	Ph
10.012	H	Cl	H	H	SMe
10.013	Me	H	H	H	H
10.014	Me	H	H	H	Me
10.015	Me	H	H	H	Ph
10.016	Me	H	H	H	SMe
10.017	Me	F	H	H	H
10.018	Me	F	H	H	Me
10.019	Me	F	H	H	Ph
10.020	Me	F	H	H	SMe
10.021	Me	Cl	H	H	H
10.022	Me	Cl	H	H	Me
10.023	Me	Cl	H	H	Ph

(continuación)

10.024	Me	Cl	H	H	SMe
10.025	Et	H	H	H	H
10.026	Et	H	H	H	Me
10.027	Et	H	H	H	Ph
10.028	Et	H	H	H	SMe
10.029	Et	F	H	H	H
10.030	Et	F	H	H	Me
10.031	Et	F	H	H	Ph
10.032	Et	F	H	H	SMe
10.033	Et	Cl	H	H	H
10.034	Et	Cl	H	H	Me
10.035	Et	Cl	H	H	Ph
10.036	Et	Cl	H	H	SMe
10.037	H	F	F	H	H
10.038	H	F	H	F	H

Tabla 11: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A10, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



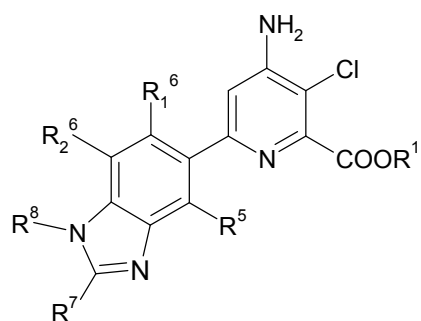
5

Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ⁷
11.001	H	H	H	H	H
11.002	H	H	H	H	Me
11.003	H	H	H	H	Ph
11.004	H	H	H	H	SMe
11.005	H	F	H	H	H

(continuación)

11.006	H	F	H	H	Me
11.007	H	F	H	H	Ph
11.008	H	F	H	H	SMe
11.009	H	Cl	H	H	H
11.010	H	Cl	H	H	Me
11.011	H	Cl	H	H	Ph
11.012	H	Cl	H	H	SMe
11.013	Me	H	H	H	H
11.014	Me	H	H	H	Me
11.015	Me	H	H	H	Ph
11.016	Me	H	H	H	SMe
11.017	Me	F	H	H	H
11.018	Me	F	H	H	Me
11.019	Me	F	H	H	Ph
11.020	Me	F	H	H	SMe
11.021	Me	Cl	H	H	H
11.022	Et	H	H	H	H
11.023	Et	H	H	H	Me
11.024	Et	H	H	H	Ph
11.025	Et	H	H	H	SMe
11.026	Et	F	H	H	H
11.027	Et	F	H	H	Me
11.028	Et	F	H	H	Ph
11.029	Et	F	H	H	SMe
11.030	Et	Cl	H	H	H
11.031	Et	Cl	H	H	Me
11.032	Et	Cl	H	H	Ph
11.033	Et	Cl	H	H	SMe
11.034	H	F	F	H	H
11.035	H	F	H	F	H

Tabla 12: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A11, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:

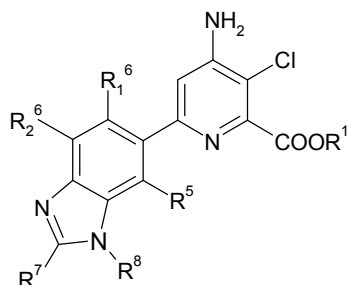


Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ⁶ ₁	R ⁶ ₂	R ⁷	R ⁸
12.001	H	H	H	H	H	H
12.002	H	F	H	H	H	H
12.003	H	F	H	H	H	Me
12.004	H	F	H	H	Me	H
12.005	H	F	H	H	Me	Me
12.006	H	Cl	H	H	H	H
12.007	H	Cl	H	H	H	Me
12.008	H	Cl	H	H	Me	H
12.009	H	Cl	H	H	Me	Me
12.010	H	H	H	H	Ph	H
12.011	H	H	H	H	Ph	Me
12.012	H	F	H	H	Ph	H
12.013	H	F	H	H	Ph	Me
12.014	H	Cl	H	H	Ph	H
12.015	H	Cl	H	H	Ph	Me
12.016	H	H	H	H	Me	H
12.017	H	H	H	H	H	Me
12.018	H	H	H	H	Me	Me
12.019	Me	H	H	H	H	H
12.020	Me	F	H	H	H	H
12.021	Me	F	H	H	H	Me
12.022	Me	F	H	H	Me	H
12.023	Me	F	H	H	Me	Me

(continuación)

12.024	Me	Cl	H	H	H	H
12.025	Me	Cl	H	H	H	Me
12.026	Me	Cl	H	H	Me	H
12.027	Me	Cl	H	H	Me	Me
12.028	Me	H	H	H	Ph	H
12.029	Me	H	H	H	Ph	Me
12.030	Me	F	H	H	Ph	H
12.031	Me	F	H	H	Ph	Me
12.032	Me	Cl	H	H	Ph	H
12.033	Me	Cl	H	H	Ph	Me
12.034	Me	H	H	H	Me	H
12.035	Me	H	H	H	H	Me
12.036	Me	H	H	H	Me	Me
12.037	Et	H	H	H	H	H
12.038	Et	F	H	H	H	H
12.039	Et	F	H	H	H	Me
12.040	Et	F	H	H	Me	H
12.041	Et	F	H	H	Me	Me
12.042	Et	Cl	H	H	H	H
12.043	Et	Cl	H	H	H	Me
12.044	Et	Cl	H	H	Me	H
12.045	Et	H	H	H	Ph	H
12.046	Et	H	H	H	Ph	Me
12.047	Et	F	H	H	Ph	H
12.048	Et	F	H	H	Ph	Me
12.049	Et	Cl	H	H	Ph	H
12.050	Et	Cl	H	H	Ph	Me
12.051	Et	H	H	H	Me	H
12.052	Et	H	H	H	H	Me
12.053	Me	H	H	H	Me	Me
12.054	H	F	F	H	H	H
12.055	H	F	H	F	H	H

Tabla 13: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A12, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:

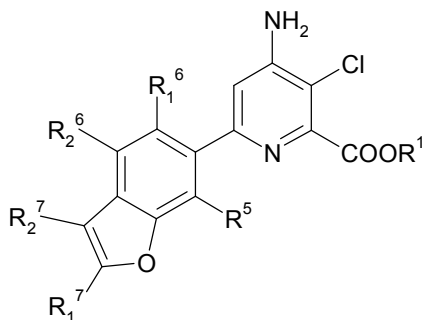


Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ²	R ⁷	R ⁸
13.001	H	H	H	H	H	Me
13.002	H	F	H	H	H	Me
13.003	H	F	H	H	Me	Me
13.004	H	Cl	H	H	H	Me
13.005	H	Cl	H	H	Me	Me
13.006	H	H	H	H	Ph	Me
13.007	H	F	H	H	Ph	Me
13.008	H	Cl	H	H	Ph	Me
13.009	H	H	H	H	H	Me
13.010	Me	H	H	H	H	Me
13.011	Me	F	H	H	H	Me
13.012	Me	H	H	H	Me	Me
13.013	Me	F	H	H	Me	Me
13.014	Me	Cl	H	H	H	Me
13.015	Me	Cl	H	H	Me	Me
13.016	Me	H	H	H	Ph	Me
13.017	Me	F	H	H	Ph	Me
13.018	Me	Cl	H	H	Ph	Me
13.019	Et	F	H	H	H	Me
13.020	Et	F	H	H	Me	Me
13.021	Et	Cl	H	H	H	Me
13.022	Et	H	H	H	Ph	Me

(continuación)

13.023	Et	F	H	H	Ph	Me
13.024	Et	Cl	H	H	Ph	Me
13.025	Et	H	H	H	H	Me
13.026	Me	H	H	H	Me	Me
13.027	Et	Cl	H	H	Me	Me
13.028	H	F	F	H	H	H
13.029	H	F	H	F	H	H

Tabla 14: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A13, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



5

Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁶	R ⁷	R ⁷
14.001	H	H	H	H	H	H
14.002	H	H	H	H	H	Cl
14.003	H	H	H	H	H	F
14.004	H	H	H	H	H	Me
14.005	H	H	H	H	F	H
14.006	H	H	H	H	F	Cl
14.007	H	H	H	H	F	F
14.008	H	H	H	H	F	Me
14.009	H	H	H	H	Cl	H
14.010	H	H	H	H	Cl	F
14.011	H	H	H	H	Cl	Cl
14.012	H	H	H	H	Cl	Me
14.013	H	H	H	H	Me	H

(continuación)

14.014	H	H	H	H	Me	Cl
14.015	H	H	H	H	Me	F
14.016	H	H	H	H	Me	Me
14.017	H	H	H	H	Ph	H
14.018	H	H	H	H	Ph	Cl
14.019	H	H	H	H	Ph	F
14.020	H	H	H	H	Ph	Me
14.021	H	F	H	H	H	H
14.022	H	F	H	H	H	Cl
14.023	H	F	H	H	H	F
14.024	H	F	H	H	H	Me
14.025	H	F	H	H	F	H
14.026	H	F	H	H	F	F
14.027	H	F	H	H	F	Cl
14.028	H	F	H	H	F	Me
14.029	H	F	H	H	Cl	H
14.030	H	F	H	H	Cl	Cl
14.031	H	F	H	H	Cl	F
14.032	H	F	H	H	Cl	Me
14.033	H	F	H	H	Me	H
14.034	H	F	H	H	Me	Cl
14.035	H	F	H	H	Me	F
14.036	H	F	H	H	Me	Me
14.037	H	F	H	H	Ph	H
14.038	H	F	H	H	Ph	Cl
14.039	H	F	H	H	Ph	F
14.040	H	F	H	H	Ph	Me
14.041	H	Cl	H	H	H	H
14.042	H	Cl	H	H	H	Cl
14.043	H	Cl	H	H	H	F
14.044	H	Cl	H	H	H	Me

(continuación)

14.045	H	Cl	H	H	F	H
14.046	H	Cl	H	H	F	Cl
14.047	H	Cl	H	H	F	F
14.048	H	Cl	H	H	F	Me
14.049	H	Cl	H	H	Cl	H
14.050	H	Cl	H	H	Cl	F
14.051	H	Cl	H	H	Cl	Cl
14.052	H	Cl	H	H	Cl	Me
14.053	H	Cl	H	H	Me	H
14.054	H	Cl	H	H	Me	Cl
14.055	H	Cl	H	H	Me	F
14.056	H	Cl	H	H	Me	Me
14.057	H	Cl	H	H	Ph	H
14.058	H	Cl	H	H	Ph	Cl
14.059	H	Cl	H	H	Ph	F
14.060	H	Cl	H	H	Ph	Me
14.061	Me	H	H	H	H	H
14.062	Me	H	H	H	H	Cl
14.063	Me	H	H	H	H	F
14.064	Me	H	H	H	H	Me
14.065	Me	H	H	H	F	H
14.066	Me	H	H	H	F	Cl
14.067	Me	H	H	H	F	F
14.068	Me	H	H	H	F	Me
14.069	Me	H	H	H	Cl	H
14.070	Me	H	H	H	Cl	F
14.071	Me	H	H	H	Cl	Cl
14.072	Me	H	H	H	Cl	Me
14.073	Me	H	H	H	Me	H
14.074	Me	H	H	H	Me	Cl
14.075	Me	H	H	H	Me	F

(continuación)

14.076	Me	H	H	H	Me	Me
14.077	Me	H	H	H	Ph	H
14.078	Me	H	H	H	Ph	Cl
14.079	Me	H	H	H	Ph	F
14.080	Me	H	H	H	Ph	Me
14.081	Me	F	H	H	H	H
14.082	Me	F	H	H	H	Cl
14.083	Me	F	H	H	H	F
14.084	Me	F	H	H	H	Me
14.085	Me	F	H	H	F	H
14.086	Me	F	H	H	F	Cl
14.087	Me	F	H	H	F	F
14.088	Me	F	H	H	F	Me
14.089	Me	F	H	H	Cl	H
14.090	Me	F	H	H	Cl	F
14.091	Me	F	H	H	Cl	Cl
14.092	Me	F	H	H	Cl	Me
14.093	Me	F	H	H	Me	H
14.094	Me	F	H	H	Me	Cl
14.095	Me	F	H	H	Me	F
14.096	Me	F	H	H	Me	Me
14.097	Me	F	H	H	Ph	H
14.098	Me	F	H	H	Ph	Cl
14.099	Me	F	H	H	Ph	F
14.100	Me	F	H	H	Ph	Me
14.101	Me	Cl	H	H	H	H
14.102	Me	Cl	H	H	H	Cl
14.103	Me	Cl	H	H	H	F
14.104	Me	Cl	H	H	H	Me
14.105	Me	Cl	H	H	F	H
14.106	Me	Cl	H	H	F	Cl

(continuación)

14.107	Me	Cl	H	H	F	F
14.108	Me	Cl	H	H	F	Me
14.109	Me	Cl	H	H	Cl	H
14.110	Me	Cl	H	H	Cl	F
14.111	Me	Cl	H	H	Cl	Cl
14.112	Me	Cl	H	H	Cl	Me
14.113	Me	Cl	H	H	Me	H
14.114	Me	Cl	H	H	Me	Cl
14.115	Me	Cl	H	H	Me	F
14.116	Me	Cl	H	H	Me	Me
14.117	Me	Cl	H	H	Ph	H
14.118	Me	Cl	H	H	Ph	Cl
14.119	Me	Cl	H	H	Ph	F
14.120	Me	Cl	H	H	Ph	Me
14.121	Et	H	H	H	H	H
14.122	Et	H	H	H	H	Cl
14.123	Et	H	H	H	H	F
14.124	Et	H	H	H	H	Me
14.125	Et	H	H	H	F	H
14.126	Et	H	H	H	F	Cl
14.127	Et	H	H	H	F	F
14.128	Et	H	H	H	F	Me
14.129	Et	H	H	H	Cl	H
14.130	Et	H	H	H	Cl	F
14.131	Et	H	H	H	Cl	Cl
14.132	Et	H	H	H	Cl	Me
14.133	Et	H	H	H	Me	H
14.134	Et	H	H	H	Me	Cl
14.135	Et	H	H	H	Me	F
14.136	Et	H	H	H	Me	Me
14.137	Et	H	H	H	Ph	H

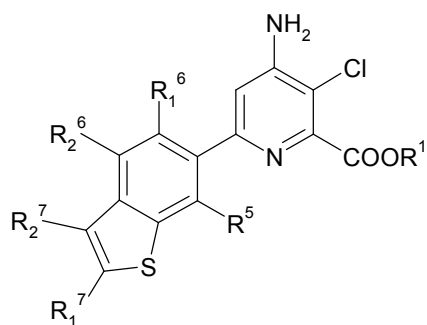
(continuación)

14.138	Et	H	H	H	Ph	Cl
14.139	Et	H	H	H	Ph	F
14.140	Et	H	H	H	Ph	Me
14.141	Et	F	H	H	H	H
14.142	Et	F	H	H	H	Cl
14.143	Et	F	H	H	H	F
14.144	Et	F	H	H	H	Me
14.145	Et	F	H	H	F	H
14.146	Et	F	H	H	F	Cl
14.147	Et	F	H	H	F	F
14.148	Et	F	H	H	F	Me
14.149	Et	F	H	H	Cl	H
14.150	Et	F	H	H	Cl	F
14.151	Et	F	H	H	Cl	Cl
14.152	Et	F	H	H	Cl	Me
14.153	Et	F	H	H	Me	H
14.154	Et	F	H	H	Me	Cl
14.155	Et	F	H	H	Me	F
14.156	Et	F	H	H	Me	Me
14.157	Et	F	H	H	Ph	H
14.158	Et	F	H	H	Ph	Cl
14.159	Et	F	H	H	Ph	F
14.160	Et	F	H	H	Ph	Me
14.161	Et	Cl	H	H	H	H
14.162	Et	Cl	H	H	H	Cl
14.163	Et	Cl	H	H	H	F
14.164	Et	Cl	H	H	H	Me
14.165	Et	Cl	H	H	F	H
14.166	Et	Cl	H	H	F	Cl
14.167	Et	Cl	H	H	F	F
14.168	Et	Cl	H	H	F	Me

(continuación)

14.169	Et	Cl	H	H	Cl	H
14.170	Et	Cl	H	H	Cl	F
14.171	Et	Cl	H	H	Cl	Cl
14.172	Et	Cl	H	H	Cl	Me
14.173	Et	Cl	H	H	Me	H
14.174	Et	Cl	H	H	Me	Cl
14.175	Et	Cl	H	H	Me	F
14.176	Et	Cl	H	H	Me	Me
14.177	Et	Cl	H	H	Ph	H
14.178	Et	Cl	H	H	Ph	Cl
14.179	Et	Cl	H	H	Ph	F
14.180	Et	Cl	H	H	Ph	Me
14.181	H	F	F	H	H	H
14.182	H	F	H	F	H	H
14.183	Me	H	F	H	H	H
14.184	H	H	F	H	H	H
14.185	K	H	F	H	H	H
14.186	Me	H	Cl	H	H	H
14.187	H	H	Cl	H	H	H
14.188	K	H	Cl	H	H	H
14.189	Me	H	H	F	H	H
14.190	H	H	H	F	H	H
14.191	K	H	H	F	H	H
14.192	Me	H	H	Cl	H	H
14.193	H	H	H	Cl	H	H
14.194	K	H	H	Cl	H	H
14.195	K	F	H	H	H	H
14.196	K	Cl	H	H	H	H

Tabla 15: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A14, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ₁ ⁷	R ₂ ⁷
15.001	H	H	H	H	H	H
15.002	H	H	H	H	H	Cl
15.003	H	H	H	H	H	F
15.004	H	H	H	H	H	Me
15.005	H	H	H	H	F	H
15.006	H	H	H	H	F	Cl
15.007	H	H	H	H	F	F
15.008	H	H	H	H	F	Me
15.009	H	H	H	H	Cl	H
15.010	H	H	H	H	Cl	F
15.011	H	H	H	H	Cl	Cl
15.012	H	H	H	H	Cl	Me
15.013	H	H	H	H	Me	H
15.014	H	H	H	H	Me	Cl
15.015	H	H	H	H	Me	F
15.016	H	H	H	H	Me	Me
15.017	H	H	H	H	Ph	H
15.018	H	H	H	H	Ph	Cl
15.019	H	H	H	H	Ph	F
15.020	H	H	H	H	Ph	Me
15.021	H	F	H	H	H	H
15.022	H	F	H	H	H	Cl
15.023	H	F	H	H	H	F
15.024	H	F	H	H	H	Me

(continuación)

15.025	H	F	H	H	F	H
15.026	H	F	H	H	F	Cl
15.027	H	F	H	H	F	F
15.028	H	F	H	H	F	Me
15.029	H	F	H	H	Cl	H
15.030	H	F	H	H	Cl	F
15.031	H	F	H	H	Cl	Cl
15.032	H	F	H	H	Cl	Me
15.033	H	F	H	H	Me	H
15.034	H	F	H	H	Me	Cl
15.035	H	F	H	H	Me	F
15.036	H	F	H	H	Me	Me
15.037	H	F	H	H	Ph	H
15.038	H	F	H	H	Ph	Cl
15.039	H	F	H	H	Ph	F
15.040	H	F	H	H	Ph	Me
15.041	H	Cl	H	H	H	H
15.042	H	Cl	H	H	H	Cl
15.043	H	Cl	H	H	H	F
15.044	H	Cl	H	H	H	Me
15.045	H	Cl	H	H	F	H
15.046	H	Cl	H	H	F	Cl
15.047	H	Cl	H	H	F	F
15.048	H	Cl	H	H	F	Me
15.049	H	Cl	H	H	Cl	H
15.050	H	Cl	H	H	Cl	F
15.051	H	Cl	H	H	Cl	Cl
15.052	H	Cl	H	H	Cl	Me
15.053	H	Cl	H	H	Me	H
15.054	H	Cl	H	H	Me	Cl
15.055	H	Cl	H	H	Me	F

(continuación)

15.056	H	Cl	H	H	Me	Me
15.057	H	Cl	H	H	Ph	H
15.058	H	Cl	H	H	Ph	Cl
15.059	H	Cl	H	H	Ph	F
15.060	H	Cl	H	H	Ph	Me
15.061	Me	H	H	H	H	H
15.062	Me	H	H	H	H	Cl
15.063	Me	H	H	H	H	F
15.064	Me	H	H	H	H	Me
15.065	Me	H	H	H	F	H
15.066	Me	H	H	H	F	Cl
15.067	Me	H	H	H	F	F
15.068	Me	H	H	H	F	Me
15.069	Me	H	H	H	Cl	H
15.070	Me	H	H	H	Cl	F
15.071	Me	H	H	H	Cl	Cl
15.072	Me	H	H	H	Cl	Me
15.073	Me	H	H	H	Me	H
15.074	Me	H	H	H	Me	Cl
15.075	Me	H	H	H	Me	F
15.076	Me	H	H	H	Me	Me
15.077	Me	H	H	H	Ph	H
15.078	Me	H	H	H	Ph	Cl
15.079	Me	H	H	H	Ph	F
15.080	Me	H	H	H	Ph	Me
15.081	Me	F	H	H	H	H
15.082	Me	F	H	H	H	Cl
15.083	Me	F	H	H	H	F
15.084	Me	F	H	H	H	Me
15.085	Me	F	H	H	F	H
15.086	Me	F	H	H	F	Cl

(continuación)

15.087	Me	F	H	H	F	F
15.088	Me	F	H	H	F	Me
15.089	Me	F	H	H	Cl	H
15.090	Me	F	H	H	Cl	F
15.091	Me	F	H	H	Cl	Cl
15.092	Me	F	H	H	Cl	Me
15.093	Me	F	H	H	Me	H
15.094	Me	F	H	H	Me	Cl
15.095	Me	F	H	H	Me	F
15.096	Me	F	H	H	Me	Me
15.097	Me	F	H	H	Ph	H
15.098	Me	F	H	H	Ph	Cl
15.099	Me	F	H	H	Ph	F
15.100	Me	F	H	H	Ph	Me
15.101	Me	Cl	H	H	H	H
15.102	Me	Cl	H	H	H	Cl
15.103	Me	Cl	H	H	H	F
15.104	Me	Cl	H	H	H	Me
15.105	Me	Cl	H	H	F	H
15.106	Me	Cl	H	H	F	Cl
15.107	Me	Cl	H	H	F	F
15.108	Me	Cl	H	H	F	Me
15.109	Me	Cl	H	H	Cl	H
15.110	Me	Cl	H	H	Cl	F
15.111	Me	Cl	H	H	Cl	Cl
15.112	Me	Cl	H	H	Cl	Me
15.113	Me	Cl	H	H	Me	H
15.114	Me	Cl	H	H	Me	Cl
15.115	Me	Cl	H	H	Me	F
15.116	Me	Cl	H	H	Me	Me
15.117	Me	Cl	H	H	Ph	H

(continuación)

