

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 584 930**

51 Int. Cl.:

**A61K 31/00** (2006.01)

**A61K 31/519** (2006.01)

**A61P 33/00** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **11.12.2008 E 08864594 (0)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **22.06.2016 EP 2237774**

54 Título: **El uso de compuestos de 6-halógeno-(1,2,4)-triazolo-(1,5-a)-pirimidina para combatir plagas en y sobre animales**

30 Prioridad:

**21.12.2007 US 16091 P**

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

**30.09.2016**

73 Titular/es:

**MERIAL LIMITED (100.0%)  
3239 Satellite Blvd.  
Duluth, GA 30096, US**

72 Inventor/es:

**BAUMANN, ERNST;  
POHLMAN, MATTHIAS;  
CLARK, JEFFREY NORMAN;  
POWELL, KERRIE MARIA;  
BOECKH, ALBERT y  
SOLL, MARK DAVID**

74 Agente/Representante:

**PONTI SALES, Adelaida**

**ES 2 584 930 T3**

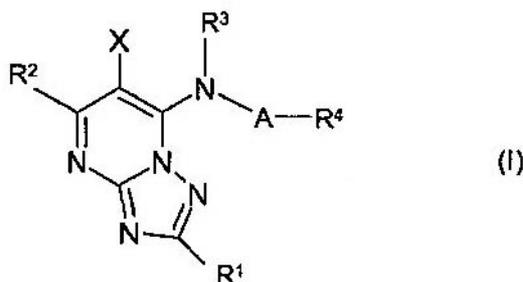
Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar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

## DESCRIPCIÓN

El uso de compuestos de 6-halógeno-(1,2,4)-triazolo-(1,5-a)-pirimidina para combatir plagas en y sobre animales

## 5 CAMPO DE LA INVENCIÓN

**[0001]** La presente invención se refiere a compuestos de 6-halógeno-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pirimidina de la fórmula general I



10

en la que

X es halógeno;

15

R<sup>1</sup> está seleccionado de hidrógeno, halógeno, OH, CN, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-amino, di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)amino, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>, fenilo, fenoxi, benciloxi, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>, alquinoxil C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub> o alquinoxil C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>, en el que alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfinilo y alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfonilo pueden estar sin sustituir o parcialmente o completamente sustituidos con halógeno y/o pueden llevar un grupo seleccionado de alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-carbonilo o COOH;

20

R<sup>2</sup> está seleccionado de hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub> o alquinoxil C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>;

25

R<sup>3</sup> está seleccionado de hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-carbonilo, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-carbonilo o arilcarbonilo;

A es un enlace sencillo o una cadena de alqueno C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> que puede comprender un heteroátomo de enlace seleccionado de oxígeno o azufre;

30

R<sup>4</sup> está seleccionado de cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, fenilo, naftilo, heterociclilo de 3 a 7 miembros, que está sin sustituir o que lleva 1, 2 o 3 radicales que están seleccionados, independientemente entre sí, del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, hidroxil, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, amino, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-amino, di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)amino, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfonilo, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, fenilo, fenil-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y feniloxil, en el que los cinco últimos radicales mencionados por su parte