15.118	Me	Cl	H	H	Ph	Cl
15.119	Me	Cl	H	H	Ph	F
15.120	Me	Cl	H	H	Ph	Me
15.121	Et	H	H	H	H	H
15.122	Et	H	H	H	H	Cl
15.123	Et	H	H	H	H	F
15.124	Et	H	H	H	H	Me
15.125	Et	H	H	H	F	H
15.126	Et	H	H	H	F	Cl
15.127	Et	H	H	H	F	F
15.128	Et	H	H	H	F	Me
15.129	Et	H	H	H	Cl	H
15.130	Et	H	H	H	Cl	F
15.131	Et	H	H	H	Cl	Cl
15.132	Et	H	H	H	Cl	Me
15.133	Et	H	H	H	Me	H
15.134	Et	H	H	H	Me	Cl
15.135	Et	H	H	H	Me	F
15.136	Et	H	H	H	Me	Me
15.137	Et	H	H	H	Ph	H
15.138	Et	H	H	H	Ph	Cl
15.139	Et	H	H	H	Ph	F
15.140	Et	H	H	H	Ph	Me
15.141	Et	F	H	H	H	H
15.142	Et	F	H	H	H	Cl
15.143	Et	F	H	H	H	F
15.144	Et	F	H	H	H	Me
15.145	Et	F	H	H	F	H
15.146	Et	F	H	H	F	Cl
15.147	Et	F	H	H	F	F
15.148	Et	F	H	H	F	Me

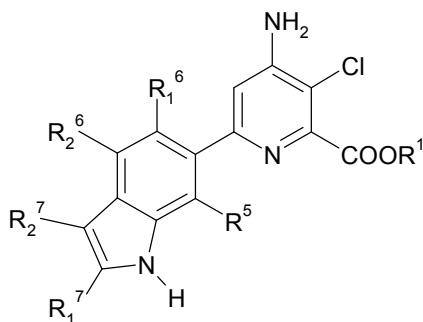
(continuación)

15.149	Et	F	H	H	Cl	H
15.150	Et	F	H	H	Cl	F
15.151	Et	F	H	H	Cl	Cl
15.152	Et	F	H	H	Cl	Me
15.153	Et	F	H	H	Me	H
15.154	Et	F	H	H	Me	Cl
15.155	Et	F	H	H	Me	F
15.156	Et	F	H	H	Me	Me
15.157	Et	F	H	H	Ph	H
15.158	Et	F	H	H	Ph	Cl
15.159	Et	F	H	H	Ph	F
15.160	Et	F	H	H	Ph	Me
15.161	Et	Cl	H	H	H	H
15.162	Et	Cl	H	H	H	Cl
15.163	Et	Cl	H	H	H	F
15.164	Et	Cl	H	H	H	Me
15.165	Et	Cl	H	H	F	H
15.166	Et	Cl	H	H	F	Cl
15.167	Et	Cl	H	H	F	F
15.168	Et	Cl	H	H	F	Me
15.169	Et	Cl	H	H	Cl	H
15.170	Et	Cl	H	H	Cl	F
15.171	Et	Cl	H	H	Cl	Cl
15.172	Et	Cl	H	H	Cl	Me
15.173	Et	Cl	H	H	Me	H
15.174	Et	Cl	H	H	Me	Cl
15.175	Et	Cl	H	H	Me	F
15.176	Et	Cl	H	H	Me	Me
15.177	Et	Cl	H	H	Ph	H
15.178	Et	Cl	H	H	Ph	Cl
15.179	Et	Cl	H	H	Ph	F

(continuación)

15.180	Et	Cl	H	H	Ph	Me
15.181	H	F	F	H	H	H
15.182	H	F	H	F	H	H
15.183	Me	H	F	H	H	H
15.184	H	H	F	H	H	H
15.185	K	H	F	H	H	H
15.186	Me	H	Cl	H	H	H
15.187	H	H	Cl	H	H	H
15.188	K	H	Cl	H	H	H
15.189	Me	H	H	F	H	H
15.190	H	H	H	F	H	H
15.191	K	H	H	F	H	H
15.192	Me	H	H	Cl	H	H
15.193	H	H	H	Cl	H	H
15.194	K	H	H	Cl	H	H
15.195	K	F	H	H	H	H
15.196	K	Cl	H	H	H	H

Tabla 16: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A15, R⁶, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ₁ ⁷	R ₂ ⁷
16.001	H	H	H	H	H	H
16.002	H	H	H	H	H	Cl
16.003	H	H	H	H	H	F
16.004	H	H	H	H	H	Me

(continuación)

16.005	H	H	H	H	F	H
16.006	H	H	H	H	F	Cl
16.007	H	H	H	H	F	F
16.008	H	H	H	H	F	Me
16.009	H	H	H	H	Cl	H
16.010	H	H	H	H	Cl	F
16.011	H	H	H	H	Cl	Cl
16.012	H	H	H	H	Cl	Me
16.013	H	H	H	H	Me	H
16.014	H	H	H	H	Me	Cl
16.015	H	H	H	H	Me	F
16.016	H	H	H	H	Me	Me
16.017	H	H	H	H	Ph	H
16.018	H	H	H	H	Ph	Cl
16.019	H	H	H	H	Ph	F
16.020	H	H	H	H	Ph	Me
16.021	H	F	H	H	H	H
16.022	H	F	H	H	H	Cl
16.023	H	F	H	H	H	F
16.024	H	F	H	H	H	Me
16.025	H	F	H	H	F	H
16.026	H	F	H	H	F	Cl
16.027	H	F	H	H	F	F
16.028	H	F	H	H	F	Me
16.029	H	F	H	H	Cl	H
16.030	H	F	H	H	Cl	F
16.031	H	F	H	H	Cl	Cl
16.032	H	F	H	H	Cl	Me
16.033	H	F	H	H	Me	H
16.034	H	F	H	H	Me	Cl
16.035	H	F	H	H	Me	F

(continuación)

16.036	H	F	H	H	Me	Me
16.037	H	F	H	H	Ph	H
16.038	H	F	H	H	Ph	Cl
16.039	H	F	H	H	Ph	F
16.040	H	F	H	H	Ph	Me
16.041	H	Cl	H	H	H	H
16.042	H	Cl	H	H	H	Cl
16.043	H	Cl	H	H	H	F
16.044	H	Cl	H	H	H	Me
16.045	H	Cl	H	H	F	H
16.046	H	Cl	H	H	F	Cl
16.047	H	Cl	H	H	F	F
16.048	H	Cl	H	H	F	Me
16.049	H	Cl	H	H	Cl	H
16.050	H	Cl	H	H	Cl	F
16.051	H	Cl	H	H	Cl	Cl
16.052	H	Cl	H	H	Cl	Me
16.053	H	Cl	H	H	Me	H
16.054	H	Cl	H	H	Me	Cl
16.055	H	Cl	H	H	Me	F
16.056	H	Cl	H	H	Me	Me
16.057	H	Cl	H	H	Ph	H
16.058	H	Cl	H	H	Ph	Cl
16.059	H	Cl	H	H	Ph	F
16.060	H	Cl	H	H	Ph	Me
16.061	Me	H	H	H	H	H
16.062	Me	H	H	H	H	Cl
16.063	Me	H	H	H	H	F
16.064	Me	H	H	H	H	Me
16.065	Me	H	H	H	F	H
16.066	Me	H	H	H	F	Cl

(continuación)

16.067	Me	H	H	H	F	F
16.068	Me	H	H	H	F	Me
16.069	Me	H	H	H	Cl	H
16.070	Me	H	H	H	Cl	F
16.071	Me	H	H	H	Cl	Cl
16.072	Me	H	H	H	Cl	Me
16.073	Me	H	H	H	Me	H
16.074	Me	H	H	H	Me	Cl
16.075	Me	H	H	H	Me	F
16.076	Me	H	H	H	Me	Me
16.077	Me	H	H	H	Ph	H
16.078	Me	H	H	H	Ph	Cl
16.079	Me	H	H	H	Ph	F
16.080	Me	H	H	H	Ph	Me
16.081	Me	F	H	H	H	H
16.082	Me	F	H	H	H	Cl
16.083	Me	F	H	H	H	F
16.084	Me	F	H	H	H	Me
16.085	Me	F	H	H	F	H
16.086	Me	F	H	H	F	Cl
16.087	Me	F	H	H	F	F
16.088	Me	F	H	H	F	Me
16.089	Me	F	H	H	Cl	H
16.090	Me	F	H	H	Cl	F
16.091	Me	F	H	H	Cl	Cl
16.092	Me	F	H	H	Cl	Me
16.093	Me	F	H	H	Me	H
16.094	Me	F	H	H	Me	Cl
16.095	Me	F	H	H	Me	F
16.096	Me	F	H	H	Me	Me
16.097	Me	F	H	H	Ph	H

(continuación)

16.098	Me	F	H	H	Ph	Cl
16.099	Me	F	H	H	Ph	F
16.100	Me	F	H	H	Ph	Me
16.101	Me	Cl	H	H	H	H
16.102	Me	Cl	H	H	H	Cl
16.103	Me	Cl	H	H	H	F
16.104	Me	Cl	H	H	H	Me
16.105	Me	Cl	H	H	F	H
16.106	Me	Cl	H	H	F	Cl
16.107	Me	Cl	H	H	F	F
16.108	Me	Cl	H	H	F	Me
16.109	Me	Cl	H	H	Cl	H
16.110	Me	Cl	H	H	Cl	F
16.111	Me	Cl	H	H	Cl	Cl
16.112	Me	Cl	H	H	Cl	Me
16.113	Me	Cl	H	H	Me	H
16.114	Me	Cl	H	H	Me	Cl
16.115	Me	Cl	H	H	Me	F
16.116	Me	Cl	H	H	Me	Me
16.117	Me	Cl	H	H	Ph	H
16.118	Me	Cl	H	H	Ph	Cl
16.119	Me	Cl	H	H	Ph	F
16.120	Me	Cl	H	H	Ph	Me
16.121	Et	H	H	H	H	H
16.122	Et	H	H	H	H	Cl
16.123	Et	H	H	H	H	F
16.124	Et	H	H	H	H	Me
16.125	Et	H	H	H	F	H
16.126	Et	H	H	H	F	Cl
16.127	Et	H	H	H	F	F
16.128	Et	H	H	H	F	Me

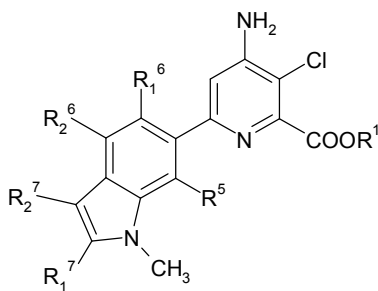
(continuación)

16.129	Et	H	H	H	Cl	H
16.130	Et	H	H	H	Cl	F
16.131	Et	H	H	H	Cl	Cl
16.132	Et	H	H	H	Cl	Me
16.133	Et	H	H	H	Me	H
16.134	Et	H	H	H	Me	Cl
16.135	Et	H	H	H	Me	F
16.136	Et	H	H	H	Me	Me
16.137	Et	H	H	H	Ph	H
16.138	Et	H	H	H	Ph	Cl
16.139	Et	H	H	H	Ph	F
16.140	Et	H	H	H	Ph	Me
16.141	Et	F	H	H	H	H
16.142	Et	F	H	H	H	Cl
16.143	Et	F	H	H	H	F
16.144	Et	F	H	H	H	Me
16.145	Et	F	H	H	F	H
16.146	Et	F	H	H	F	Cl
16.147	Et	F	H	H	F	F
16.148	Et	F	H	H	F	Me
16.149	Et	F	H	H	Cl	H
16.150	Et	F	H	H	Cl	F
16.151	Et	F	H	H	Cl	Cl
16.152	Et	F	H	H	Cl	Me
16.153	Et	F	H	H	Me	H
16.154	Et	F	H	H	Me	Cl
16.155	Et	F	H	H	Me	F
16.156	Et	F	H	H	Me	Me
16.157	Et	F	H	H	Ph	H
16.158	Et	F	H	H	Ph	Cl
16.159	Et	F	H	H	Ph	F

(continuación)

16.160	Et	F	H	H	Ph	Me
16.161	Et	Cl	H	H	H	H
16.162	Et	Cl	H	H	H	Cl
16.163	Et	Cl	H	H	H	F
16.164	Et	Cl	H	H	H	Me
16.165	Et	Cl	H	H	F	H
16.166	Et	Cl	H	H	F	Cl
16.167	Et	Cl	H	H	F	F
16.168	Et	Cl	H	H	F	Me
16.169	Et	Cl	H	H	Cl	H
16.170	Et	Cl	H	H	Cl	F
16.171	Et	Cl	H	H	Cl	Cl
16.172	Et	Cl	H	H	Cl	Me
16.173	Et	Cl	H	H	Me	H
16.174	Et	Cl	H	H	Me	Cl
16.175	Et	Cl	H	H	Me	F
16.176	Et	Cl	H	H	Me	Me
16.177	Et	Cl	H	H	Ph	H
16.178	Et	Cl	H	H	Ph	Cl
16.179	Et	Cl	H	H	Ph	F
16.180	Et	Cl	H	H	Ph	Me
16.181	H	F	F	H	H	H
16.182	H	F	H	F	H	H

Tabla 17: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A15, R⁸ representa metilo, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ₁ ⁷	R ₂ ⁷
17.001	H	H	H	H	H	H
17.002	H	H	H	H	H	Cl
17.003	H	H	H	H	H	F
17.004	H	H	H	H	H	Me
17.005	H	H	H	H	F	H
17.006	H	H	H	H	F	Cl
17.007	H	H	H	H	F	F
17.008	H	H	H	H	F	Me
17.009	H	H	H	H	Cl	H
17.010	H	H	H	H	Cl	F
17.011	H	H	H	H	Cl	Cl
17.012	H	H	H	H	Cl	Me
17.013	H	H	H	H	Me	H
17.014	H	H	H	H	Me	Cl
17.015	H	H	H	H	Me	F
17.016	H	H	H	H	Me	Me
17.017	H	H	H	H	Ph	H
17.018	H	H	H	H	Ph	Cl
17.019	H	H	H	H	Ph	F
17.020	H	H	H	H	Ph	Me
17.021	H	F	H	H	H	H
17.022	H	F	H	H	H	Cl
17.023	H	F	H	H	H	F
17.024	H	F	H	H	H	Me
17.025	H	F	H	H	F	H
17.026	H	F	H	H	F	Cl
17.027	H	F	H	H	F	F
17.028	H	F	H	H	F	Me
17.029	H	F	H	H	Cl	H
17.030	H	F	H	H	Cl	F
17.031	H	F	H	H	Cl	Cl

(continuación)

17.032	H	F	H	H	Cl	Me
17.033	H	F	H	H	Me	H
17.034	H	F	H	H	Me	Cl
17.035	H	F	H	H	Me	F
17.036	H	F	H	H	Me	Me
17.037	H	F	H	H	Ph	H
17.038	H	F	H	H	Ph	Cl
17.039	H	F	H	H	Ph	F
17.040	H	F	H	H	Ph	Me
17.041	H	Cl	H	H	H	H
17.042	H	Cl	H	H	H	Cl
17.043	H	Cl	H	H	H	F
17.044	H	Cl	H	H	H	Me
17.045	H	Cl	H	H	F	H
17.046	H	Cl	H	H	F	Cl
17.047	H	Cl	H	H	F	F
17.048	H	Cl	H	H	F	Me
17.049	H	Cl	H	H	Cl	H
17.050	H	Cl	H	H	Cl	F
17.051	H	Cl	H	H	Cl	Cl
17.052	H	Cl	H	H	Cl	Me
17.053	H	Cl	H	H	Me	H
17.054	H	Cl	H	H	Me	Cl
17.055	H	Cl	H	H	Me	F
17.056	H	Cl	H	H	Me	Me
17.057	H	Cl	H	H	Ph	H
17.058	H	Cl	H	H	Ph	Cl
17.059	H	Cl	H	H	Ph	F
17.060	H	Cl	H	H	Ph	Me
17.061	Me	H	H	H	H	H
17.062	Me	H	H	H	H	Cl

(continuación)

17.063	Me	H	H	H	H	F
17.064	Me	H	H	H	H	Me
17.065	Me	H	H	H	F	H
17.066	Me	H	H	H	F	Cl
17.067	Me	H	H	H	F	F
17.068	Me	H	H	H	F	Me
17.069	Me	H	H	H	Cl	H
17.070	Me	H	H	H	Cl	F
17.071	Me	H	H	H	Cl	Cl
17.072	Me	H	H	H	Cl	Me
17.073	Me	H	H	H	Me	H
17.074	Me	H	H	H	Me	Cl
17.075	Me	H	H	H	Me	F
17.076	Me	H	H	H	Me	Me
17.077	Me	H	H	H	Ph	H
17.078	Me	H	H	H	Ph	Cl
17.079	Me	H	H	H	Ph	F
17.080	Me	H	H	H	Ph	Me
17.081	Me	F	H	H	H	H
17.082	Me	F	H	H	H	Cl
17.083	Me	F	H	H	H	F
17.084	Me	F	H	H	H	Me
17.085	Me	F	H	H	F	H
17.086	Me	F	H	H	F	Cl
17.087	Me	F	H	H	F	F
17.088	Me	F	H	H	F	Me
17.089	Me	F	H	H	Cl	H
17.090	Me	F	H	H	Cl	F
17.091	Me	F	H	H	Cl	Cl
17.092	Me	F	H	H	Cl	Me
17.093	Me	F	H	H	Me	H

(continuación)

17.094	Me	F	H	H	Me	Cl
17.095	Me	F	H	H	Me	F
17.096	Me	F	H	H	Me	Me
17.097	Me	F	H	H	Ph	H
17.098	Me	F	H	H	Ph	Cl
17.099	Me	F	H	H	Ph	F
17.100	Me	F	H	H	Ph	Me
17.101	Me	Cl	H	H	H	H
17.102	Me	Cl	H	H	H	Cl
17.103	Me	Cl	H	H	H	F
17.104	Me	Cl	H	H	H	Me
17.105	Me	Cl	H	H	F	H
17.106	Me	Cl	H	H	F	Cl
17.107	Me	Cl	H	H	F	F
17.108	Me	Cl	H	H	F	Me
17.109	Me	Cl	H	H	Cl	H
17.110	Me	Cl	H	H	Cl	F
17.111	Me	Cl	H	H	Cl	Cl
17.112	Me	Cl	H	H	Cl	Me
17.113	Me	Cl	H	H	Me	H
17.114	Me	Cl	H	H	Me	Cl
17.115	Me	Cl	H	H	Me	F
17.116	Me	Cl	H	H	Me	Me
17.117	Me	Cl	H	H	Ph	H
17.118	Me	Cl	H	H	Ph	Cl
17.119	Me	Cl	H	H	Ph	F
17.120	Me	Cl	H	H	Ph	Me
17.121	Et	H	H	H	H	H
17.122	Et	H	H	H	H	Cl
17.123	Et	H	H	H	H	F
17.124	Et	H	H	H	H	Me

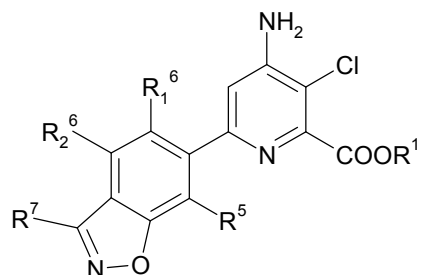
(continuación)

17.125	Et	H	H	H	F	H
17.126	Et	H	H	H	F	Cl
17.127	Et	H	H	H	F	F
17.128	Et	H	H	H	F	Me
17.129	Et	H	H	H	Cl	H
17.130	Et	H	H	H	Cl	F
17.131	Et	H	H	H	Cl	Cl
17.132	Et	H	H	H	Cl	Me
17.133	Et	H	H	H	Me	H
17.134	Et	H	H	H	Me	Cl
17.135	Et	H	H	H	Me	F
17.136	Et	H	H	H	Me	Me
17.137	Et	H	H	H	Ph	H
17.138	Et	H	H	H	Ph	Cl
17.139	Et	H	H	H	Ph	F
17.140	Et	H	H	H	Ph	Me
17.141	Et	F	H	H	H	H
17.142	Et	F	H	H	H	Cl
17.143	Et	F	H	H	H	F
17.144	Et	F	H	H	H	Me
17.145	Et	F	H	H	F	H
17.146	Et	F	H	H	F	Cl
17.147	Et	F	H	H	F	F
17.148	Et	F	H	H	F	Me
17.149	Et	F	H	H	Cl	H
17.150	Et	F	H	H	Cl	F
17.151	Et	F	H	H	Cl	Cl
17.152	Et	F	H	H	Cl	Me
17.153	Et	F	H	H	Me	H
17.154	Et	F	H	H	Me	Cl
17.155	Et	F	H	H	Me	F

(continuación)

17.156	Et	F	H	H	Me	Me
17.157	Et	F	H	H	Ph	H
17.158	Et	F	H	H	Ph	Cl
17.159	Et	F	H	H	Ph	F
17.160	Et	F	H	H	Ph	Me
17.161	Et	Cl	H	H	H	H
17.162	Et	Cl	H	H	H	Cl
17.163	Et	Cl	H	H	H	F
17.164	Et	Cl	H	H	H	Me
17.165	Et	Cl	H	H	F	H
17.166	Et	Cl	H	H	F	Cl
17.167	Et	Cl	H	H	F	F
17.168	Et	Cl	H	H	F	Me
17.169	Et	Cl	H	H	Cl	H
17.170	Et	Cl	H	H	Cl	F
17.171	Et	Cl	H	H	Cl	Cl
17.172	Et	Cl	H	H	Cl	Me
17.173	Et	Cl	H	H	Me	H
17.174	Et	Cl	H	H	Me	Cl
17.175	Et	Cl	H	H	Me	F
17.176	Et	Cl	H	H	Me	Me
17.177	Et	Cl	H	H	Ph	H
17.178	Et	Cl	H	H	Ph	Cl
17.179	Et	Cl	H	H	Ph	F
17.180	Et	Cl	H	H	Ph	Me
17.181	H	F	F	H	H	H
17.182	H	F	H	F	H	H

Tabla 18: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A16, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:

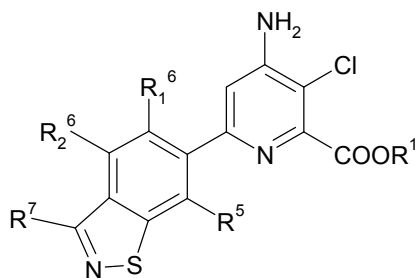


Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ⁷
18.001	H	H	H	H	H
18.002	H	H	H	H	Me
18.003	H	H	H	H	Ph
18.004	H	H	H	H	F
18.005	H	H	H	H	Cl
18.006	H	Cl	H	H	H
18.007	H	Cl	H	H	Me
18.008	H	Cl	H	H	Ph
18.009	H	Cl	H	H	F
18.010	H	Cl	H	H	Cl
18.011	H	F	H	H	H
18.012	H	F	H	H	Me
18.013	H	F	H	H	Ph
18.014	H	F	H	H	F
18.015	H	F	H	H	Cl
18.016	Me	H	H	H	H
18.017	Me	H	H	H	Me
18.018	Me	H	H	H	Ph
18.019	Me	H	H	H	F
18.020	Me	H	H	H	Cl
18.021	Me	Cl	H	H	H
18.022	Me	Cl	H	H	Me
18.023	Me	Cl	H	H	Ph

(continuación)

18.024	Me	Cl	H	H	F
18.025	Me	Cl	H	H	Cl
18.026	Et	H	H	H	H
18.027	Et	H	H	H	Me
18.028	Et	H	H	H	Ph
18.029	Et	H	H	H	F
18.030	Et	H	H	H	Cl
18.031	Et	F	H	H	H
18.032	Et	F	H	H	Me
18.033	Et	F	H	H	Ph
18.034	Et	F	H	H	F
18.035	Et	F	H	H	Cl
18.036	Et	Cl	H	H	H
18.037	Et	Cl	H	H	Me
18.038	Et	Cl	H	H	Ph
18.039	Et	Cl	H	H	F
18.040	Et	Cl	H	H	Cl
18.041	H	F	F	H	H
18.042	H	F	H	F	H

Tabla 19: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A17, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ⁷
19.001	H	H	H	H	H
19.002	H	H	H	H	Me
19.003	H	H	H	H	Ph

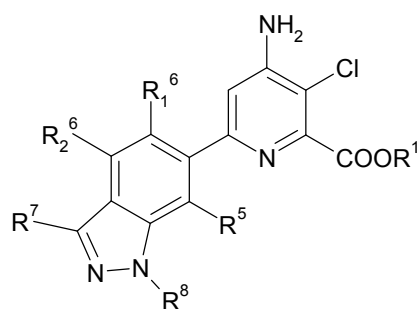
(continuación)

19.004	H	H	H	H	F
19.005	H	H	H	H	Cl
19.006	H	Cl	H	H	H
19.007	H	Cl	H	H	Me
19.008	H	Cl	H	H	Ph
19.009	H	Cl	H	H	F
19.010	H	Cl	H	H	Cl
19.011	H	F	H	H	H
19.012	H	F	H	H	Me
19.013	H	F	H	H	Ph
19.014	H	F	H	H	F
19.015	H	F	H	H	Cl
19.016	Me	H	H	H	H
19.017	Me	H	H	H	Me
19.018	Me	H	H	H	Ph
19.019	Me	H	H	H	F
19.020	Me	H	H	H	Cl
19.021	Me	Cl	H	H	H
19.022	Me	Cl	H	H	Me
19.023	Me	Cl	H	H	Ph
19.024	Me	Cl	H	H	F
19.025	Me	Cl	H	H	Cl
19.026	Et	H	H	H	H
19.027	Et	H	H	H	Me
19.028	Et	H	H	H	Ph
19.029	Et	H	H	H	F
19.030	Et	H	H	H	Cl
19.031	Et	F	H	H	H
19.032	Et	F	H	H	Me
19.033	Et	F	H	H	Ph
19.034	Et	F	H	H	F

(continuación)

19.035	Et	F	H	H	Cl
19.036	Et	Cl	H	H	H
19.037	Et	Cl	H	H	Me
19.038	Et	Cl	H	H	Ph
19.039	Et	Cl	H	H	F
19.040	Et	Cl	H	H	Cl
19.041	H	F	F	H	H
19.042	H	F	H	F	H

Tabla 20: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A18, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:

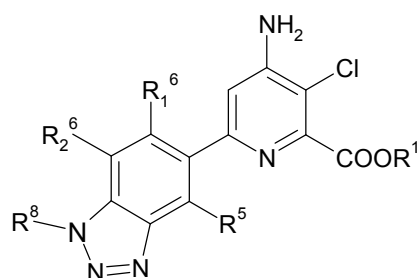


Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
20.001	H	H	H	H	H
20.002	H	H	H	Me	H
20.003	H	H	H	Ph	H
20.004	H	H	H	F	Me
20.005	H	H	H	Cl	H
20.006	H	Cl	H	H	Me
20.007	H	Cl	H	Me	Me
20.008	H	Cl	H	Ph	Me
20.009	H	Cl	H	F	H
20.010	H	Cl	H	Cl	H
20.011	H	F	H	H	Me
20.012	H	F	H	Me	H
20.013	H	F	H	Ph	H

(continuación)

20.014	H	F	H	H	F	Me
20.015	H	F	H	H	Cl	Me
20.016	Me	H	H	H	H	Et
20.017	Me	H	H	H	Me	Et
20.018	Me	H	H	H	Ph	Et
20.019	Me	H	H	H	F	Et
20.020	Me	H	H	H	Cl	Et
20.021	Me	Cl	H	H	H	Me
20.022	Me	Cl	H	H	Me	H
20.023	Me	Cl	H	H	Ph	H
20.024	Me	Cl	H	H	F	H
20.025	Me	Cl	H	H	Cl	Et
20.026	Et	H	H	H	H	Me
20.027	Et	H	H	H	Me	Me
20.028	Et	H	H	H	Ph	Me
20.029	Et	H	H	H	F	H
20.030	Et	H	H	H	Cl	H
20.031	Et	F	H	H	H	Me
20.032	Et	F	H	H	Me	Me
20.033	Et	F	H	H	Ph	H
20.034	Et	F	H	H	F	Et
20.035	Et	F	H	H	Cl	Et
20.036	Et	Cl	H	H	H	H
20.037	Et	Cl	H	H	Me	H
20.038	Et	Cl	H	H	Ph	H
20.039	Et	Cl	H	H	F	Me
20.040	Et	Cl	H	H	Cl	H
20.041	H	F	F	H	H	H
20.042	H	F	H	F	H	H

Tabla 21: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A19, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:

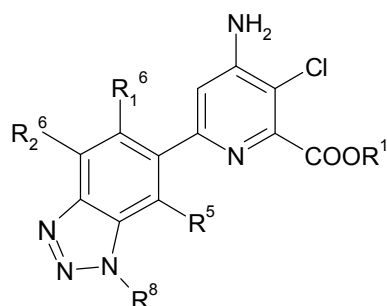


Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ⁸
21.001	H	H	H	H	H
21.002	H	H	H	H	Me
21.003	H	H	H	H	Et
21.004	H	F	H	H	H
21.005	H	F	H	H	Me
21.006	H	F	H	H	Et
21.007	H	Cl	H	H	H
21.008	H	Cl	H	H	Me
21.009	H	Cl	H	H	Et
21.010	Me	H	H	H	H
21.011	Me	H	H	H	Me
21.012	Me	H	H	H	Et
21.013	Me	F	H	H	H
21.014	Me	F	H	H	Me
21.015	Me	F	H	H	Et
21.016	Me	Cl	H	H	H
21.017	Me	Cl	H	H	Me
21.018	Me	Cl	H	H	Et
21.019	Et	H	H	H	H
21.020	Et	H	H	H	Me
21.021	Et	H	H	H	Et
21.022	Et	F	H	H	H
21.023	Et	F	H	H	Me
21.024	Et	F	H	H	Et
21.025	Et	Cl	H	H	H

(continuación)

21.026	Et	Cl	H	H	Me
21.027	Et	Cl	H	H	Et
21.028	H	F	F	H	H
21.029	H	F	H	F	H

Tabla 22: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa CH, A representa A20, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:

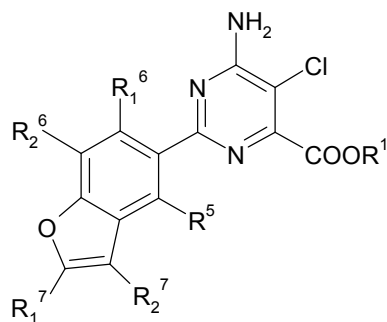


Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ¹ ₆	R ² ₆	R ⁸
22.001	H	H	H	H	H
22.002	H	H	H	H	Me
22.003	H	H	H	H	Et
22.004	H	F	H	H	H
22.005	H	F	H	H	Me
22.006	H	F	H	H	Et
22.007	H	Cl	H	H	H
22.008	H	Cl	H	H	Me
22.009	H	Cl	H	H	Et
22.010	Me	H	H	H	H
22.011	Me	H	H	H	Me
22.012	Me	H	H	H	Et
22.013	Me	F	H	H	H
22.014	Me	F	H	H	Me
22.015	Me	F	H	H	Et
22.016	Me	Cl	H	H	H
22.017	Me	Cl	H	H	Me

(continuación)

22.018	Me	Cl	H	H	Et
22.019	Et	H	H	H	H
22.020	Et	H	H	H	Me
22.021	Et	H	H	H	Et
22.022	Et	F	H	H	H
22.023	Et	F	H	H	Me
22.024	Et	F	H	H	Et
22.025	Et	Cl	H	H	H
22.026	Et	Cl	H	H	Me
22.027	Et	Cl	H	H	Et
22.028	H	F	F	H	H
22.029	H	F	H	F	H

Tabla 23: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A1, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



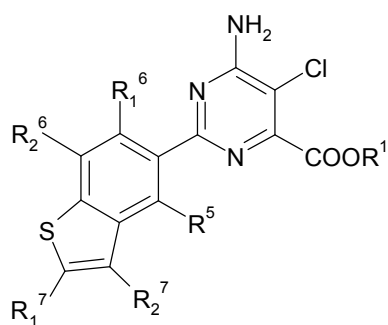
5

Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁶	R ⁷	R ⁷
23.001	H	H	H	H	H	H
23.002	H	F	H	H	H	H
23.003	H	F	H	H	Cl	H
23.004	H	F	H	H	H	Cl
23.005	H	F	H	H	Cl	Cl
23.006	H	F	H	H	Ph	H
23.007	H	F	H	H	Ph	Cl
23.008	H	F	H	H	Ph	F

(continuación)

23.009	H	F	H	H	Me	H
23.010	H	F	H	H	Me	Cl
23.011	H	F	H	H	Me	F
23.012	Me	H	H	H	H	H
23.013	Me	F	H	H	H	H
23.014	Me	F	H	H	Cl	H
23.015	Me	F	H	H	H	Cl
23.016	Me	F	H	H	Cl	Cl
23.017	Me	F	H	H	H	F
23.018	Me	F	H	H	Ph	H
23.019	Me	F	H	H	Ph	Cl
23.020	Me	F	H	H	Ph	F
23.021	Me	F	H	H	Me	H
23.022	Me	F	H	H	Me	Cl
23.023	Me	F	H	H	Me	F
23.024	Et	H	H	H	H	H
23.025	Et	Cl	H	H	H	H
23.026	Et	Cl	H	H	Cl	H
23.027	Et	Cl	H	H	H	Cl
23.028	Et	Cl	H	H	Cl	Cl
23.029	Et	Cl	H	H	H	F
23.030	Et	Cl	H	H	Ph	H
23.031	Et	Cl	H	H	Ph	Cl
23.032	Et	Cl	H	H	Ph	F
23.033	Et	Cl	H	H	Me	H
23.034	Et	Cl	H	H	Me	Cl
23.035	Et	Cl	H	H	Me	F
23.036	H	F	F	H	H	H
23.037	H	F	H	F	H	H

Tabla 24: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A2, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:

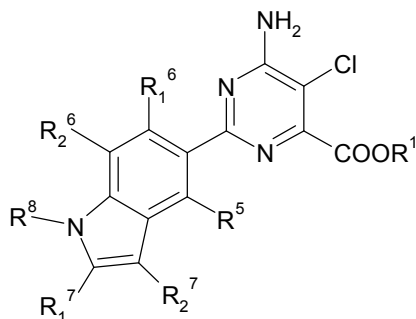


Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ₁ ⁷	R ₂ ⁷
24.001	H	H	H	H	H	H
24.002	H	F	H	H	H	H
24.003	H	F	H	H	Cl	H
24.004	H	F	H	H	H	Cl
24.005	H	F	H	H	Cl	Cl
24.006	H	F	H	H	Ph	H
24.007	H	F	H	H	Ph	Cl
24.008	H	F	H	H	Ph	F
24.009	H	F	H	H	Me	H
24.010	H	F	H	H	Me	Cl
24.011	H	F	H	H	Me	F
24.012	Me	H	H	H	H	H
24.013	Me	F	H	H	H	H
24.014	Me	F	H	H	Cl	H
24.015	Me	F	H	H	H	Cl
24.016	Me	F	H	H	Cl	Cl
24.017	Me	F	H	H	H	F
24.018	Me	F	H	H	Ph	H
24.019	Me	F	H	H	Ph	Cl
24.020	Me	F	H	H	Ph	F
24.021	Me	F	H	H	Me	H
24.022	Me	F	H	H	Me	Cl
24.023	Me	F	H	H	Me	F
24.024	Et	H	H	H	H	H

(continuación)

24.025	Et	Cl	H	H	H	H
24.026	Et	Cl	H	H	Cl	H
24.027	Et	Cl	H	H	H	Cl
24.028	Et	Cl	H	H	Cl	Cl
24.029	Et	Cl	H	H	H	F
24.030	Et	Cl	H	H	Ph	H
24.031	Et	Cl	H	H	Ph	Cl
24.032	Et	Cl	H	H	Ph	F
24.033	Et	Cl	H	H	Me	H
24.034	Et	Cl	H	H	Me	Cl
24.035	Et	Cl	H	H	Me	F
24.036	H	F	F	H	H	H
24.037	H	F	H	F	H	H

Tabla 25: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A3, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:

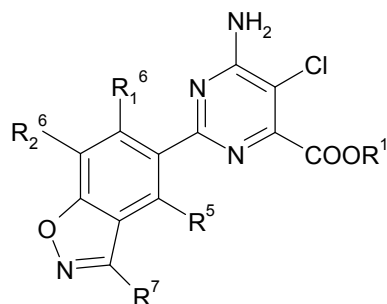


Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
25.001	H	H	H	H	H
25.002	H	F	H	H	H
25.003	H	F	H	Cl	H
25.004	H	F	H	H	Me
25.005	H	F	H	Cl	Me
25.006	H	F	H	Ph	Me
25.007	H	F	H	Ph	H
25.008	H	F	H	Ph	H

(continuación)

25.009	H	F	H	H	Me	H	H
25.010	H	F	H	H	Me	Cl	Me
25.011	H	F	H	H	Me	F	Me
25.012	Me	H	H	H	H	H	H
25.013	Me	F	H	H	H	H	H
25.014	Me	F	H	H	Cl	H	H
25.015	Me	F	H	H	H	Cl	Me
25.016	Me	F	H	H	Cl	Cl	Me
25.017	Me	F	H	H	H	F	Me
25.018	Me	F	H	H	Ph	H	H
25.019	Me	F	H	H	Ph	Cl	H
25.020	Me	F	H	H	Ph	F	H
25.021	Me	F	H	H	Me	H	H
25.022	Me	F	H	H	Me	Cl	Me
25.023	Me	F	H	H	Me	F	H
25.024	Et	H	H	H	H	H	H
25.025	Et	Cl	H	H	H	H	Me
25.026	Et	Cl	H	H	Cl	H	Me
25.027	Et	Cl	H	H	H	Cl	Me
25.028	Et	Cl	H	H	Cl	Cl	Me
25.029	Et	Cl	H	H	H	F	Me
25.030	Et	Cl	H	H	Ph	H	H
25.031	Et	Cl	H	H	Ph	Cl	H
25.032	Et	Cl	H	H	Ph	F	H
25.033	Et	Cl	H	H	Me	H	H
25.034	Et	Cl	H	H	Me	Cl	H
25.035	Et	Cl	H	H	Me	F	Me
25.036	H	F	F	H	H	H	H
25.037	H	F	H	F	H	H	H

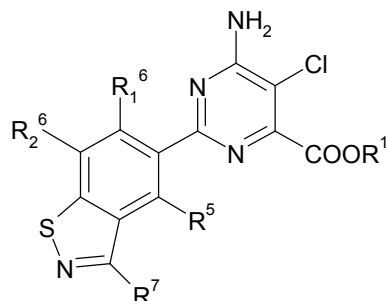
Tabla 26: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A4, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁵	R ⁷
26.001	H	H	H	H	H
26.002	H	F	H	H	H
26.003	H	F	H	H	F
26.004	H	F	H	H	Cl
26.005	H	F	H	H	Me
26.006	H	Cl	H	H	H
26.007	H	Cl	H	H	F
26.008	H	Cl	H	H	Cl
26.009	H	Cl	H	H	Me
26.010	Me	H	H	H	H
26.011	Me	F	H	H	H
26.012	Me	F	H	H	F
26.013	Me	F	H	H	Cl
26.014	Me	Cl	H	H	H
26.015	Me	Cl	H	H	F
26.016	Me	Cl	H	H	Cl
26.017	Me	Cl	H	H	Me
26.018	Et	H	H	H	H
26.019	Et	F	H	H	H
26.020	Et	Cl	H	H	H
26.021	Et	F	H	H	Me
26.022	Et	Cl	H	H	Me
26.023	H	F	F	H	H
26.024	H	F	H	F	H

Tabla 27: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A5, R³ y R⁴

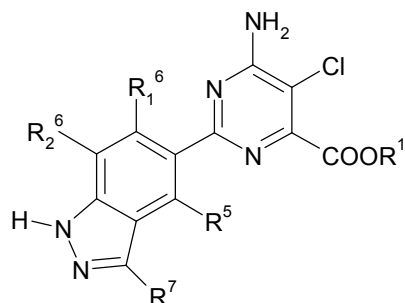
respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ⁷
27.001	H	H	H	H	H
27.002	H	F	H	H	H
27.003	H	F	H	H	F
27.004	H	F	H	H	Cl
27.005	H	F	H	H	F
27.006	H	Cl	H	H	H
27.007	H	Cl	H	H	F
27.008	H	Cl	H	H	Cl
27.009	H	Cl	H	H	Me
27.010	Me	H	H	H	H
27.011	Me	F	H	H	H
27.012	Me	F	H	H	Cl
27.013	Me	Cl	H	H	H
27.014	Me	Cl	H	H	F
27.015	Me	Cl	H	H	Cl
27.016	Me	Cl	H	H	Me
27.017	Et	H	H	H	H
27.018	Et	F	H	H	H
27.019	Et	Cl	H	H	H
27.020	Et	F	H	H	Me
27.021	Et	Cl	H	H	Me
27.022	H	F	F	H	H
27.023	H	F	H	F	H

Tabla 28: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A6, R⁸, R³ y

R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:

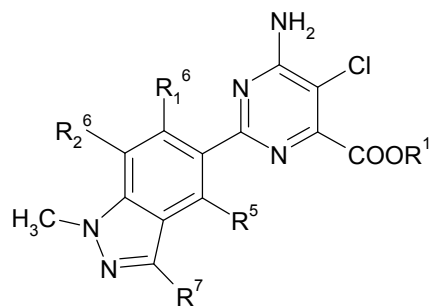


Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁶	R ⁷
28.001	H	H	H	H	H
28.002	H	F	H	H	H
28.003	H	F	H	H	Me
28.004	H	F	H	H	Et
28.005	H	H	H	H	Me
28.006	H	Cl	H	H	H
28.007	H	Cl	H	H	Me
28.008	H	Cl	H	H	Et
28.009	Me	H	H	H	H
28.010	Me	H	H	H	Me
28.011	Me	F	H	H	H
28.012	Me	F	H	H	Me
28.013	Me	F	H	H	Et
28.014	Me	Cl	H	H	H
28.015	Me	Cl	H	H	Me
28.016	Me	Cl	H	H	Et
28.017	Me	H	H	H	Me
28.018	Et	H	H	H	H
28.019	Et	H	H	H	Me
28.020	Et	H	H	H	Et
28.021	Et	F	H	H	H
28.022	Et	F	H	H	Me
28.023	Et	F	H	H	Et

(continuación)

28.024	Et	Cl	H	H	H
28.025	Et	Cl	H	H	Me
28.026	Et	Cl	H	H	Et
28.027	H	F	F	H	H
28.028	H	F	H	F	H

Tabla 29: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A6, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno, R⁸ representa metilo y R² representa cloro:

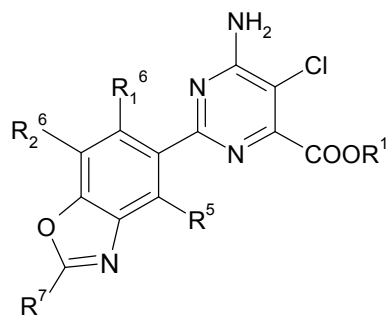


Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ¹⁶	R ²⁶	R ⁷
29.001	H	H	H	H	H
29.002	H	F	H	H	H
29.003	H	F	H	H	Me
29.004	H	F	H	H	Et
29.005	H	H	H	H	Me
29.006	H	Cl	H	H	H
29.007	H	Cl	H	H	Me
29.008	H	Cl	H	H	Et
29.009	Me	H	H	H	H
29.010	Me	H	H	H	Me
29.011	Me	F	H	H	H
29.012	Me	F	H	H	Me
29.013	Me	F	H	H	Et
29.014	Me	Cl	H	H	H
29.015	Me	Cl	H	H	Me
29.016	Me	Cl	H	H	Et

(continuación)

29.017	Me	H	H	H	Me
29.018	Et	H	H	H	H
29.019	Et	H	H	H	Me
29.020	Et	H	H	H	Et
29.021	Et	F	H	H	H
29.022	Et	F	H	H	Me
29.023	Et	F	H	H	Et
29.024	Et	Cl	H	H	H
29.025	Et	Cl	H	H	Me
29.026	Et	Cl	H	H	Et
29.027	H	F	F	H	H
29.028	H	F	H	F	H

Tabla 30: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A7, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:

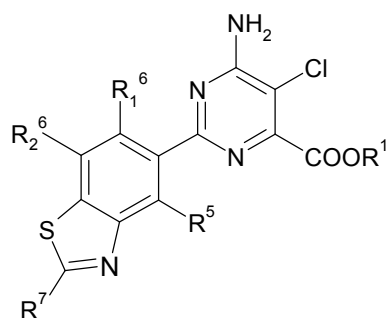


Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ⁷
30.001	H	H	H	H	H
30.002	H	H	H	H	Me
30.003	H	H	H	H	Ph
30.004	H	H	H	H	SMe
30.005	H	F	H	H	H
30.006	H	F	H	H	Me
30.007	H	F	H	H	Ph
30.008	H	F	H	H	SMe
30.009	H	Cl	H	H	H
30.010	H	Cl	H	H	Me

(continuación)

30.011	H	Cl	H	H	Ph
30.012	H	Cl	H	H	SMe
30.013	Me	H	H	H	H
30.014	Me	H	H	H	Me
30.015	Me	H	H	H	Ph
30.016	Me	H	H	H	SMe
30.017	Me	F	H	H	H
30.018	Me	F	H	H	Me
30.019	Me	F	H	H	Ph
30.020	Me	F	H	H	SMe
30.021	Me	Cl	H	H	H
30.022	Me	Cl	H	H	Me
30.023	Me	Cl	H	H	Ph
30.024	Me	Cl	H	H	SMe
30.025	Et	H	H	H	H
30.026	Et	H	H	H	Me
30.027	Et	H	H	H	Ph
30.028	Et	H	H	H	SMe
30.029	Et	F	H	H	H
30.030	Et	F	H	H	Me
30.031	Et	F	H	H	Ph
30.032	Et	F	H	H	SMe
30.033	Et	Cl	H	H	H
30.034	Et	Cl	H	H	Me
30.035	Et	Cl	H	H	Ph
30.036	Et	Cl	H	H	SMe
30.037	H	F	F	H	H
30.038	H	F	H	F	H

Tabla 31: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A8, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:

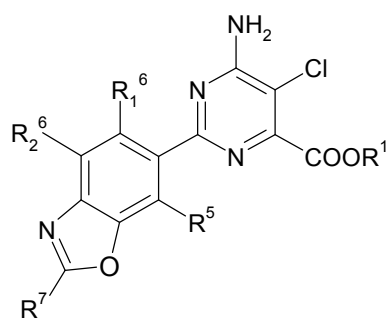


Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ⁷
31.001	H	H	H	H	H
31.002	H	H	H	H	Me
31.003	H	H	H	H	Ph
31.004	H	H	H	H	SMe
31.005	H	F	H	H	H
31.006	H	F	H	H	Me
31.007	H	F	H	H	Ph
31.008	H	F	H	H	SMe
31.009	H	Cl	H	H	H
31.010	H	Cl	H	H	Me
31.011	H	Cl	H	H	Ph
31.012	H	Cl	H	H	SMe
31.013	Me	H	H	H	H
31.014	Me	H	H	H	Me
31.015	Me	H	H	H	Ph
31.016	Me	H	H	H	SMe
31.017	Me	F	H	H	H
31.018	Me	F	H	H	Me
31.019	Me	F	H	H	Ph
31.020	Me	F	H	H	SMe
31.021	Me	Cl	H	H	H
31.022	Et	H	H	H	H
31.023	Et	H	H	H	Me
31.024	Et	H	H	H	Ph

(continuación)

31.025	Et	H	H	H	SMe
31.026	Et	F	H	H	H
31.027	Et	F	H	H	Me
31.028	Et	F	H	H	Ph
31.029	Et	F	H	H	SMe
31.030	Et	Cl	H	H	H
31.031	Et	Cl	H	H	Me
31.032	Et	Cl	H	H	Ph
31.033	Et	Cl	H	H	SMe
31.034	H	F	F	H	H
31.035	H	F	H	F	H

Tabla 32: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A9, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



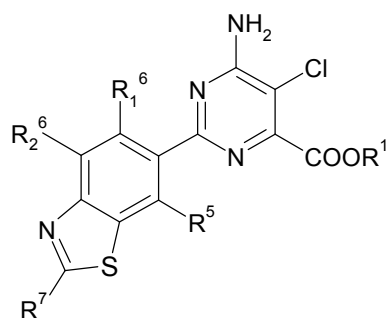
5

Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ⁷
32.001	H	H	H	H	H
32.002	H	H	H	H	Me
32.003	H	H	H	H	Ph
32.004	H	H	H	H	SMe
32.005	H	F	H	H	H
32.006	H	F	H	H	Me
32.007	H	F	H	H	Ph
32.008	H	F	H	H	SMe
32.009	H	Cl	H	H	H

(continuación)

32.010	H	Cl	H	H	Me
32.011	H	Cl	H	H	Ph
32.012	H	Cl	H	H	SMe
32.013	Me	H	H	H	H
32.014	Me	H	H	H	Me
32.015	Me	H	H	H	Ph
32.016	Me	H	H	H	SMe
32.017	Me	F	H	H	H
32.018	Me	F	H	H	Me
32.019	Me	F	H	H	Ph
32.020	Me	F	H	H	SMe
32.021	Me	Cl	H	H	H
32.022	Me	Cl	H	H	Me
32.023	Me	Cl	H	H	Ph
32.024	Me	Cl	H	H	SMe
32.025	Et	H	H	H	H
32.026	Et	H	H	H	Me
32.027	Et	H	H	H	Ph
32.028	Et	H	H	H	SMe
32.029	Et	F	H	H	H
32.030	Et	F	H	H	Me
32.031	Et	F	H	H	Ph
32.032	Et	F	H	H	SMe
32.033	Et	Cl	H	H	H
32.034	Et	Cl	H	H	Me
32.035	Et	Cl	H	H	Ph
32.036	Et	Cl	H	H	SMe
32.037	H	F	F	H	H
32.038	H	F	H	F	H

Tabla 33: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A10, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:

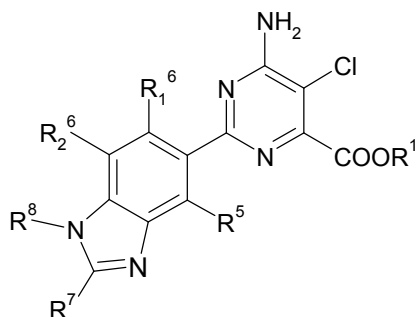


Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ⁷
33.001	H	H	H	H	H
33.002	H	H	H	H	Me
33.003	H	H	H	H	Ph
33.004	H	H	H	H	SMe
33.005	H	F	H	H	H
33.006	H	F	H	H	Me
33.007	H	F	H	H	Ph
33.008	H	F	H	H	SMe
33.009	H	Cl	H	H	H
33.010	H	Cl	H	H	Me
33.011	H	Cl	H	H	Ph
33.012	H	Cl	H	H	SMe
33.013	Me	H	H	H	H
33.014	Me	H	H	H	Me
33.015	Me	H	H	H	Ph
33.016	Me	H	H	H	SMe
33.017	Me	F	H	H	H
33.018	Me	F	H	H	Me
33.019	Me	F	H	H	Ph
33.020	Me	F	H	H	SMe
33.021	Me	Cl	H	H	H
33.022	Et	H	H	H	H
33.023	Et	H	H	H	Me
33.024	Et	H	H	H	Ph

(continuación)

33.025	Et	H	H	H	SMe
33.026	Et	F	H	H	H
33.027	Et	F	H	H	Me
33.028	Et	F	H	H	Ph
33.029	Et	F	H	H	SMe
33.030	Et	Cl	H	H	H
33.031	Et	Cl	H	H	Me
33.032	Et	Cl	H	H	Ph
33.033	Et	Cl	H	H	SMe
33.034	H	F	F	H	H
33.035	H	F	H	F	H

Tabla 34: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A11, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



5

Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ⁷	R ⁸
34.001	H	H	H	H	H	H
34.002	H	F	H	H	H	H
34.003	H	F	H	H	H	Me
34.004	H	F	H	H	Me	H
34.005	H	F	H	H	Me	Me
34.006	H	Cl	H	H	H	H
34.007	H	Cl	H	H	H	Me
34.008	H	Cl	H	H	Me	H
34.009	H	Cl	H	H	Me	Me

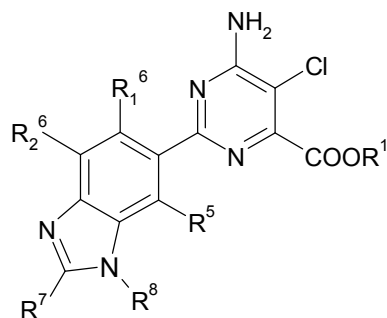
(continuación)

34.010	H	H	H	H	Ph	H
34.011	H	H	H	H	Ph	Me
34.012	H	F	H	H	Ph	H
34.013	H	F	H	H	Ph	Me
34.014	H	Cl	H	H	Ph	H
34.015	H	Cl	H	H	Ph	Me
34.016	H	H	H	H	Me	H
34.017	H	H	H	H	H	Me
34.018	H	H	H	H	Me	Me
34.019	Me	H	H	H	H	H
34.020	Me	F	H	H	H	H
34.021	Me	F	H	H	H	Me
34.022	Me	F	H	H	Me	H
34.023	Me	F	H	H	Me	Me
34.024	Me	Cl	H	H	H	H
34.025	Me	Cl	H	H	H	Me
34.026	Me	Cl	H	H	Me	H
34.027	Me	Cl	H	H	Me	Me
34.028	Me	H	H	H	Ph	H
34.029	Me	H	H	H	Ph	Me
34.030	Me	F	H	H	Ph	H
34.031	Me	F	H	H	Ph	Me
34.032	Me	Cl	H	H	Ph	H
34.033	Me	Cl	H	H	Ph	Me
34.034	Me	H	H	H	Me	H
34.035	Me	H	H	H	H	Me
34.036	Me	H	H	H	Me	Me
34.037	Et	H	H	H	H	H
34.038	Et	F	H	H	H	H
34.039	Et	F	H	H	H	Me
34.040	Et	F	H	H	Me	H

(continuación)

34.041	Et	F	H	H	Me	Me
34.042	Et	Cl	H	H	H	H
34.043	Et	Cl	H	H	H	Me
34.044	Et	Cl	H	H	Me	H
34.045	Et	H	H	H	Ph	H
34.046	Et	H	H	H	Ph	Me
34.047	Et	F	H	H	Ph	H
34.048	Et	F	H	H	Ph	Me
34.049	Et	Cl	H	H	Ph	H
34.050	Et	Cl	H	H	Me	Me
34.051	Et	H	H	H	Me	H
34.052	Et	H	H	H	H	Me
34.053	Et	H	H	H	Me	Me
34.054	H	F	F	H	H	H
34.055	H	F	H	F	H	H

Tabla 35: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A12, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:

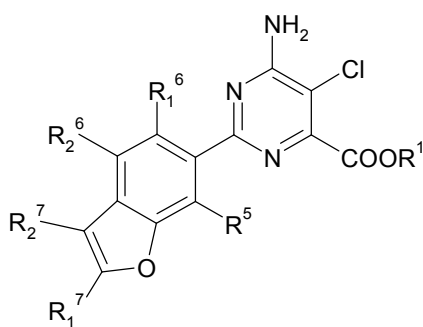


Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁶	R ⁷	R ⁸
35.001	H	H	H	H	H	Me
35.002	H	F	H	H	H	Me
35.003	H	F	H	H	Me	Me
35.004	H	Cl	H	H	H	Me
35.005	H	Cl	H	H	Me	Me
35.006	H	H	H	H	Ph	Me

(continuación)

35.007	H	F	H	H	Ph	Me
35.008	H	Cl	H	H	Ph	Me
35.009	H	H	H	H	H	Me
35.010	Me	H	H	H	H	Me
35.011	Me	F	H	H	H	Me
35.012	Me	H	H	H	Me	Me
35.013	Me	F	H	H	Me	Me
35.014	Me	Cl	H	H	H	Me
35.015	Me	Cl	H	H	Me	Me
35.016	Me	H	H	H	Ph	Me
35.017	Me	F	H	H	Ph	Me
35.018	Me	Cl	H	H	Ph	Me
35.019	Et	F	H	H	H	Me
35.020	Et	F	H	H	Me	Me
35.021	Et	Cl	H	H	H	Me
35.022	Et	H	H	H	Ph	Me
35.023	Et	F	H	H	Ph	Me
35.024	Et	Cl	H	H	Ph	Me
35.025	Et	H	H	H	H	Me
35.026	Et	H	H	H	Me	Me
35.027	Et	Cl	H	H	Me	Me
35.028	H	F	F	H	H	H
35.029	H	F	H	F	H	H

Tabla 36: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A13, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ₁ ⁷	R ₂ ⁷
36.001	H	H	H	H	H	H
36.002	H	H	H	H	H	Cl
36.003	H	H	H	H	H	F
36.004	H	H	H	H	H	Me
36.005	H	H	H	H	F	H
36.006	H	H	H	H	F	Cl
36.007	H	H	H	H	F	F
36.008	H	H	H	H	F	Me
36.009	H	H	H	H	Cl	H
36.010	H	H	H	H	Cl	F
36.011	H	H	H	H	Cl	Cl
36.012	H	H	H	H	Cl	Me
36.013	H	H	H	H	Me	H
36.014	H	H	H	H	Me	Cl
36.015	H	H	H	H	Me	F
36.016	H	H	H	H	Me	Me
36.017	H	H	H	H	Ph	H
36.018	H	H	H	H	Ph	Cl
36.019	H	H	H	H	Ph	F
36.020	H	H	H	H	Ph	Me
36.021	H	F	H	H	H	H
36.022	H	F	H	H	H	Cl
36.023	H	F	H	H	H	F
36.024	H	F	H	H	H	Me
36.025	H	F	H	H	F	H
36.026	H	F	H	H	F	Cl
36.027	H	F	H	H	F	F
36.028	H	F	H	H	F	Me
36.029	H	F	H	H	Cl	H
36.030	H	F	H	H	Cl	F
36.031	H	F	H	H	Cl	Cl

(continuación)

36.032	H	F	H	H	Cl	Me
36.033	H	F	H	H	Me	H
36.034	H	F	H	H	Me	Cl
36.035	H	F	H	H	Me	F
36.036	H	F	H	H	Me	Me
36.037	H	F	H	H	Ph	H
36.038	H	F	H	H	Ph	Cl
36.039	H	F	H	H	Ph	F
36.040	H	F	H	H	Ph	Me
36.041	H	Cl	H	H	H	H
36.042	H	Cl	H	H	H	Cl
36.043	H	Cl	H	H	H	F
36.044	H	Cl	H	H	H	Me
36.045	H	Cl	H	H	F	H
36.046	H	Cl	H	H	F	Cl
36.047	H	Cl	H	H	F	F
36.048	H	Cl	H	H	F	Me
36.049	H	Cl	H	H	Cl	H
36.050	H	Cl	H	H	Cl	F
36.051	H	Cl	H	H	Cl	Cl
36.052	H	Cl	H	H	Cl	Me
36.053	H	Cl	H	H	Me	H
36.054	H	Cl	H	H	Me	Cl
36.055	H	Cl	H	H	Me	F
36.056	H	Cl	H	H	Me	Me
36.057	H	Cl	H	H	Ph	H
36.058	H	Cl	H	H	Ph	Cl
36.059	H	Cl	H	H	Ph	F
36.060	H	Cl	H	H	Ph	Me
36.061	Me	H	H	H	H	H
36.062	Me	H	H	H	H	Cl

(continuación)

36.063	Me	H	H	H	H	F
36.064	Me	H	H	H	H	Me
36.065	Me	H	H	H	F	H
36.066	Me	H	H	H	F	Cl
36.067	Me	H	H	H	F	F
36.068	Me	H	H	H	F	Me
36.069	Me	H	H	H	Cl	H
36.070	Me	H	H	H	Cl	F
36.071	Me	H	H	H	Cl	Cl
36.072	Me	H	H	H	Cl	Me
36.073	Me	H	H	H	Me	H
36.074	Me	H	H	H	Me	Cl
36.075	Me	H	H	H	Me	F
36.076	Me	H	H	H	Me	Me
36.077	Me	H	H	H	Ph	H
36.078	Me	H	H	H	Ph	Cl
36.079	Me	H	H	H	Ph	F
36.080	Me	H	H	H	Ph	Me
36.081	Me	F	H	H	H	H
36.082	Me	F	H	H	H	Cl
36.083	Me	F	H	H	H	F
36.084	Me	F	H	H	H	Me
36.085	Me	F	H	H	F	H
36.086	Me	F	H	H	F	Cl
36.087	Me	F	H	H	F	F
36.088	Me	F	H	H	F	Me
36.089	Me	F	H	H	Cl	H
36.090	Me	F	H	H	Cl	F
36.091	Me	F	H	H	Cl	Cl
36.092	Me	F	H	H	Cl	Me

(continuación)

36.093	Me	F	H	H	Me	H
36.094	Me	F	H	H	Me	Cl
36.095	Me	F	H	H	Me	F
36.096	Me	F	H	H	Me	Me
36.097	Me	F	H	H	Ph	H
36.098	Me	F	H	H	Ph	Cl
36.099	Me	F	H	H	Ph	F
36.100	Me	F	H	H	Ph	Me
36.101	Me	Cl	H	H	H	H
36.102	Me	Cl	H	H	H	Cl
36.103	Me	Cl	H	H	H	F
36.104	Me	Cl	H	H	H	Me
36.105	Me	Cl	H	H	F	H
36.106	Me	Cl	H	H	F	Cl
36.107	Me	Cl	H	H	F	F
36.108	Me	Cl	H	H	F	Me
36.109	Me	Cl	H	H	Cl	H
36.110	Me	Cl	H	H	Cl	F
36.111	Me	Cl	H	H	Cl	Cl
36.112	Me	Cl	H	H	Cl	Me
36.113	Me	Cl	H	H	Me	H
36.114	Me	Cl	H	H	Me	Cl
36.115	Me	Cl	H	H	Me	F
36.116	Me	Cl	H	H	Me	Me
36.117	Me	Cl	H	H	Ph	H
36.118	Me	Cl	H	H	Ph	Cl
36.119	Me	Cl	H	H	Ph	F
36.120	Me	Cl	H	H	Ph	Me
36.121	Et	H	H	H	H	H
36.122	Et	H	H	H	H	Cl
36.123	Et	H	H	H	H	F

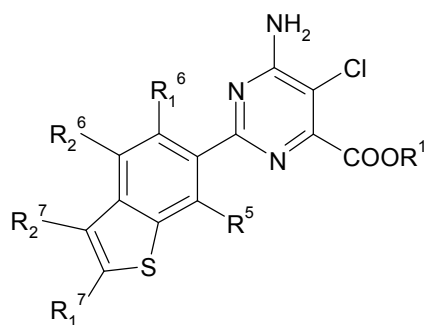
(continuación)

36.124	Et	H	H	H	H	Me
36.125	Et	H	H	H	F	H
36.126	Et	H	H	H	F	Cl
36.127	Et	H	H	H	F	F
36.128	Et	H	H	H	F	Me
36.129	Et	H	H	H	Cl	H
36.130	Et	H	H	H	Cl	F
36.131	Et	H	H	H	Cl	Cl
36.132	Et	H	H	H	Cl	Me
36.133	Et	H	H	H	Me	H
36.134	Et	H	H	H	Me	Cl
36.135	Et	H	H	H	Me	F
36.136	Et	H	H	H	Me	Me
36.137	Et	H	H	H	Ph	H
36.138	Et	H	H	H	Ph	Cl
36.139	Et	H	H	H	Ph	F
36.140	Et	H	H	H	Ph	Me
36.141	Et	F	H	H	H	H
36.142	Et	F	H	H	H	Cl
36.143	Et	F	H	H	H	F
36.144	Et	F	H	H	H	Me
36.145	Et	F	H	H	F	H
36.146	Et	F	H	H	F	Cl
36.147	Et	F	H	H	F	F
36.148	Et	F	H	H	F	Me
36.149	Et	F	H	H	Cl	H
36.150	Et	F	H	H	Cl	F
36.151	Et	F	H	H	Cl	Cl
36.152	Et	F	H	H	Cl	Me
36.153	Et	F	H	H	Me	H
36.154	Et	F	H	H	Me	Cl

(continuación)

36.155	Et	F	H	H	Me	F
36.156	Et	F	H	H	Me	Me
36.157	Et	F	H	H	Ph	H
36.158	Et	F	H	H	Ph	Cl
36.159	Et	F	H	H	Ph	F
36.160	Et	F	H	H	Ph	Me
36.161	Et	Cl	H	H	H	H
36.162	Et	Cl	H	H	H	Cl
36.163	Et	Cl	H	H	H	F
36.164	Et	Cl	H	H	H	Me
36.165	Et	Cl	H	H	F	H
36.166	Et	Cl	H	H	F	Cl
36.167	Et	Cl	H	H	F	F
36.168	Et	Cl	H	H	F	Me
36.169	Et	Cl	H	H	Cl	H
36.170	Et	Cl	H	H	Cl	F
36.171	Et	Cl	H	H	Cl	Cl
36.172	Et	Cl	H	H	Cl	Me
36.173	Et	Cl	H	H	Me	H
36.174	Et	Cl	H	H	Me	Cl
36.175	Et	Cl	H	H	Me	F
36.176	Et	Cl	H	H	Me	Me
36.177	Et	Cl	H	H	Ph	H
36.178	Et	Cl	H	H	Ph	Cl
36.179	Et	Cl	H	H	Ph	F
36.180	Et	Cl	H	H	Ph	Me
36.181	H	F	F	H	H	H
36.182	H	F	H	F	H	H

Tabla 37: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A14, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ₁ ⁷	R ₂ ⁷
37.001	H	H	H	H	H	H
37.002	H	H	H	H	H	Cl
37.003	H	H	H	H	H	F
37.004	H	H	H	H	H	Me
37.005	H	H	H	H	F	H
37.006	H	H	H	H	F	Cl
37.007	H	H	H	H	F	F
37.008	H	H	H	H	F	Me
37.009	H	H	H	H	Cl	H
37.010	H	H	H	H	Cl	F
37.011	H	H	H	H	Cl	Cl
37.012	H	H	H	H	Cl	Me
37.013	H	H	H	H	Me	H
37.014	H	H	H	H	Me	Cl
37.015	H	H	H	H	Me	F
37.016	H	H	H	H	Me	Me
37.017	H	H	H	H	Ph	H
37.018	H	H	H	H	Ph	Cl
37.019	H	H	H	H	Ph	F
37.020	H	H	H	H	Ph	Me
37.021	H	F	H	H	H	H
37.022	H	F	H	H	H	Cl
37.023	H	F	H	H	H	F
37.024	H	F	H	H	H	Me

(continuación)

37.025	H	F	H	H	F	H
37.026	H	F	H	H	F	Cl
37.027	H	F	H	H	F	F
37.028	H	F	H	H	F	Me
37.029	H	F	H	H	Cl	H
37.030	H	F	H	H	Cl	F
37.031	H	F	H	H	Cl	Cl
37.032	H	F	H	H	Cl	Me
37.033	H	F	H	H	Me	H
37.034	H	F	H	H	Me	Cl
37.035	H	F	H	H	Me	F
37.036	H	F	H	H	Me	Me
37.037	H	F	H	H	Ph	H
37.038	H	F	H	H	Ph	Cl
37.039	H	F	H	H	Ph	F
37.040	H	F	H	H	Ph	Me
37.041	H	Cl	H	H	H	H
37.042	H	Cl	H	H	H	Cl
37.043	H	Cl	H	H	H	F
37.044	H	Cl	H	H	H	Me
37.045	H	Cl	H	H	F	H
37.046	H	Cl	H	H	F	Cl
37.047	H	Cl	H	H	F	F
37.048	H	Cl	H	H	F	Me
37.049	H	Cl	H	H	Cl	H
37.050	H	Cl	H	H	Cl	F
37.051	H	Cl	H	H	Cl	Cl
37.052	H	Cl	H	H	Cl	Me
37.053	H	Cl	H	H	Me	H
37.054	H	Cl	H	H	Me	Cl
37.055	H	Cl	H	H	Me	F

(continuación)

37.056	H	Cl	H	H	Me	Me
37.057	H	Cl	H	H	Ph	H
37.058	H	Cl	H	H	Ph	Cl
37.059	H	Cl	H	H	Ph	F
37.060	H	Cl	H	H	Ph	Me
37.061	Me	H	H	H	H	H
37.062	Me	H	H	H	H	Cl
37.063	Me	H	H	H	H	F
37.064	Me	H	H	H	H	Me
37.065	Me	H	H	H	F	H
37.066	Me	H	H	H	F	Cl
37.067	Me	H	H	H	F	F
37.068	Me	H	H	H	F	Me
37.069	Me	H	H	H	Cl	H
37.070	Me	H	H	H	Cl	F
37.071	Me	H	H	H	Cl	Cl
37.072	Me	H	H	H	Cl	Me
37.073	Me	H	H	H	Me	H
37.074	Me	H	H	H	Me	Cl
37.075	Me	H	H	H	Me	F
37.076	Me	H	H	H	Me	Me
37.077	Me	H	H	H	Ph	H
37.078	Me	H	H	H	Ph	Cl
37.079	Me	H	H	H	Ph	F
37.080	Me	H	H	H	Ph	Me
37.081	Me	F	H	H	H	H
37.082	Me	F	H	H	H	Cl
37.083	Me	F	H	H	H	F
37.084	Me	F	H	H	H	Me
37.085	Me	F	H	H	F	H
37.086	Me	F	H	H	F	Cl

(continuación)

37.087	Me	F	H	H	F	F
37.088	Me	F	H	H	F	Me
37.089	Me	F	H	H	Cl	H
37.090	Me	F	H	H	Cl	F
37.091	Me	F	H	H	Cl	Cl
37.092	Me	F	H	H	Cl	Me
37.093	Me	F	H	H	Me	H
37.094	Me	F	H	H	Me	Cl
37.095	Me	F	H	H	Me	F
37.096	Me	F	H	H	Me	Me
37.097	Me	F	H	H	Ph	H
37.098	Me	F	H	H	Ph	Cl
37.099	Me	F	H	H	Ph	F
37.100	Me	F	H	H	Ph	Me
37.101	Me	Cl	H	H	H	H
37.102	Me	Cl	H	H	H	Cl
37.103	Me	Cl	H	H	H	F
37.104	Me	Cl	H	H	H	Me
37.105	Me	Cl	H	H	F	H
37.106	Me	Cl	H	H	F	Cl
37.107	Me	Cl	H	H	F	F
37.108	Me	Cl	H	H	F	Me
37.109	Me	Cl	H	H	Cl	H
37.110	Me	Cl	H	H	Cl	F
37.111	Me	Cl	H	H	Cl	Cl
37.112	Me	Cl	H	H	Cl	Me
37.113	Me	Cl	H	H	Me	H
37.114	Me	Cl	H	H	Me	Cl
37.115	Me	Cl	H	H	Me	F
37.116	Me	Cl	H	H	Me	Me
37.117	Me	Cl	H	H	Ph	H

(continuación)

37.118	Me	Cl	H	H	Ph	Cl
37.119	Me	Cl	H	H	Ph	F
37.120	Me	Cl	H	H	Ph	Me
37.121	Et	H	H	H	H	H
37.122	Et	H	H	H	H	Cl
37.123	Et	H	H	H	H	F
37.124	Et	H	H	H	H	Me
37.125	Et	H	H	H	F	H
37.126	Et	H	H	H	F	Cl
37.127	Et	H	H	H	F	F
37.128	Et	H	H	H	F	Me
37.129	Et	H	H	H	Cl	H
37.130	Et	H	H	H	Cl	F
37.131	Et	H	H	H	Cl	Cl
37.132	Et	H	H	H	Cl	Me
37.133	Et	H	H	H	Me	H
37.134	Et	H	H	H	Me	Cl
37.135	Et	H	H	H	Me	F
37.136	Et	H	H	H	Me	Me
37.137	Et	H	H	H	Ph	H
37.138	Et	H	H	H	Ph	Cl
37.139	Et	H	H	H	Ph	F
37.140	Et	H	H	H	Ph	Me
37.141	Et	F	H	H	H	H
37.142	Et	F	H	H	H	Cl
37.143	Et	F	H	H	H	F
37.144	Et	F	H	H	H	Me
37.145	Et	F	H	H	F	H
37.146	Et	F	H	H	F	Cl
37.147	Et	F	H	H	F	F
37.148	Et	F	H	H	F	Me

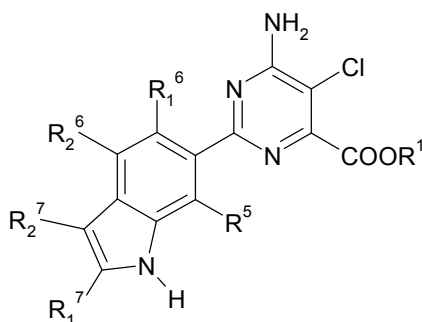
(continuación)

37.149	Et	F	H	H	Cl	H
37.150	Et	F	H	H	Cl	F
37.151	Et	F	H	H	Cl	Cl
37.152	Et	F	H	H	Cl	Me
37.153	Et	F	H	H	Me	H
37.154	Et	F	H	H	Me	Cl
37.155	Et	F	H	H	Me	F
37.156	Et	F	H	H	Me	Me
37.157	Et	F	H	H	Ph	H
37.158	Et	F	H	H	Ph	Cl
37.159	Et	F	H	H	Ph	F
37.160	Et	F	H	H	Ph	Me
37.161	Et	Cl	H	H	H	H
37.162	Et	Cl	H	H	H	Cl
37.163	Et	Cl	H	H	H	F
37.164	Et	Cl	H	H	H	Me
37.165	Et	Cl	H	H	F	H
37.166	Et	Cl	H	H	F	Cl
37.167	Et	Cl	H	H	F	F
37.168	Et	Cl	H	H	F	Me
37.169	Et	Cl	H	H	Cl	H
37.170	Et	Cl	H	H	Cl	F
37.171	Et	Cl	H	H	Cl	Cl
37.172	Et	Cl	H	H	Cl	Me
37.173	Et	Cl	H	H	Me	H
37.174	Et	Cl	H	H	Me	Cl
37.175	Et	Cl	H	H	Me	F
37.176	Et	Cl	H	H	Me	Me
37.177	Et	Cl	H	H	Ph	H
37.178	Et	Cl	H	H	Ph	Cl
37.179	Et	Cl	H	H	Ph	F

(continuación)

37.180	Et	Cl	H	H	Ph	Me
37.181	H	F	F	H	H	H
37.182	H	F	H	F	H	H

Tabla 38: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A15, R⁸, R^{3y} R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁶	R ⁷	R ⁷
38.001	H	H	H	H	H	H
38.002	H	H	H	H	H	Cl
38.003	H	H	H	H	H	F
38.004	H	H	H	H	H	Me
38.005	H	H	H	H	F	H
38.006	H	H	H	H	F	Cl
38.007	H	H	H	H	F	F
38.008	H	H	H	H	F	Me
38.009	H	H	H	H	Cl	H
38.010	H	H	H	H	Cl	F
38.011	H	H	H	H	Cl	Cl
38.012	H	H	H	H	Cl	Me
38.013	H	H	H	H	Me	H
38.014	H	H	H	H	Me	Cl
38.015	H	H	H	H	Me	F
38.016	H	H	H	H	Me	Me
38.017	H	H	H	H	Ph	H
38.018	H	H	H	H	Ph	Cl

(continuación)

38.019	H	H	H	H	Ph	F
38.020	H	H	H	H	Ph	Me
38.021	H	F	H	H	H	H
38.022	H	F	H	H	H	Cl
38.023	H	F	H	H	H	F
38.024	H	F	H	H	H	Me
38.025	H	F	H	H	F	H
38.026	H	F	H	H	F	Cl
38.027	H	F	H	H	F	F
38.028	H	F	H	H	F	Me
38.029	H	F	H	H	Cl	H
38.030	H	F	H	H	Cl	F
38.031	H	F	H	H	Cl	Cl
38.032	H	F	H	H	Cl	Me
38.033	H	F	H	H	Me	H
38.034	H	F	H	H	Me	Cl
38.035	H	F	H	H	Me	F
38.036	H	F	H	H	Me	Me
38.037	H	F	H	H	Ph	H
38.038	H	F	H	H	Ph	Cl
38.039	H	F	H	H	Ph	F
38.040	H	F	H	H	Ph	Me
38.041	H	Cl	H	H	H	H
38.042	H	Cl	H	H	H	Cl
38.043	H	Cl	H	H	H	F
38.044	H	Cl	H	H	H	Me
38.045	H	Cl	H	H	F	H
38.046	H	Cl	H	H	F	Cl
38.047	H	Cl	H	H	F	F
38.048	H	Cl	H	H	F	Me
38.049	H	Cl	H	H	Cl	H
38.050	H	Cl	H	H	Cl	F

(continuación)

38.051	H	Cl	H	H	Cl	Cl
38.052	H	Cl	H	H	Cl	Me
38.053	H	Cl	H	H	Me	H
38.054	H	Cl	H	H	Me	Cl
38.055	H	Cl	H	H	Me	F
38.056	H	Cl	H	H	Me	Me
38.057	H	Cl	H	H	Ph	H
38.058	H	Cl	H	H	Ph	Cl
38.059	H	Cl	H	H	Ph	F
38.060	H	Cl	H	H	Ph	Me
38.061	Me	H	H	H	H	H
38.062	Me	H	H	H	H	Cl
38.063	Me	H	H	H	H	F
38.064	Me	H	H	H	H	Me
38.065	Me	H	H	H	F	H
38.066	Me	H	H	H	F	Cl
38.067	Me	H	H	H	F	F
38.068	Me	H	H	H	F	Me
38.069	Me	H	H	H	Cl	H
38.070	Me	H	H	H	Cl	F
38.071	Me	H	H	H	Cl	Cl
38.072	Me	H	H	H	Cl	Me
38.073	Me	H	H	H	Me	H
38.074	Me	H	H	H	Me	Cl
38.075	Me	H	H	H	Me	F
38.076	Me	H	H	H	Me	Me
38.077	Me	H	H	H	Ph	H
38.078	Me	H	H	H	Ph	Cl
38.079	Me	H	H	H	Ph	F
38.080	Me	H	H	H	Ph	Me
38.081	Me	F	H	H	H	H

(continuación)

38.082	Me	F	H	H	H	Cl
38.083	Me	F	H	H	H	F
38.084	Me	F	H	H	H	Me
38.085	Me	F	H	H	F	H
38.086	Me	F	H	H	F	Cl
38.087	Me	F	H	H	F	F
38.088	Me	F	H	H	F	Me
38.089	Me	F	H	H	Cl	H
38.090	Me	F	H	H	Cl	F
38.091	Me	F	H	H	Cl	Cl
38.092	Me	F	H	H	Cl	Me
38.093	Me	F	H	H	Me	H
38.094	Me	F	H	H	Me	Cl
38.095	Me	F	H	H	Me	F
38.096	Me	F	H	H	Me	Me
38.097	Me	F	H	H	Ph	H
38.098	Me	F	H	H	Ph	Cl
38.099	Me	F	H	H	Ph	F
38.100	Me	F	H	H	Ph	Me
38.101	Me	Cl	H	H	H	H
38.102	Me	Cl	H	H	H	Cl
38.103	Me	Cl	H	H	H	F
38.104	Me	Cl	H	H	H	Me
38.105	Me	Cl	H	H	F	H
38.106	Me	Cl	H	H	F	Cl
38.107	Me	Cl	H	H	F	F
38.108	Me	Cl	H	H	F	Me
38.109	Me	Cl	H	H	Cl	H
38.110	Me	Cl	H	H	Cl	F
38.111	Me	Cl	H	H	Cl	Cl
38.112	Me	Cl	H	H	Cl	Me

(continuación)

38.113	Me	Cl	H	H	Me	H
38.114	Me	Cl	H	H	Me	Cl
38.115	Me	Cl	H	H	Me	F
38.116	Me	Cl	H	H	Me	Me
38.117	Me	Cl	H	H	Ph	H
38.118	Me	Cl	H	H	Ph	Cl
38.119	Me	Cl	H	H	Ph	F
38.120	Me	Cl	H	H	Ph	Me
38.121	Et	H	H	H	H	H
38.122	Et	H	H	H	H	Cl
38.123	Et	H	H	H	H	F
38.124	Et	H	H	H	H	Me
38.125	Et	H	H	H	F	H
38.126	Et	H	H	H	F	Cl
38.127	Et	H	H	H	F	F
38.128	Et	H	H	H	F	Me
38.129	Et	H	H	H	Cl	H
38.130	Et	H	H	H	Cl	F
38.131	Et	H	H	H	Cl	Cl
38.132	Et	H	H	H	Cl	Me
38.133	Et	H	H	H	Me	H
38.134	Et	H	H	H	Me	Cl
38.135	Et	H	H	H	Me	F
38.136	Et	H	H	H	Me	Me
38.137	Et	H	H	H	Ph	H
38.138	Et	H	H	H	Ph	Cl
38.139	Et	H	H	H	Ph	F
38.140	Et	H	H	H	Ph	Me
38.141	Et	F	H	H	H	H
38.142	Et	F	H	H	H	Cl
38.143	Et	F	H	H	H	F

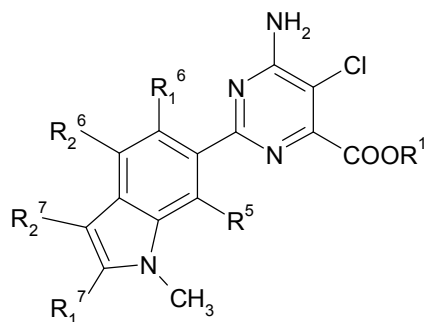
(continuación)

38.144	Et	F	H	H	H	Me
38.145	Et	F	H	H	F	H
38.146	Et	F	H	H	F	Cl
38.147	Et	F	H	H	F	F
38.148	Et	F	H	H	F	Me
38.149	Et	F	H	H	Cl	H
38.150	Et	F	H	H	Cl	F
38.151	Et	F	H	H	Cl	Cl
38.152	Et	F	H	H	Cl	Me
38.153	Et	F	H	H	Me	H
38.154	Et	F	H	H	Me	Cl
38.155	Et	F	H	H	Me	F
38.156	Et	F	H	H	Me	Me
38.157	Et	F	H	H	Ph	H
38.158	Et	F	H	H	Ph	Cl
38.159	Et	F	H	H	Ph	F
38.160	Et	F	H	H	Ph	Me
38.161	Et	Cl	H	H	H	H
38.162	Et	Cl	H	H	H	Cl
38.163	Et	Cl	H	H	H	F
38.164	Et	Cl	H	H	H	Me
38.165	Et	Cl	H	H	F	H
38.166	Et	Cl	H	H	F	Cl
38.167	Et	Cl	H	H	F	F
38.168	Et	Cl	H	H	F	Me
38.169	Et	Cl	H	H	Cl	H
38.170	Et	Cl	H	H	Cl	F
38.171	Et	Cl	H	H	Cl	Cl
38.172	Et	Cl	H	H	Cl	Me
38.173	Et	Cl	H	H	Me	H
38.174	Et	Cl	H	H	Me	Cl

(continuación)

38.175	Et	Cl	H	H	Me	F
38.176	Et	Cl	H	H	Me	Me
38.177	Et	Cl	H	H	Ph	H
38.178	Et	Cl	H	H	Ph	Cl
38.179	Et	Cl	H	H	Ph	F
38.180	Et	Cl	H	H	Ph	Me
38.181	H	F	F	H	H	H
38.182	H	F	H	F	H	H

Tabla 39: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A15, R⁸ representa metilo, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
39.001	H	H	H	H	H	H
39.002	H	H	H	H	H	Cl
39.003	H	H	H	H	H	F
39.004	H	H	H	H	H	Me
39.005	H	H	H	H	F	H
39.006	H	H	H	H	F	Cl
39.007	H	H	H	H	F	F
39.008	H	H	H	H	F	Me
39.009	H	H	H	H	Cl	H
39.010	H	H	H	H	Cl	F
39.011	H	H	H	H	Cl	Cl
39.012	H	H	H	H	Cl	Me
39.013	H	H	H	H	Me	H

(continuación)

39.014	H	H	H	H	Me	Cl
39.015	H	H	H	H	Me	F
39.016	H	H	H	H	Me	Me
39.017	H	H	H	H	Ph	H
39.018	H	H	H	H	Ph	Cl
39.019	H	H	H	H	Ph	F
39.020	H	H	H	H	Ph	Me
39.021	H	F	H	H	H	H
39.022	H	F	H	H	H	Cl
39.023	H	F	H	H	H	F
39.024	H	F	H	H	H	Me
39.025	H	F	H	H	F	H
39.026	H	F	H	H	F	Cl
39.027	H	F	H	H	F	F
39.028	H	F	H	H	F	Me
39.029	H	F	H	H	Cl	H
39.030	H	F	H	H	Cl	F
39.031	H	F	H	H	Cl	Cl
39.032	H	F	H	H	Cl	Me
39.033	H	F	H	H	Me	H
39.034	H	F	H	H	Me	Cl
39.035	H	F	H	H	Me	F
39.036	H	F	H	H	Me	Me
39.037	H	F	H	H	Ph	H
39.038	H	F	H	H	Ph	Cl
39.039	H	F	H	H	Ph	F
39.040	H	F	H	H	Ph	Me
39.041	H	Cl	H	H	H	H
39.042	H	Cl	H	H	H	Cl
39.043	H	Cl	H	H	H	F
39.044	H	Cl	H	H	H	Me

(continuación)

39.045	H	Cl	H	H	F	H
39.046	H	Cl	H	H	F	Cl
39.047	H	Cl	H	H	F	F
39.048	H	Cl	H	H	F	Me
39.049	H	Cl	H	H	Cl	H
39.050	H	Cl	H	H	Cl	F
39.051	H	Cl	H	H	Cl	Cl
39.052	H	Cl	H	H	Cl	Me
39.053	H	Cl	H	H	Me	H
39.054	H	Cl	H	H	Me	Cl
39.055	H	Cl	H	H	Me	F
39.056	H	Cl	H	H	Me	Me
39.057	H	Cl	H	H	Ph	H
39.058	H	Cl	H	H	Ph	Cl
39.059	H	Cl	H	H	Ph	F
39.060	H	Cl	H	H	Ph	Me
39.061	Me	H	H	H	H	H
39.062	Me	H	H	H	H	Cl
39.063	Me	H	H	H	H	F
39.064	Me	H	H	H	H	Me
39.065	Me	H	H	H	F	H
39.066	Me	H	H	H	F	Cl
39.067	Me	H	H	H	F	F
39.068	Me	H	H	H	F	Me
39.069	Me	H	H	H	Cl	H
39.070	Me	H	H	H	Cl	F
39.071	Me	H	H	H	Cl	Cl
39.072	Me	H	H	H	Cl	Me
39.073	Me	H	H	H	Me	H
39.074	Me	H	H	H	Me	Cl
39.075	Me	H	H	H	Me	F

(continuación)

39.076	Me	H	H	H	Me	Me
39.077	Me	H	H	H	Ph	H
39.078	Me	H	H	H	Ph	Cl
39.079	Me	H	H	H	Ph	F
39.080	Me	H	H	H	Ph	Me
39.081	Me	F	H	H	H	H
39.082	Me	F	H	H	H	Cl
39.083	Me	F	H	H	H	F
39.084	Me	F	H	H	H	Me
39.085	Me	F	H	H	F	H
39.086	Me	F	H	H	F	Cl
39.087	Me	F	H	H	F	F
39.088	Me	F	H	H	F	Me
39.089	Me	F	H	H	Cl	H
39.090	Me	F	H	H	Cl	F
39.091	Me	F	H	H	Cl	Cl
39.092	Me	F	H	H	Cl	Me
39.093	Me	F	H	H	Me	H
39.094	Me	F	H	H	Me	Cl
39.095	Me	F	H	H	Me	F
39.096	Me	F	H	H	Me	Me
39.097	Me	F	H	H	Ph	H
39.098	Me	F	H	H	Ph	Cl
39.099	Me	F	H	H	Ph	F
39.100	Me	F	H	H	Ph	Me
39.101	Me	Cl	H	H	H	H
39.102	Me	Cl	H	H	H	Cl
39.103	Me	Cl	H	H	H	F
39.104	Me	Cl	H	H	H	Me
39.105	Me	Cl	H	H	F	H
39.106	Me	Cl	H	H	F	Cl

(continuación)

39.107	Me	Cl	H	H	F	F
39.108	Me	Cl	H	H	F	Me
39.109	Me	Cl	H	H	Cl	H
39.110	Me	Cl	H	H	Cl	F
39.111	Me	Cl	H	H	Cl	Cl
39.112	Me	Cl	H	H	Cl	Me
39.113	Me	Cl	H	H	Me	H
39.114	Me	Cl	H	H	Me	Cl
39.115	Me	Cl	H	H	Me	F
39.116	Me	Cl	H	H	Me	Me
39.117	Me	Cl	H	H	Ph	H
39.118	Me	Cl	H	H	Ph	Cl
39.119	Me	Cl	H	H	Ph	F
39.120	Me	Cl	H	H	Ph	Me
39.121	Et	H	H	H	H	H
39.122	Et	H	H	H	H	Cl
39.123	Et	H	H	H	H	F
39.124	Et	H	H	H	H	Me
39.125	Et	H	H	H	F	H
39.126	Et	H	H	H	F	Cl
39.127	Et	H	H	H	F	F
39.128	Et	H	H	H	F	Me
39.129	Et	H	H	H	Cl	H
39.130	Et	H	H	H	Cl	F
39.131	Et	H	H	H	Cl	Cl
39.132	Et	H	H	H	Cl	Me
39.133	Et	H	H	H	Me	H
39.134	Et	H	H	H	Me	Cl
39.135	Et	H	H	H	Me	F
39.136	Et	H	H	H	Me	Me
39.137	Et	H	H	H	Ph	H

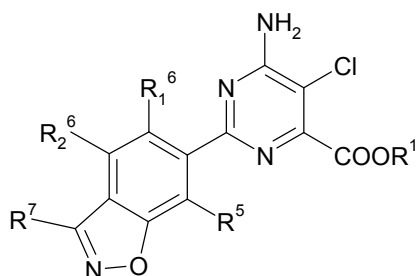
(continuación)

39.138	Et	H	H	H	Ph	Cl
39.139	Et	H	H	H	Ph	F
39.140	Et	H	H	H	Ph	Me
39.141	Et	F	H	H	H	H
39.142	Et	F	H	H	H	Cl
39.143	Et	F	H	H	H	F
39.144	Et	F	H	H	H	Me
39.145	Et	F	H	H	F	H
39.146	Et	F	H	H	F	Cl
39.147	Et	F	H	H	F	F
39.148	Et	F	H	H	F	Me
39.149	Et	F	H	H	Cl	H
39.150	Et	F	H	H	Cl	F
39.151	Et	F	H	H	Cl	Cl
39.152	Et	F	H	H	Cl	Me
39.153	Et	F	H	H	Me	H
39.154	Et	F	H	H	Me	Cl
39.155	Et	F	H	H	Me	F
39.156	Et	F	H	H	Me	Me
39.157	Et	F	H	H	Ph	H
39.158	Et	F	H	H	Ph	Cl
39.159	Et	F	H	H	Ph	F
39.160	Et	F	H	H	Ph	Me
39.161	Et	Cl	H	H	H	H
39.162	Et	Cl	H	H	H	Cl
39.163	Et	Cl	H	H	H	F
39.164	Et	Cl	H	H	H	Me
39.165	Et	Cl	H	H	F	H
39.166	Et	Cl	H	H	F	Cl
39.167	Et	Cl	H	H	F	F
39.168	Et	Cl	H	H	F	Me

(continuación)

39.169	Et	Cl	H	H	Cl	H
39.170	Et	Cl	H	H	Cl	F
39.171	Et	Cl	H	H	Cl	Cl
39.172	Et	Cl	H	H	Cl	Me
39.173	Et	Cl	H	H	Me	H
39.174	Et	Cl	H	H	Me	Cl
39.175	Et	Cl	H	H	Me	F
39.176	Et	Cl	H	H	Me	Me
39.177	Et	Cl	H	H	Ph	H
39.178	Et	Cl	H	H	Ph	Cl
39.179	Et	Cl	H	H	Ph	F
39.180	Et	Cl	H	H	Ph	Me
39.181	H	F	F	H	H	H
39.182	H	F	H	F	H	H

Tabla 40: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A16, R^3 y R^4 respectivamente representan hidrógeno y R^2 representa cloro:



Ej. N°	R^1	R^5	R_1^6	R_2^6	R^7
40.001	H	H	H	H	H
40.002	H	H	H	H	Me
40.003	H	H	H	H	Ph
40.004	H	H	H	H	F
40.005	H	H	H	H	Cl
40.006	H	Cl	H	H	H
40.007	H	Cl	H	H	Me
40.008	H	Cl	H	H	Ph

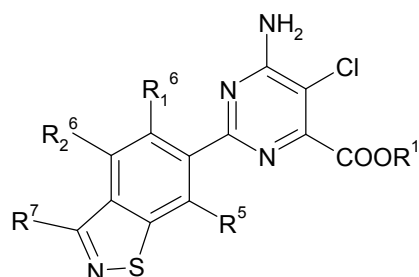
(continuación)

40.009	H	Cl	H	H	F
40.010	H	Cl	H	H	Cl
40.011	H	F	H	H	H
40.012	H	F	H	H	Me
40.013	H	F	H	H	Ph
40.014	H	F	H	H	F
40.015	H	F	H	H	Cl
40.016	Me	H	H	H	H
40.017	Me	H	H	H	Me
40.018	Me	H	H	H	Ph
40.019	Me	H	H	H	F
40.020	Me	H	H	H	Cl
40.021	Me	Cl	H	H	H
40.022	Me	Cl	H	H	Me
40.023	Me	Cl	H	H	Ph
40.024	Me	Cl	H	H	F
40.025	Me	Cl	H	H	Cl
40.026	Et	H	H	H	H
40.027	Et	H	H	H	Me
40.028	Et	H	H	H	Ph
40.029	Et	H	H	H	F
40.030	Et	H	H	H	Cl
40.031	Et	F	H	H	H
40.032	Et	F	H	H	Me
40.033	Et	F	H	H	Ph
40.034	Et	F	H	H	F
40.035	Et	F	H	H	Cl
40.036	Et	Cl	H	H	H
40.037	Et	Cl	H	H	Me
40.038	Et	Cl	H	H	Ph
40.039	Et	Cl	H	H	F

(continuación)

40.040	Et	Cl	H	H	Cl
40.041	H	F	F	H	H
40.042	H	F	H	F	H

Tabla 41: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A17, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:

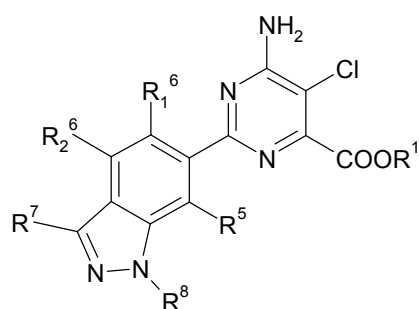


Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁷
41.001	H	H	H	H
41.002	H	H	H	Me
41.003	H	H	H	Ph
41.004	H	H	H	F
41.005	H	H	H	Cl
41.006	H	Cl	H	H
41.007	H	Cl	H	Me
41.008	H	Cl	H	Ph
41.009	H	Cl	H	F
41.010	H	Cl	H	Cl
41.011	H	F	H	H
41.012	H	F	H	Me
41.013	H	F	H	Ph
41.014	H	F	H	F
41.015	H	F	H	Cl
41.016	Me	H	H	H
41.017	Me	H	H	Me
41.018	Me	H	H	Ph
41.019	Me	H	H	F

(continuación)

41.020	Me	H	H	H	Cl
41.021	Me	Cl	H	H	H
41.022	Me	Cl	H	H	Me
41.023	Me	Cl	H	H	Ph
41.024	Me	Cl	H	H	F
41.025	Me	Cl	H	H	Cl
41.026	Et	H	H	H	H
41.027	Et	H	H	H	Me
41.028	Et	H	H	H	Ph
41.029	Et	H	H	H	F
41.030	Et	H	H	H	Cl
41.031	Et	F	H	H	H
41.032	Et	F	H	H	Me
41.033	Et	F	H	H	Ph
41.034	Et	F	H	H	F
41.035	Et	F	H	H	Cl
41.036	Et	Cl	H	H	H
41.037	Et	Cl	H	H	Me
41.038	Et	Cl	H	H	Ph
41.039	Et	Cl	H	H	F
41.040	Et	Cl	H	H	Cl
41.041	H	F	F	H	H
41.042	H	F	H	F	H

Tabla 42: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A18, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:

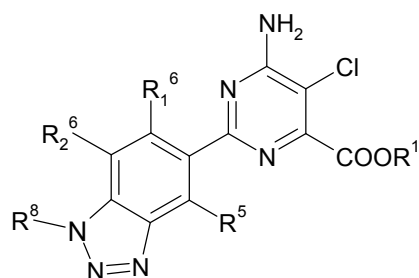


Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ⁷	R ⁸
42.001	H	H	H	H	H	H
42.002	H	H	H	H	Me	H
42.003	H	H	H	H	Ph	H
42.004	H	H	H	H	F	Me
42.005	H	H	H	H	Cl	H
42.006	H	Cl	H	H	H	Me
42.007	H	Cl	H	H	Me	Me
42.008	H	Cl	H	H	Ph	Me
42.009	H	Cl	H	H	F	H
42.010	H	Cl	H	H	Cl	H
42.011	H	F	H	H	H	Me
42.012	H	F	H	H	Me	H
42.013	H	F	H	H	Ph	H
42.014	H	F	H	H	F	Me
42.015	H	F	H	H	Cl	Me
42.016	Me	H	H	H	H	Et
42.017	Me	H	H	H	Me	Et
42.018	Me	H	H	H	Ph	Et
42.019	Me	H	H	H	F	Et
42.020	Me	H	H	H	Cl	Et
42.021	Me	Cl	H	H	H	Me
42.022	Me	Cl	H	H	Me	H
42.023	Me	Cl	H	H	Ph	H
42.024	Me	Cl	H	H	F	H
42.025	Me	Cl	H	H	Cl	Et
42.026	Et	H	H	H	H	Me
42.027	Et	H	H	H	Me	Me
42.028	Et	H	H	H	Ph	Me
42.029	Et	H	H	H	F	H
42.030	Et	H	H	H	Cl	H
42.031	Et	F	H	H	H	Me

(continuación)

42.032	Et	F	H	H	Me	Me
42.033	Et	F	H	H	Ph	H
42.034	Et	F	H	H	F	Et
42.035	Et	F	H	H	Cl	Et
42.036	Et	Cl	H	H	H	H
42.037	Et	Cl	H	H	Me	H
42.038	Et	Cl	H	H	Ph	H
42.039	Et	Cl	H	H	F	Me
42.040	Et	Cl	H	H	Cl	H
42.041	H	F	F	H	H	H
42.042	H	F	H	F	H	H

Tabla 43: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A19, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



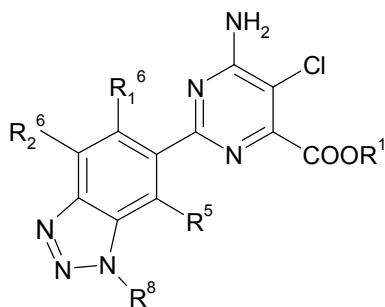
5

Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ₁ ⁶	R ₂ ⁶	R ⁸
43.001	H	H	H	H	H
43.002	H	H	H	H	Me
43.003	H	H	H	H	Et
43.004	H	F	H	H	H
43.005	H	F	H	H	Me
43.006	H	F	H	H	Et
43.007	H	Cl	H	H	H
43.008	H	Cl	H	H	Me
43.009	H	Cl	H	H	Et
43.010	Me	H	H	H	H

(continuación)

43.011	Me	H	H	H	Me
43.012	Me	H	H	H	Et
43.013	Me	F	H	H	H
43.014	Me	F	H	H	Me
43.015	Me	F	H	H	Et
43.016	Me	Cl	H	H	H
43.017	Me	Cl	H	H	Me
43.018	Me	Cl	H	H	Et
43.019	Et	H	H	H	H
43.020	Et	H	H	H	Me
43.021	Et	H	H	H	Et
43.022	Et	F	H	H	H
43.023	Et	F	H	H	Me
43.024	Et	F	H	H	Et
43.025	Et	Cl	H	H	H
43.026	Et	Cl	H	H	Me
43.027	Et	Cl	H	H	Et
43.028	H	F	F	H	H
43.029	H	F	H	F	H

Tabla 44: compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) en la que X representa N, A representa A20, R³ y R⁴ respectivamente representan hidrógeno y R² representa cloro:



Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁶	R ⁸
44.001	H	H	H	H	Me

(continuación)

44.002	H	H	H	H	Et
44.003	H	F	H	H	Me
44.004	H	F	H	H	Et
44.005	H	Cl	H	H	Me
44.006	H	Cl	H	H	Et
44.007	Me	H	H	H	Me
44.008	Me	H	H	H	Et
44.009	Me	F	H	H	Me
44.010	Me	F	H	H	Et
44.011	Me	Cl	H	H	Me
44.012	Me	Cl	H	H	Et
44.013	Et	H	H	H	Me
44.014	Et	H	H	H	Et
44.015	Et	F	H	H	Me
44.016	Et	F	H	H	Et
44.017	Et	Cl	H	H	Me
44.018	Et	Cl	H	H	Et
44.019	H	F	F	H	Me
44.020	H	F	H	F	Me

Las colecciones de compuestos de la fórmula (I) y/o sus sales que se pueden sintetizar de acuerdo con las reacciones anteriormente mencionadas, también se pueden preparar en forma paralela, pudiendo esto llevarse a cabo en forma manual, semiautomática o totalmente automática. Por ejemplo es posible automatizar la realización de la reacción, el procesamiento o la purificación de los productos y/o bien los pasos intermedios. En general esto se considera una forma de proceder como la describe por ejemplo D. Tiebes en *Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening* (editor Günther Jung), editorial Wiley 1999, en las páginas 1 a 34.

Para la ejecución de la reacción y el procesamiento en forma paralela, se pueden usar una serie de equipos que se pueden obtener en el mercado, por ejemplo bloques de reacción Calypso (Calypso reaction blocks) de la empresa Barnstead International, Dubuque, Iowa 52004–0797, EE.UU. o estaciones de reacción (reaction stations) de la empresa Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB 11 3AZ, Inglaterra o MultiPROBE Automated Workstations de la empresa Perkin Elmer, Waltham, Massachusetts 02451, EE.UU. Para la purificación paralela de compuestos de la fórmula general (I) y sus sales o de productos intermedios que se producen durante la preparación, se dispone entre otros de aparatos de cromatografía, por ejemplo de la empresa ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, EE.UU.

Los equipos indicados llevan a un procedimiento modular, en el que los pasos individuales están automatizados, aunque entre los pasos se deben realizar operaciones manuales. Esto se puede evitar al usar sistemas de automatización integrados de manera total o parcial, en los que los respectivos módulos de automatización, son operados, por ejemplo, por robots. Tales sistemas de automatización se pueden adquirir por ejemplo, en la empresa Caliper, Hopkinton, MA 01748, EE.UU.

La realización de algunos o de varios pasos de síntesis se puede ayudar mediante el uso de reactivos con soporte polimérico/resinas Scavanger. En la bibliografía especializada se describe un gran número de protocolos experimentales,

por ejemplo en ChemFiles, Vol. 4, N° 1, Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis (Sigma-Aldrich).

Además de los procedimientos descritos en el presente documento, la preparación de compuestos de la fórmula (I) y sus sales se puede efectuar total o parcialmente mediante procedimientos con el soporte de fases sólidas. A ese fin, los intermedios individuales o todos los intermedios de la síntesis o de una síntesis adaptada a la correspondiente forma de proceder, se enlazan con una resina de síntesis. Los procedimientos de síntesis con el soporte de fases sólidas se describen en forma exhaustiva en la bibliografía específica, p. ej., por Barry A. Bunin en "The Combinatorial Index", editorial Academic Press, 1998 y Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening (editor Günther Jung), Wiley, 1999. El uso de procedimientos de síntesis con el soporte de fases sólidas posibilita realizar una serie de protocolos conocidos en la bibliografía, que a su vez se pueden realizar en forma manual o automatizada. Las reacciones por ejemplo también se pueden llevar a cabo mediante tecnología IRORI en micro-reactores (microreactors) de la empresa Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Poway, CA92064, EE.UU.

La realización de algunos o de varios pasos de síntesis con fase sólida como también en fase líquida, se puede apoyar por medio del uso de la tecnología de microondas. En la bibliografía específica se describe una serie de informes de ensayo, por ejemplo en Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry (editor C. O. Kappe y A. Stadler), Wiley, 2005.

La preparación de acuerdo con los procedimientos que descritos en el presente documento proporciona compuestos de la fórmula (I) y sus sales en forma de colecciones de sustancias que se denominan bibliotecas. La presente invención proporciona también bibliotecas que contienen como mínimo dos compuestos de la fórmula (I) y sus sales.

Los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención (y/o sus sales), denominados an adelante conjuntamente "compuestos de acuerdo con la invención", presentan una excelente efectividad herbicida contra un amplio espectro de malas hierbas mono y dicotiledóneas anuales de importancia económica. Los principios activos también tienen un buen control de malas hierbas perennes que son difíciles de controlar y brotan de rizomas, raíces o de otros órganos perennes.

Por tanto es objeto de la presente invención también un procedimiento para controlar plantas no deseadas o para regular el crecimiento de plantas, preferentemente en cultivos de plantas, en el que uno o más compuesto(s) es/son aplicados a las plantas (por ejemplo malas hierbas tal como malas hierbas monocotiledóneas o dicotiledóneas o plantas de cultivos no deseadas), a las semillas (por ejemplo granos, semillas o partes de vegetales tal como tubérculos o renuevos con brotes) o al área en la que crecen las plantas (por ejemplo el área cultivada). En este contexto, los compuestos de acuerdo con la invención se pueden aplicar por ejemplo antes del sembrado (si es apropiado también mediante la incorporación en el suelo), en la pre-emergencia o la post-emergencia. Se mencionarán los ejemplos de representantes individuales de la flora de malas hierbas monocotiledóneas y dicotiledóneas que se pueden controlar mediante los compuestos de acuerdo con la invención, aunque no existe la intención de imponer una restricción a las especies mencionadas en particular.

Malas hierbas monocotiledóneas de los géneros: Aegilops, Agropiron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

Malas hierbas dicotiledóneas de los géneros: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Artemisia, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euforbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sfenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

Si los compuestos de acuerdo con la invención se aplican en la superficie del suelo previo a la germinación, se evita por completo la emergencia de los brotes de malas hierbas o el crecimiento de malas hierbas hasta presentar la primera hoja, luego dejan de crecer y finalmente se extinguen por completo en el transcurso de tres a cuatro semanas.

Al aplicar los principios activos a las partes verdes de las plantas en un procedimiento de post-emergencia, también se produce con celeridad una detención del crecimiento y las malas hierbas permanecen en el estadio de crecimiento que presentaban en el momento de la aplicación o después de un cierto plazo se extinguen por completo, de modo que la competencia de las malas hierbas tan perniciosa para las plantas de cultivos se elimina muy temprano y en forma exhaustiva.

Aunque los agentes herbicidas de los compuestos de acuerdo con la invención muestran una excelente acción herbicida frente a malas hierbas mono y dicotiledóneas, las plantas de cultivos de importancia económica, tal como cultivos

dicotiledóneos, por ejemplo del género *Arachis*, *Beta*, *Brassica*, *Cucumis*, *Cucurbita*, *Helianthus*, *Daucus*, *Glycine*, *Gossypium*, *Ipomoea*, *Lactuca*, *Linum*, *Lycopersicon*, *Nicotiana*, *Phaseolus*, *Pisum*, *Solanum*, *Vicia* o cultivos monocotiledóneos, por ejemplo del género *Allium*, *Ananas*, *Asparagus*, *Avena*, *Hordeum*, *Oryza*, *Panicum*, *Saccharum*, *Secale*, *Sorghum*, *Triticale*, *Triticum*, *Zea*, especialmente *Zea* y *Triticum*, solo se dañan de modo insignificante o no son dañadas de modo alguno, dependiendo de la estructura del compuesto de acuerdo con la invención particular y su índice de aplicación. Los compuestos de la invención en consecuencia son muy adecuados para combatir en forma selectiva el crecimiento de plantas no deseadas en plantaciones de cultivos agrícolas u ornamentales.

Además los compuestos de acuerdo con la invención (dependiendo de su estructura particular e índice de aplicación usado) también presentan excelentes propiedades de regulación del crecimiento en plantas de cultivo. Inciden en forma reguladora en el metabolismo propio de las plantas y se pueden así usar para actuar en forma dirigida sobre sustancias contenidas en las plantas y para facilitar la cosecha, como p. ej. al iniciar el secado y limitar el crecimiento. Además son adecuadas para el control general y la inhibición de crecimiento vegetativo no deseado, sin por ello eliminar las plantas en el proceso. Una inhibición del crecimiento vegetativo es de suma importancia en muchos cultivos mono y dicotiledóneos, dado que así se puede reducir o suprimir por completo el almacenamiento.

Debido a las propiedades herbicidas y de regulación de crecimiento de las plantas, los principios activos también se pueden usar para combatir plantas nocivas en cultivos de plantas genéticamente modificadas conocidas o aún en desarrollo. Las plantas transgénicas en general se caracterizan porque presentan propiedades especialmente beneficiosas, por ejemplo por ser resistentes frente a determinados pesticidas, ante todo determinados herbicidas, resistentes frente a patologías de plantas o agentes de patologías de plantas, como determinados insectos o microorganismos, como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades especiales se refieren, por ejemplo, al material de cosecha respecto de la cantidad, calidad, capacidad de almacenamiento, composición y sustancias especiales de contenido. Así se conocen plantas transgénicas con aumentado contenido de almidón o calidad de almidón modificada o aquellas con distinta composición del ácido graso del material de cosecha. Otras propiedades especiales pueden radicar en una tolerancia o resistencia contra factores de estrés abióticos, p. ej., calor, frío, sequía, salinidad y radiación ultravioleta.

Se prefiere la aplicación de los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención o de sus sales en cultivos transgénicos de importancia económica de plantas útiles y de adorno, p. ej., de cereales, como trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz y maíz o también cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, colza, patata, tomate, arveja y otras especies de hortalizas.

Preferentemente, los compuestos de la fórmula (I) se pueden usar como herbicidas en cultivos de plantas útiles que son resistentes a los efectos fitotóxicos de los herbicidas, o bien, fueron convertidas en resistentes por medios recombinantes.

Las vías usuales para la preparación de nuevas plantas que, en comparación con las plantas que existen hasta ahora, presenten características modificadas consisten por ejemplo en procedimientos clásicos de cultivo y en la producción de mutantes. En forma alternativa se pueden producir nuevas plantas con diferentes propiedades por medio de procedimientos de ingeniería genética (véanse p. ej., los documentos EP-A-0221044, EP-A-0131624). Se describieron por ejemplo en varios casos:

- modificaciones por ingeniería genética de plantas de cultivo a efectos de modificar el almidón sintetizado en las plantas (p. ej., documentos WO 92/011376 A, WO 92/014827 A, WO 91/019806 A),

- plantas de cultivo transgénicas que son resistentes a determinados herbicidas del tipo de los glifosinatos (cf. p. ej., los documentos EP-A-0242236 A, EP-A-0242246 A) o glifosatos (documento WO 92/000377 A) o de las sulfonilureas (documentos EP-A-0257993 A, US-A-5.013.659) o a combinaciones o mezclas de estos herbicidas mediante "gene Stacking", como plantas de cultivo transgénicas, por ejemplo, maíz o soja con el nombre comercial o la denominación Optimum™ GAT™ (tolerantes a glifosato ALS);

- plantas de cultivo transgénicas, por ejemplo algodón, con la capacidad de producir toxinas del *Bacillus thuringiensis* (toxinas Bt) que tornan resistentes las plantas contra determinadas plagas (documentos EP-A-0142924 A+, EP-A-0193259 A);

- plantas de cultivo transgénicas con modificada composición de ácido graso (documento WO 91/013972 A);

- plantas de cultivo modificadas por ingeniería genética con nuevas sustancias de contenido o metabolitos secundarios, p. ej., nuevas fitoalexinas, que generan una mayor resistencia a enfermedades (documentos EP-A-0309862 A, EP-A-0464461 A);

- plantas de cultivo modificadas por ingeniería genética con fotorespiración reducida que presentan mayores

rendimientos y una mayor tolerancia al estrés (documento EPA 0305398 A);

– plantas de cultivo transgénicas que producen proteínas de importancia farmacéutica o diagnóstica ("molecular pharming");

– plantas de cultivo transgénicas que se caracterizan por mayores rendimientos o una mejor calidad;

5 – plantas de cultivo transgénicas que se caracterizan por una combinación p. ej. de las nuevas propiedades anteriormente mencionadas ("gene stacking").

En principio se conocen numerosas técnicas de biología molecular con las cuales se pueden producir nuevas plantas transgénicas con propiedades modificadas, véase p. ej., I. Potrykus y G. Spangenberg (eds.) *Gene Transfer to Plants*, Springer Lab Manual (1995), editorial Springer Berlín, Heidelberg, o Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423–431).

Para tales manipulaciones de ingeniería genética se pueden introducir moléculas de ácido nucleico en plásmidos que permiten una mutagénesis o una modificación de secuencia mediante la recombinación de secuencias de ADN. Con ayuda de los procedimientos estándar se pueden por ejemplo efectuar recambios de bases, eliminar secuencias parciales o agregarse secuencias naturales o sintéticas. Para la unión de los fragmentos de ADN entre sí, se pueden colocar adaptadores o conectores en los fragmentos de ADN, véase p. ej., Sambrook et al., 1989, *Molecular Cloning, A Laboratory Manual*, 2ª edic. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; o Winnacker "Gene y Klone", VCH Weinheim 2ª edición 1996.

La obtención de células de plantas con una menor actividad del producto génico se puede lograr por ejemplo mediante la expresión de al menos un correspondiente ARN de sentido contrario, un ARN en el sentido del marco de lectura para lograr el efecto de cosupresión o la expresión de al menos una ribozima construida de modo correspondiente, que escinde específicamente transcripciones del producto génico que se menciona anteriormente.

Para ello, por una parte se pueden usar moléculas de ADN, que incluyen toda la secuencia codificadora de un producto génico incluyendo las secuencias flanqueantes eventualmente existentes, como también moléculas de ADN que sólo comprenden partes de la secuencia codificadora, siendo que estas partes deben tener la longitud suficiente, para lograr el efecto anti sentido en las células. También es posible usar secuencias de ADN que presentan un alto grado de homología con las secuencias codificadoras de un producto génico, pero no son totalmente idénticas.

En la expresión de moléculas de ácido nucleico en plantas, la proteína sintetizada puede estar localizada en cualquier compartimiento de la célula de la planta. Pero para lograr la ubicación en un determinado compartimiento, la región codificadora puede p. ej. enlazarse con secuencias de ADN, que aseguran la ubicación en un determinado compartimiento. Tal tipo de secuencias son conocidas por el experto en la técnica (véase por ejemplo, Braun et al., *EMBO J.* 11 (1992), 3219–3227; Wolter et al., *Proc. Natl. Acad. Sci. USA* 85 (1988), 846–850; Sonnewald et al., *Plant J.* 1 (1991), 95–106). La expresión de las moléculas de ácido nucleico también puede tener lugar en las organelas de las células de las plantas.

Las células de plantas transgénicas se pueden regenerar según técnicas conocidas para formar plantas completas. En las plantas transgénicas se puede tratar principalmente de plantas de cualquier especie de plantas conocida, es decir, tanto de plantas monocotiledóneas, como también de dicotiledóneas.

De ese modo se pueden obtener plantas transgénicas, que presentan propiedades modificadas mediante la sobreexpresión, supresión o inhibición de genes o secuencias de genes homólogos (= naturales) o la expresión de genes o secuencias de genes heterólogos (= ajenos).

Los compuestos de acuerdo con la invención (I) preferentemente se pueden aplicar en cultivos transgénicos que son resistentes a sustancias de crecimiento, como p. ej. 2,4 D, dicamba o contra herbicidas, que inhiben enzimas esenciales de plantas, p. ej. acetolactatosintasas (ALS), EPSP sintasas, glutaminsintasas (GS) o hidroxifenilpiruvato dioxigenasas (HPPD) o bien son resistentes a herbicidas del grupo de las sulfonilureas, los glifosatos, los glufosinatos o benzoilsoxazol y sustancias activas análogas o a combinaciones cualesquiera de estos principios activos.

Los compuestos de la invención de manera especialmente preferente se pueden aplicar en cultivos transgénicos que son resistentes a una combinación de glifosatos y glufosinatos, glifosatos y sulfonilureas o imidazolinonas. De manera muy especialmente preferente los compuestos de acuerdo con la invención se pueden usar en plantas de cultivos transgénicas, como por ejemplo, maíz o soja con el nombre comercial o la denominación Optimum™ GAT™ (tolerantes a glifosato ALS).

Al aplicar los principios activos de acuerdo con la invención en cultivos transgénicos, además de los efectos que se

observan en otros cultivos respecto de plantas nocivas, con frecuencia se producen efectos que son específicos para la aplicación en el respectivo cultivo transgénico, por ejemplos un espectro de malas hierbas modificado o especialmente modificado, que puede ser combatido, diferentes cantidades del producto que se pueden usar para la aplicación, preferentemente una buena capacidad de combinación con los herbicidas, a los que es resistente el cultivo transgénico, así como la acción sobre el crecimiento y el rendimiento de plantas de cultivo transgénicas.

Por lo tanto es objeto de la invención también el uso de los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención como herbicidas para combatir malas hierbas en plantas de cultivo transgénicas.

Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden usar, por ejemplo, en forma de polvos humectables, concentrados emulsificables, soluciones pulverizables, sustancias de rociado o granulados en las formulaciones usuales. Son objeto de la invención por lo tanto también agentes herbicidas y reguladoras del crecimiento de plantas que comprenden los compuestos de acuerdo con la invención.

Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden formular de diferentes maneras dependiendo de los parámetros biológicos y/o fisicoquímicos que se requieren. Como posibles formulaciones se incluyen por ejemplo: polvos humectables (WP), polvos solubles en agua (SP), concentrados solubles en agua, concentrados emulsionables (EC), emulsiones (EW), como emulsiones aceite en agua y agua en aceite, soluciones pulverizables, concentrados en suspensión (SC), dispersiones sobre la base de aceite o agua, soluciones miscibles en aceite, suspensiones en cápsula (CS), sustancias de rociado (DP), desinfectantes, granulados para esparcir y aplicar en el suelo, granulados (GR) en forma de microgranulados, granulados para rociado, aspiración y absorción, granulados dispersables en agua (WG), granulados solubles en agua (SG), formulaciones ULV, microcápsulas y ceras.

Estos distintos tipos de formulación en principio se conocen y se describen por ejemplo en: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Tomo 7, C. editorial Hanser Múnich, 4ª edic. 1986, Wade van Valquemburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3ª ed. 1979, G. Goodwin Ltd. Londres.

Los adyuvantes de formulación necesarios, como materiales inertes, agentes tensioactivos, disolventes y demás aditivos también son de conocimiento general y se describen por ejemplo en: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2ª ed., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2ª ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide", 2ª ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Tomo 7, C. editorial Hanser Múnich, 4ª edic. 1986.

Sobre la base de estas formulaciones también se pueden preparar combinaciones con otras sustancias de acción pesticida, como por ejemplo, insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, así como con protectores selectivos, fertilizantes y/o reguladores de crecimiento, p. ej., en forma de una formulación lista para usar o como mezcla de tanque. Protectores selectivos adecuados son por ejemplo, mephenpir-dietilo, cipsosulfamida, isoxadifen-etilo, cloquintocet-mexilo y dicloromida.

Los polvos para rociado son preparados que se pueden dispersar en agua en forma homogénea, que además del principio activo y un diluyente o sustancia inerte, contienen agentes tensioactivos del tipo iónico y/o no iónico (humectantes, agentes dispersantes), p. ej. alquiflenoles polioxietilenados, alcoholes grasos polioxietilados, aminas grasas polioxietiladas, poliglicoléter-sulfatos de alcoholes grasos, alcansulfonatos, alquilbencensulfonatos, ligninsulfonato de sodio, 2,2'-dinaftilmetan-6,6'-disulfonato de sodio, dibutilnaftalen-sulfonato de sodio o también oleoilmetiltaurina de sodio. Para preparar los polvos para rociado, los principios activos herbicidas se trituran por ejemplo en los dispositivos habituales, como molinos de martillo, molinos de soplantes y molinos de chorro de aire y en forma simultánea o sucesiva se mezclan con los coadyuvantes de formulación.

Los concentrados emulsionables se preparan mediante la disolución del principio activo en un disolvente orgánico, p. ej., butanol, ciclohexanona, dimetilformamida, xileno o también aromáticos de punto de ebullición superior o hidrocarburos y mezclas de los disolventes orgánicos con el agregado de uno o varios agentes tensioactivos del tipo iónico o no iónico (emulsionantes). Como emulsionantes pueden usarse p. ej.: sales de calcio del ácido alquilarylsulfónico como Ca-dodecylbencensulfonato o emulsionantes no iónicos como poliglicoléter del ácido graso, alquil-arilpoliglicoléter, poliglicoléter del alcohol graso, productos de condensación de óxido de propileno- óxido de etileno, alquilpoliéter, sorbitanéster como p. ej., éster del ácido graso de sorbitano o éster de polioxetilenosorbitano como p. ej., éster del ácido graso polioxietilen-sorbitano.

Los productos para espolvoreado se obtienen por triturado del principio activo con sustancias sólidas finamente trituradas, p. ej. talco, arcillas naturales, como caolín, bentonita y pirofilita o tierra de diatomeas.

Los concentrados en suspensión pueden ser sobre la base de agua o de aceite. Se pueden preparar, por ejemplo, al

triturar en húmedo mediante molinos de perlas usuales en el mercado y eventualmente el agregado de sustancias tensioactivas, como ya se indicaron p.ej. en los tipos de formulación anteriormente enunciados.

Las emulsiones, p.ej. emulsiones de aceite en agua (EW), se pueden preparar por ejemplo mediante agitadores, molinos coloidales y/o mezcladores estáticos usando disolventes orgánicos acuosos y eventualmente agentes tensioactivos, como ya se indicaron p.ej. en los tipos de formulación anteriormente enunciados.

Los granulados pueden prepararse ya sea por rociado del principio activo sobre material inerte granulado con capacidad de absorción o a través de la aplicaciones de concentrados de principio activo mediante adhesivos, p. ej. alcohol polivinílico, sal de sodio del ácido poliacrílico o también aceites minerales, en la superficie de vehículos como arena, caolinita o material inerte granulado. También se pueden granular principios activos adecuados del modo usual para la preparación de granulados de fertilizantes, en caso deseado mezclados con fertilizantes.

Los granulados dispersables en agua, por lo general se preparan según los procedimientos habituales como secado por rociado, granulado en lecho fluidizado, granulado con disco, mezclado con mezcladores de alta velocidad y extrusión sin material inerte sólido.

Para la preparación de granulados con disco, de lecho fluidizado, por extrusión y por rociado, véase p. ej., los procedimientos en "Spray-Drying Handbook" 3ª ed. 1979, G. Goodwin Ltd., Londres; J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, páginas 147 y siguientes; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5ª ed., McGraw-Hill, Nueva York 1973, pág. 8-57.

Para mayores detalles respecto de la formulación de herbicidas, véase p. ej., G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., Nueva York, 1961, páginas 81-96 y J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5ª ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, páginas 101-103.

Las preparaciones agroquímicas por lo general contienen del 0,1 al 99 % en peso, en especial del 0,1 al 95 % en peso, de los compuestos de acuerdo con la invención.

En polvos humectables, las concentraciones de principio activo contienen p. ej. aproximadamente del 10 al 90 % en peso, el resto hasta el 100 % en peso de los componentes usuales de formulación. En los concentrados emulsionables, la concentración del principio activo puede ser de alrededor del 1 al 90 %, preferentemente del 5 al 80 % en peso. Las formulaciones en polvo contienen del 1 al 30 % en peso de principio activo, preferentemente en su mayoría del 5 al 20 % en peso de principio activo; las soluciones pulverizables contienen alrededor del 0,05 al 80 %, preferentemente del 2 al 50 % en peso de principio activo. En granulados dispersibles en agua, el contenido de principio activo depende en parte, si el compuesto activo es líquido o sólido y qué adyuvantes de granulación, sustancias de relleno etc. se usan. En granulados dispersables en agua, el contenido del principio activo, se ubica por ejemplo entre el 1 y el 95 % en peso, preferentemente entre el 10 y el 80 % en peso.

Además las formulaciones de ingredientes activos mencionados opcionalmente comprenden los respectivos agentes adhesivos, humectantes, de dispersión, de emulsión, de penetración, conservantes, anticongelantes y disolventes, sustancias de relleno, vehículos y colorantes, antiespumantes, inhibidores de evaporación usuales y agentes que modifican el valor del pH y la viscosidad.

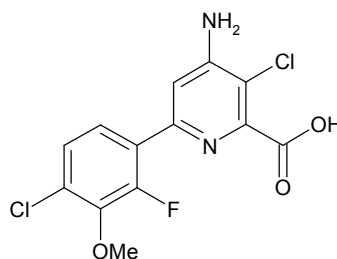
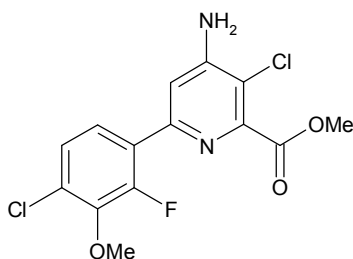
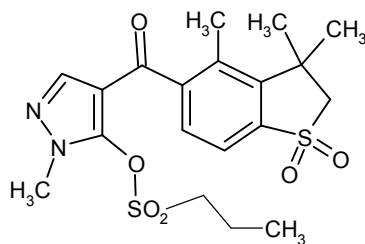
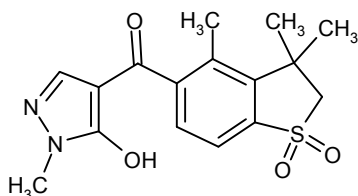
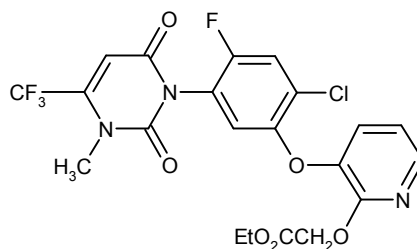
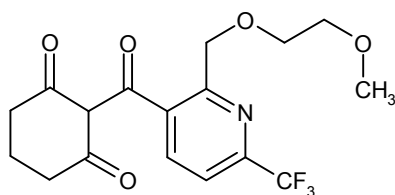
Sobre la base de estas formulaciones también pueden prepararse combinaciones con otras sustancias de acción pesticida, como por ejemplo, insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, como también con protectores selectivos, fertilizantes y/o reguladores de crecimiento, por ejemplo, en forma de una formulación lista para usar o como mezcla para tanque.

Como asociados de combinación para los compuestos de acuerdo con la invención en formulaciones de mezcla o en mezclas para tanque son por ejemplo sustancias activas conocidas que se basan en una inhibición de por ejemplo acetolactat-sintasa, acetil-Coenzim-A-carboxilasa, acetil-CoA carboxilasa, celulosa sintasa, enolpiruvilshikimato-3-fosfato sintasa, glutamina sintetasa, p-hidroxifenilpiruvato dioxigenasa, fitona desaturasa, fotosistema I, fotosistema II, protoporfirinogen oxidasa, como se describen p. ej., en Weed Research 26, 441-445 (1986), o en el manual "The Pesticide Manual", 15ª edición 1997, The British Crop Protection Council y la Royal Soc. of Chemistry, 2006 y en la bibliografía allí citada. Como herbicidas conocidos o reguladores de crecimiento que se pueden combinar con los compuestos de acuerdo con la invención se pueden nombrar p. ej. los siguientes principios activos (los herbicidas se denominaron allí ya sea con su "nombre común" según la International Organization for Standardization (ISO) o con el nombre químico, eventualmente junto con el número de código usual) e incluyen siempre todas sus formas de uso, tal como ácidos, sales, ésteres e isómeros, tal como esteroisómeros e isómeros ópticos. Se mencionan a modo de ejemplo una forma de aplicación y en parte también varias formas de aplicación:

acetocloro, acibenzolar, acibenzolar-S-metilo, acifluorofeno, acifluorofen-sodio, aclonifeno, alacloro, alidocloro, aloxidim,

aloxidim-sodio, ametrina, amicarbazona, amidocloro, amidosulfurona, aminociclopiracloro, aminopirralida, amitrol, sulfamato de amonio, ancimidol, anilofos, asulam, atrazina, azafenidina, azimsulfurona, aziprotrina, beflubutamida, benazolina, benazolin-etilo, bencarbazona, benfluralina, benfuresato, bensiulida, bensiulfurona, bensiulfuron-metilo, bentazona, benzfendizona, benzobiciclona, benzofenap, benzofluor, benzoilprop, bicilopirona, bifenox, bilanafos, bilanafos-sodio, bispiribac, bispiribac-sodio, bromacilo, bromobutida, bromofenoxim, bromoxinilo, bromurona, buminafos, busoxinona, butacloro, butafenacilo, butamifos, butenacloro, butralina, butroxidim, butilato, cafenstrol, carbetamida, carfentrazona, carfentrazon-etilo, clorometoxifeno, cloramben, clorazifop, clorazifop-butilo, clorobromurona, clorobufam, clorofenac, clorofenac-sodio, clorofenprop, cloroflurenol, cloroflurenol-metilo, cloridazona, clorimurona, clorimuron-etilo, cloruro de cloromequat, clornitrofenol, cloroftalim, clortal-dimetilo, clortolurona, clorsulfurona, cinidona, cinidon-etilo, cinmetilina, cinosulfurona, cletodim, clodinafop, clodinafop-propargilo, clofencet, clomazona, clomeprop, cloprop, clopiralida, cloransulam, cloransulam-metilo, cumilurona, cianamida, cianazina, ciclanilida, cicloato, ciclosulfamurona, cicloxidim, ciclurona, cyhalofop, cyhalofop-butilo, ciperquat, ciprazina, ciprazol, 2,4-D, 2,4-DB, daimuron/dymrona, dalapon, daminozida, dazomet, n-decanol, desmedifam, desmetrina, detosil-pirazolato (DTP), diallato, dicamba, dichlobenilo, diclorprop, diclorprop-P, diclofop, diclofop-metilo, diclofop-P-metilo, diclosulam, dietatilo, dietatil-etilo, difenoxurona, difenzoquat, diflufenican, diflufenzopir, diflufenzopir-sodio, dimefurona, dikegulac-sodio, dimepiperato, dimetacoloro, dimetametrina, dimetenamida, dimetenamid-P, dimetipina, dimetrasulfurona, dinitramina, dinoseb, dinoterb, difenaceta, dipropetrina, diquat, diquat-dibromuro, ditiopir, diurona, DNOC, eglinazina-etilo, endotal, EPTC, esprocarb, etalfluralina, etamsulfuron-metilo, etefona, etidimurona, etiozina, etofumesato, etoxifeno, etoxifen-etilo, etoxisulfurona, etobenzanida, F-5331, es decir, N-[2-cloro-4-fluoro-5-[4-(3-fluoropropil)-4,5-dihidro-5-oxo-¹H-tetrazol-1-il]fenil] etanosulfonamida, F-7967, es decir, 3-[7-cloro-5-fluoro-2-(trifluorometil)-1H-benzimidazol-4-il]-1-metil-6-(trifluorometil)-pirimidin-2,4(1H,3H)-diona, fenoprop, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etilo, fenoxaprop-P-etilo, fenoxasulfona, fentrazamida, fenurona, flamprop, flamprop-M-isopropilo, flamprop-M-metilo, flazasulfurona, florasulam, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butilo, fluazifop-P-butilo, fluazolato, flucarbazona, flucarbazon-sodio, flucetosulfurona, flucloalrina, flufenacet (tiafluamida), flufenpir, flufenpir-etilo, flumetralina, flumetsulam, flumiclorac, flumiclorac-pentilo, flumioxazina, flumipropin, fluometurona, fluorodifeno, fluoroglicofeno, fluoroglicofen-etilo, flupoxam, flupropacilo, flupropanato, flupirsulfurona, flupirsulfuron-metil-sodio, flurenol, flurenol-butilo, fluridona, flurocloridona, fluoxipir, fluoxipir-meptilo, flurprimidol, flurtamona, flutiacet, flutiacet-metilo, flutiamida, fomesafen, foramsulfurona, forclorofenurona, fosamina, furiloxifeno, ácido giberélico, glufosinato, glufosinato-amonio, glufosinato-P, glufosinato-P-amonio, glufosinato-P-sodio, glifosato, glifosato-isopropilamonio, H-9201, es decir, O-(2,4-dimetil-6-nitrofenil)-O-etil-isopropilfosforamidotoato, halosafeno, halosulfurona, halosulfuron-metilo, haloxifop, haloxifop-P, haloxifop-etoxietilo, haloxifop-P-etoxietilo, haloxifop-metilo, haloxifop-P-metilo, hexazinona, HW-02, es decir, 1-(dimetoxifosforil)-etil(2,4-diclorofenoxi)acetato, imazametabenz, imazametabenz-metilo, imazamox, imazamox-amonio, imazapic, imazapir, imazapir-isopropilamonio, imazaquina, imazaquin-amonio, imazetapir, imazetapir-amonio, imazosulfurona, inabenfida, indanofano, indaziflam, ácido indolacético (IAA), ácido 4-indol-3-ilbutírico (IBA), yodosulfurona, yodosulfuron-metil-sodio, ioxinilo, ipfencarbazona, isocarbamida, isopropalina, isoproturona, isourona, isoxabeno, isoxaclortol, isoxaflutol, isoxapirifop, KUH-043, es decir, 3-([5-(difluorometil)-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfonil)-5,5-dimetil-4,5-dihidro-1,2-oxazol, karbutilato, cetospiradox, lactofeno, lenacilo, linurona, hidrazida del ácido maleico, MCPA, MCPB, MCPB-metilo, -etilo y -sodio, mecoprop, mecoprop-sodio, mecoprop-butotilo, mecoprop-P-butotilo, mecoprop-P-dimetilamonio, mecoprop-P-2-etilhexilo, mecoprop-P-potasio, mefenacet, mefluiduro, mepiquat-cloruro, mesosulfurona, mesosulfuron-metilo, mesotriona, metabenzitiazurona, metam, metamifop, metamitrona, metazacloro, metzasulfurona, metazol, metiopirsulfurona, metiozolina, metoxifenona, metildimrona, 1-metilciclopropeno, isotiocianato de metilo, metobenzurona, metobenzurona, metobromurona, metolacoloro, S-metolacoloro, metosulam, metoxurona, metribuzina, metsulfurona, metsulfuron-metilo, molinato, monalida, monocarbamida, monocarbamida dihidrosulfato, monolinurona, monosulfurona, monosulfuron-éster, monurona, MT 128, es decir, 6-cloro-N-[(2E)-3-cloroprop-2-en-1-il]-5-metil-N-fenilpiridazin-3-amina, MT-5950, es decir, N-[3-cloro-4-(1-metiletil)fenil]-2-metilpentanamida, NGGC-011, naproanilida, napropamida, naptalam, NC-310, es decir, 4-(2,4-diclorobenzoil)-1-metil-5-benciloxipirazol, neburona, nicosulfurona, nipiraclorfenol, nitalina, nitrofenol, nitrofenolato-sodio (mezcla isomérica), nitrofluorofeno, ácido nonanoico, oxifluorazona, orbencarb, ortosulfamurona, orizalina, oxadiargilo, oxadiazona, oxasulfurona, oxazicloromefona, oxifluorofeno, paclobutrazol, paraquat, paraquat dicloruro, ácido pelargónico (ácido nonanoico), pendimetilina, pendralina, penoxsulam, pentanocloro, pentoxazona, perfluidona, petoxamida, fenisofam, fenmedifam, fenmedifam-etilo, picloram, picolinafeno, pinoxadeno, piperofos, pirifenop, pirifenop-butilo, pretilacoloro, primisulfurona, primisulfuron-metilo, probenazol, profluazol, prociazina, prodiamina, prifluralina, profoxidima, prohexadiona, prohexadiona-calcio, prohidrojasmona, prometon, prometrina, propacloro, propanilo, propaquizafop, propazina, propham, propisocloro, propoxicarbazona, propoxicarbazona-sodio, propyzamida, prosulfalina, prosulfocarb, prosulfurona, prinacloro, piraclonilo, pirafufen, pirafufen-etilo, pirasulfotol, pirazolinato (pirazolato), pirazosulfurona, pirazosulfuron-etilo, pirazoxifeno, piribambenz, piribambenz-isopropilo, piribambenz-propilo, piribenzoxim, piributicarb, piridafol, piridato, pirifitalida, piriminobac, piriminobac-metilo, pirimisulfan, piritiobac, piritiobac-sodio, piroxasulfona, piroxsulam, quinclozac, quinmerac, quincloamina, quizalofop, quizalofop-etilo, quizalofop-P, quizalofop-P-etilo, quizalofop-P-tefurilo, rimsulfurona, saflufenacilo, secbumetona, setoxidima, sidurona, simazina, simetrina, SN-106279, es decir, (2R)-2-([7-[2-cloro-4-(trifluorometil)fenoxi]-2-naftil]oxi)propanoato de metilo, sulcotriona, sulfalato (CDEC), sulfentrazona, sulfometurona, sulfometuron-metilo, sulfosato (glifosato-trimesio), sulfosulfurona, SYN-523, SYP-249, es decir, 1-etoxi-3-metil-1-oxobut-3-en-2-il-5-[2-cloro-4-(trifluorometil)fenoxi]-2-

5 nitrobenzoato, SYP-300, es decir, 1-[7-fluoro-3-oxo-4-(prop-2-in-1-il)-3,4-dihidro-2H-1,4-benzoxazin-6-il]-3-propil-2-tioxoimidazolidin-4,5-diona, tebutam, tebutiurona, tecnazeno, tefuriltriona, tembotriona, tepraloxidim, terbacilo, terbucarb, terbucloro, terbumetona, terbutilazina, terbutrina, tenilcloro, tiafluamida, tiazaflurona, tiazopir, tidiazimina, tidiazurona, tiencarbazona, tiencarbazón-metilo, tifensulfurona, tifensulfuron-metilo, tiobencarb, tiocarbacilo, tralcoxidima, triallato, triasulfurona, triaziflam, triazofenamida, tribenurona, tribenuron-metilo, ácido tricloroacético (TCA), triclopir, tridifano, trietazina, trifloxisulfurona, trifloxisulfuron-sodio, trifluralina, triflusulfurona, triflusulfuron-metilo, trimeturona, trinexapac, trinexapac-etilo, tritosulfurona, tsitodef, uniconazol, uniconazol-P, vernolato, ZJ-0862, es decir, 3,4-dicloro-N-{2-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)oxi]bencil}anilina, y los siguientes compuestos:



10

Para el uso, las formulaciones disponibles en la forma habitual en el mercado, se diluyen eventualmente en el modo habitual, p. ej. en el caso de polvos rociables, concentrados emulsionables, dispersiones y granulados dispersibles en agua mediante el uso de agua. Las preparaciones en polvo, los granulados para el suelo o bien los granulados esparcibles, así como las soluciones humectables, por lo general no se diluyen con otras sustancias inertes antes del uso.

15

Debido a las condiciones externas como la temperatura, la humedad, el tipo de herbicida usado, entre otros, varía el requerimiento de cantidad aplicada de los compuestos de acuerdo con la invención. Puede variar dentro de amplios límites, p. ej., entre 0,001 y 1,0 kg/ha o mayor cantidad de sustancia activa, pero preferentemente se ubica entre 0,005 y 750 g/ha.

20 Los ejemplos siguientes explican la invención.

A. Ejemplos químicos

1. Preparación de 4-amino-3-cloro-6-(7-fluoro-2-fenil-1,3-benzoxazol-6-il)-piridin-2-carboxilato de metilo (Ejemplo N° 8.019)

A una solución de 0,3 g (1,13 mmol) de 4-amino-6-bromo-3-cloropiridin-2-carboxilato de metilo en 20 ml de dioxano se

añaden 0,024 g (0,03 mmol) de $(\text{PPh}_3)_2\text{PdCl}_2$ y se agita esta mezcla durante 30 min a temperatura ambiente (TA). Después se añaden sucesivamente 0,35 g (1,35 mmol) de ácido (7-fluoro-2-fenil-1,3-benzoxazol-6-il)borónico, 0,47 g (3,4 mmol) de K_2CO_3 y 2 g (111 mmol) de H_2O a esta mezcla que a continuación se agita durante 6 h a reflujo. Se deja reposar esta mezcla durante otras 12 h a TA y después se vierte sobre 40 ml de H_2O . Esta mezcla se extrae varias veces con CH_2Cl_2 , y se seca la fase orgánica combinada sobre Na_2SO_4 y a continuación se concentra. La purificación cromatográfica en gel de sílice con heptano/etiléster de ácido acético (3/7) como eluyente da 0,16 g (36 %) de producto. RMN de ^1H (CDCl_3): δ 8,30, 8,00, 7,55 (3m, 5H, C_6H_5), 7,60, 7,55 (2d, 2H, anillo benzoxazol), 7,30 (s, 1H, piridina) 4,85 (bs, 2H, NH_2), 4,00 (s, 3H, COOCH_3).

2. Preparación de 4-amino-3-cloro-6-(1,3-benzoxazol-6-il)piridin-2-carboxilato de metilo (Ejemplo N° 8.013)

A una solución de 0,3 (1,13 mmol) 4-amino-6-bromo-3-cloropiridin-2-carboxilato de metilo en 20 ml de dioxano se añaden 0,024 g (0,03 mmol) de $(\text{PPh}_3)_2\text{PdCl}_2$ y se agita esta mezcla 30 min a TA. Después se añaden sucesivamente 0,28 g (1,13 mmol) de 6-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1,3-benzoxazol, 0,47 g (3,4 mmol) de K_2CO_3 y 2 g (111 mmol) de H_2O a esta mezcla que entonces se agita durante 6 h a reflujo. Se deja reposar esta mezcla durante otras 12 h a TA y después se vierte sobre 40 ml de H_2O . Esta mezcla se extrae varias veces con CH_2Cl_2 , se seca la fase orgánica combinada sobre Na_2SO_4 y a continuación se concentra. La purificación cromatográfica en gel de sílice con heptano/etiléster de ácido acético(3/7) como eluyente da 0,1 g (29 %) de producto. RMN de ^1H (CDCl_3): δ 8,25 (s, 1H, benzoxazol), 8,15 (s, 1H, benzoxazol), 7,90, 7,80 (2d, 2H, benzoxazol), 7,20 (s, 1H, piridina), 4,80 (bs, 2H, NH_2), 4,00 (s, 3H, COOCH_3).

3. Preparación de 6-amino-5-cloro-2-(2-metil-1,3-benzoxazol-5-il)pirimidin-4-carboxilato de metilo (Ejemplo N° 30.014)

A una solución de 0,3 (1,13 mmol) 6-amino-2-bromo-5-cloropirimidin-4-carboxilato de metilo en 20 ml de dioxano se añaden 0,024 g (0,03 mmol) de $(\text{PPh}_3)_2\text{PdCl}_2$ y se agita esta mezcla 30 min a TA. Después se añaden 0,29 g (1,13 mmol) de 2-metil-5-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1,3-benzoxazol, 0,47 g (3,4 mmol) de K_2CO_3 y 2 g (111 mmol) de H_2O y a continuación se agita la mezcla durante 6 h a reflujo. Se deja reposar la mezcla de reacción durante otras 12 h a TA y después se vierte sobre 40 ml de H_2O . Esta mezcla se extrae varias veces con CH_2Cl_2 , y se seca la fase orgánica combinada sobre Na_2SO_4 y a continuación se concentra. La purificación cromatográfica en gel de sílice con heptano/etiléster de ácido acético(3/7) como eluyente da 0,06 g (17 %) de producto. RMN de ^1H (CDCl_3): δ 8,65 (d, 1H, benzoxazol), 8,40 (dd, 1H, benzoxazol), 7,50 (d, 1H, benzoxazol), 5,55 (bs, 2H, NH_2), 4,05 (s, 3H, COOCH_3) 2,70 (s, 3H, $-\text{CH}_3$).

En la siguiente tabla se indican a los efectos de la caracterización los datos de RMN de varios compuestos de acuerdo con la invención.

Ej. N°	RMN de ^1H δ (ppm)
1.012	CDCl_3 : 8,40d, 1H; 7,83d, 1H; 7,65, 1H; 7,53d, 1H; 7,12s, 1H; 4,80bs, 2H, NH_2 ; 4,05s, 3H, COOMe
1.038	CDCl_3 : 8,40d, 1H; 7,62d, 1H; 7,57d, 1H; 7,20s, 1H; 6,70d, 1H; 4,80bs, 2H, NH_2 ; 4,00s, 3H, COOMe
2.012	CDCl_3 : 8,40d, 1H; 7,92d, 1H; 7,88dd, 1H; 7,46d, 1H; 7,39d, 1H; 7,18s, 1H; 4,8bs, NH_2 ; 4,02s, 3H, COOMe
2.038	CDCl_3 : 8,40d, 1H; 7,60d, 1H; 7,40d, 1H; 7,35d, 1H; 7,25s, 1H; 4,85bs, 2H, NH_2 ; 4,00s, 3H, COOMe
8.007	$\text{DMSO}-d_6$: 8,45d, 2H; 8,20m, 1H; 7,80s, 1H; 7,70m, 3H; 7,40m; 1H
8.013	CDCl_3 : 8,30s, 1H; 8,13s, 1H; 8,05d, 2H; 7,62d, 1H; 7,13s, 1H; 4,82bs, NH_2 ; 4,0s, 3H, COOMe
8.014	CDCl_3 : 8,10s, 1H; 7,90d, 1H; 7,50d, 1H; 7,10s, 1H; 4,70bs, 2H, NH_2 ; 4,00s, 3H, COOMe; 2,65s, 3H, CH_3
8.019	CDCl_3 : 8,30m, 2H; 8,15m, 1H; 7,59m, 4H; 7,18m, 1H; 4,95bs, 2H, NH_2 ; 4,05s, 3H, COOMe
8.039	CDCl_3 : 7,85s, 1H; 7,70d, 1H; 7,30d, 1H; 7,10s, 1H; 4,95bs, 2H, NH_2 ; 4,80bs, 2H, NH_2 ; 4,00s, 3H, COOMe
9.013	CDCl_3 : 9,00s, 1H; 8,60s, 1H; 8,12d, 1H; 8,00d, 1H; 7,20s, 1H; 4,85bs, 2H, NH_2 ; 4,00s, 3H, COOMe
9.014	CDCl_3 : 8,40s, 1H; 8,00d, 1H; 7,85d, 1H; 7,18s, 1H; 4,80bs, 2H, NH_2 ; 4,00s, 3H, COOMe
10.013	CDCl_3 : 8,25s, 1H; 8,15s, 1H; 8,92d, 1H; 8,82d, 1H; 7,18s, 1H; 4,80bs, 2H, NH_2 ; 4,00s, 3H, COOMe
10.014	CDCl_3 : 8,10s, 1H; 7,82d, 1H; 7,68d, 1H; 7,14s, 1H; 4,80bs, 2H, NH_2 ; 4,00s, 3H, COOMe; 2,68s, 3H, CH_3
10.019	CDCl_3 : 8,30m, 2H; 8,00dd, 1H; 7,60d, 1H; 7,57m, 3H; 7,30s, 1H; 4,85bs, 2H, NH_2 ; 4,00s 3H, COOMe
10.023	CDCl_3 : 8,30m, 2H; 7,73d, 1H; 7,67s, 1H; 7,60m, 3H; 7,14s, 1H; 4,90bs, 2H, NH_2 ; 4,00s, 3H, COOMe
11.014	CDCl_3 : 8,50s, 1H; 7,98d, 1H; 7,90d, 1H; 7,15s, 1H; 4,85bs, 2H, NH_2 ; 4,00s, 3H, COOMe; 2,85s, 3H, CH_3
14.061	CDCl_3 : 8,20s, 1H; 7,80d, 1H; 7,65d, 1H; 7,60d, 1H; 7,15s, 1H; 6,78d, 1H; 4,80bs, 2H, NH_2 ; 4,02s, 3H, COOMe
14.081	CDCl_3 : 7,85dd, 1H; 7,70d, 2H; 7,40d, 2H; 7,30s, 1H; 6,70d, 1H; 4,80bs, 2H, NH_2 ; 4,00s, 3H, COOMe
15.061	CDCl_3 : 8,50s, 1H; 7,89d, 1H; 7,85d, 1H; 7,50d, 1H; 7,35d, 1H; 7,20s, 1H; 4,80bs, 2H, NH_2 ; 4,03s, 3H, COOMe
16.064	CDCl_3 : 8,10s, 1H; 8,00bs, 1H, NH ; 7,60m, 2H; 7,20s, 1H; 7,00s, 1H; 4,70bs, 2H, NH_2 ; 4,00s, 3H, COOMe; 2,35s, 3H, CH_3
16.073	CDCl_3 : 8,10bs, 1H, NH ; 7,95s, 1H; 7,50m, 2H; 7,10s, 1H; 6,20s, 1H; 4,75bs, 2H; NH_2 ; 4,00s, 3H, COOMe; 2,45s, 3H, CH_3
24.012	CDCl_3 : 8,84s, 1H; 8,35d, 1H; 7,93d, 1H; 7,48d, 1H; 7,42d, 1H; 5,60bs, 2H, NH_2 ; 4,00s, 3H; COOMe
30.014	CDCl_3 : 8,65s, 1H; 8,40d, 1H; 7,50d, 1H; 5,60bs, 2H, NH_2 ; 4,05s, 3H, COOMe; 2,70s, 3H, CH_3
31.013	CDCl_3 : 9,15s, 1H; 9,05s, 1H; 8,50d, 1H; 8,00d, 1H; 5,60bs, 2H, NH_2 ; 4,05s, 3H, COOMe
32.013	CDCl_3 : 8,60s, 1H; 8,45d, 1H; 8,18s, 1H; 7,70d, 1H; 5,60bs, 2H, NH_2 ; 4,05s, 3H, COOMe
33.014	CDCl_3 : 8,85s, 1H; 8,45d, 1H; 7,95d, 1H; 5,60bs, 2H, NH_2 ; 4,00s, 3H; COOMe; 2,85s, 3H, CH_3
38.061	CDCl_3 : 8,48s, 1H; 8,30bs, NH ; 8,15d, 1H; 7,70d, 1H; 7,30d, 1H; 6,60d, 1H; 5,50bs, 2H, NH_2 ; 4,00s, 3H, COOMe

B. Ejemplos de formulación

1. Productos para espolvorear

Se obtiene un producto para espolvorear al mezclar 10 partes en peso de un compuesto de la fórmula general (I) y 90 partes en peso de talco como sustancia inerte y se tritura en un molino a martillos.

5 2. Polvo dispersable

Se obtiene un polvo humectable de fácil dispersión en agua, al mezclar 25 partes en peso de un compuesto de la fórmula general (I), 64 partes en peso de cuarzo con contenido de caolín como sustancia inerte, 10 partes en peso de ligninsulfonato de potasio y 1 parte en peso de oleoilmetiltaurina de sodio como agente humectante y de dispersión y se muele la mezcla en un molino de clavijas.

10 3. Concentrado dispersable

Se obtiene un concentrado de fácil dispersión en agua, al mezclar 20 partes en peso de un compuesto de la fórmula general (I) con 6 partes en peso de alquilfenolpoliglicoléter (®Triton X 207), 3 partes en peso de isotridecanolpoliglicoléter (8 EO) y 71 partes en peso de aceite mineral parafrínico (rango de ebullición p. ej. aprox. 255 hasta más de 277 °C) y se muele la mezcla en un molino de bolas a una fineza menor que 5 micrones.

15 4. Concentrado emulsionable

Se obtiene un concentrado emulsionable con 15 partes en peso de un compuesto de la fórmula general (I), 75 partes en peso de ciclohexanona como disolvente y 10 partes en peso de nonilfenol oxetilado como emulsionante.

5. Granulado dispersable en agua

Se obtiene un granulado dispersable en agua al mezclar 75 partes en peso de un compuesto de la fórmula general (I),

20 10" partes en peso de ligninsulfonato de calcio,

5" partes en peso de laurilsulfato de sodio,

3" partes en peso de alcohol polivinílico y

7" partes en peso de caolinita,

25 se muele la mezcla en un molino a clavijas y se granula el polvo en un lecho fluidizado por medio de rociado con agua como líquido de granulación.

También se obtienen granulados dispersables en agua por homogenización y pretritución en un molino coloidal de 25 partes en peso de un compuesto de la fórmula general (I),

5" partes en peso de 2,2'-dinaftilmetan-6,6'-disulfonato de sodio

2" partes en peso de oleoilmetiltaurina de sodio,

30 1" parte en peso de alcohol polivinílico,

17" partes en peso de carbonato de calcio y

50" partes en peso de agua

después se muele la mezcla en un molino de bolas, se pulveriza y se seca la suspensión resultante en una torre de pulverizado por medio de una tobera monosustancia.

35 **C. Ejemplos biológicos**

1. Acción herbicida contra plantas nocivas en la pre-emergencia

Se colocan las semillas o bien porciones de rizomas de plantas nocivas monocotiledóneas o dicotiledóneas en macetas de 9 a 13 cm de diámetro en arcilla arenosa y se cubren con tierra. Los herbicidas formulados como concentrados emulsionantes o polvos se aplican entonces en varias dosis como dispersiones o suspensiones acuosas o bien como emulsiones con una cantidad de aplicación de 300 a 800 l de agua (convertido) sobre la superficie de la tierra cubridora. A continuación, las macetas se colocan para el posterior cultivo de las plantas en un invernadero y se mantienen en

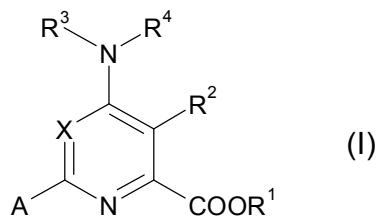
buenas condiciones. Al cabo de 3 a 4 semanas de permanencia de las plantas de prueba en el invernadero en condiciones óptimas de crecimiento se determinó el efecto de los compuestos de acuerdo con la invención mediante evaluación a simple vista. Se pudo observar por ejemplo que los compuestos N° 1.012, 1.038, 14.061 y 15.061 con una cantidad de aplicación de 320 g/ha muestran respectivamente una efectividad de al menos 90 % contra *Echinochloa crus galli*, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus*, *Matricaria inodora*, *Stellaria media* y *Veronica persica*.

2. Acción herbicida contra plantas nocivas en la post-emergencia

Se colocan las semillas de plantas nocivas monocotiledóneas o dicotiledóneas en macetas de cartón en arcilla arenosa, se cubren con tierra y se cultivan en el invernadero en buenas condiciones de crecimiento. Después de 2 a 3 semanas después de la siembra se trata a las plantas cuando habían desarrollado tres hojas. Los compuestos de acuerdo con la invención formulados en forma de polvos rociables o como concentrados de emulsión se pulverizan sobre la superficie de las partes verdes de las plantas cantidad de aplicación de 600 a 800 l de agua (convertido). Después de 3 a 4 semanas de permanencia de las plantas de ensayo en el invernadero en condiciones óptimas de crecimiento se evalúa a simple vista el efecto de los compuestos de acuerdo con la invención. Se pudo observar por ejemplo que los compuestos N° 1.012, 14.061 y 15.061 con una cantidad de aplicación de 80 g/ha muestran respectivamente una efectividad de al menos el 90 % contra *Echinochloa crus galli*, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus*, y *Matricaria inodora*.

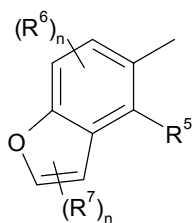
REVINDICACIONES

1. Compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos o sus sales

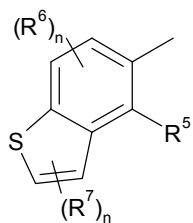


en la que

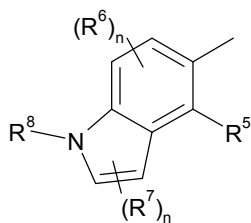
5 A significa un resto del grupo que se compone de A1 a A20,



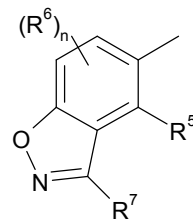
A1



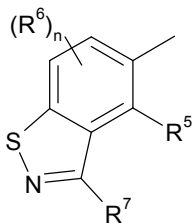
A2



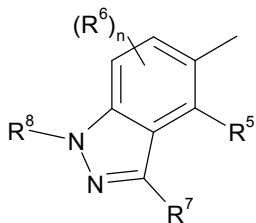
A3



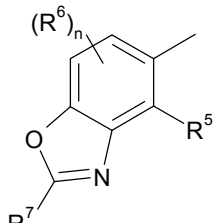
A4



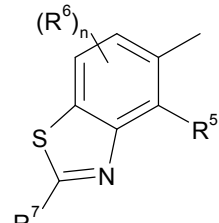
A5



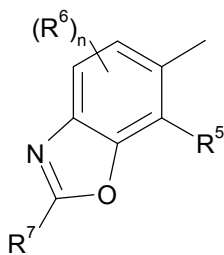
A6



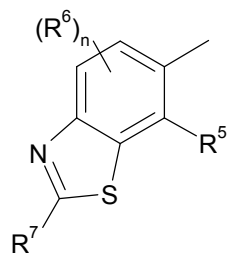
A7



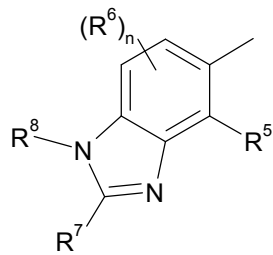
A8



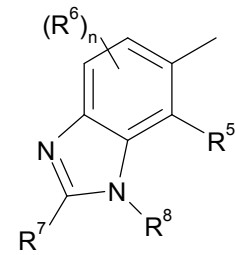
A9



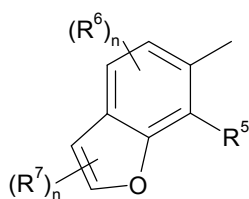
A10



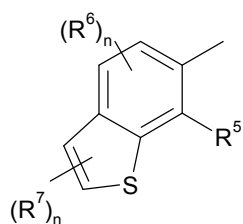
A11



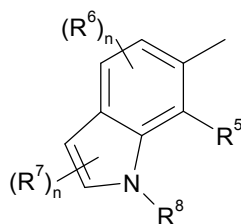
A12



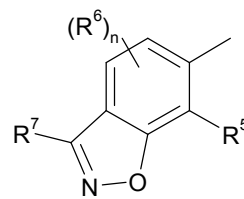
A13



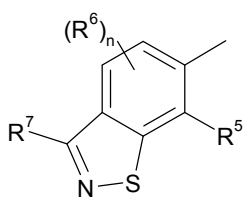
A14



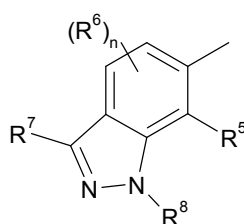
A15



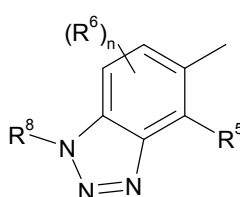
A16



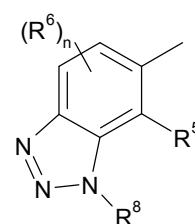
A17



A18



A19



A20

R¹ significa hidrógeno o alquilo (C₁-C₄),

R² significa cloro,

R³ significa hidrógeno,

R⁴ significa hidrógeno,

R⁵ significa hidrógeno, halógeno, OH, NH₂, CN, alquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), alquilamino (C₁-C₃) o ciclopropilo,

R⁶ significa hidrógeno, halógeno, OH, NH₂, CN, alquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), ciclopropilo o vinilo,

R⁷ significa hidrógeno, halógeno, alquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), alquiltio (C₁-C₃), ciclopropilo, alquilamino (C₁-C₃) o fenilo,

R⁸ significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₃), fenilo o alquilcarbonilo (C₁-C₃),

X significa N, CH, CCl, CF o CBr,

n significa 0, 1 ó 2.

2. Agentes herbicidas, caracterizados por una cantidad de acción herbicida de al menos un compuesto de la fórmula (I) según la reivindicación 1.

3. Agentes herbicidas de conformidad con la reivindicación 2, mezclados con adyuvantes de formulación.

4. Agentes herbicidas de conformidad con las reivindicaciones 2 o 3, que contienen al menos un principio activo de acción pesticida adicional del grupo de los insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, protectores selectivos y reguladores del crecimiento.

5. Agentes herbicidas, de conformidad con la reivindicación 4, que contienen un protector selectivo.

6. Agentes herbicidas de conformidad con la reivindicación 5, que contienen un herbicida adicional.

7. Procedimiento para combatir plantas no deseadas, caracterizado porque se aplica una cantidad efectiva de al menos un compuesto de la fórmula (I) según la reivindicación 1, o de un agente herbicida según una cualquiera de las reivindicaciones 2 a 6, sobre las plantas o sobre el lugar del crecimiento no deseado de plantas.

8. Uso de compuestos de la fórmula (I) como los que se reclaman en la reivindicación 1, o de un agente herbicida según cualquiera de las reivindicaciones 2 a 6, para combatir plantas no deseadas.

9. Uso según la reivindicación 8, caracterizado porque los compuestos de la fórmula (I) se usan para combatir plantas

no deseadas en cultivos de plantas útiles.

10. Uso según la reivindicación 9, caracterizado porque las plantas útiles son plantas útiles transgénicas.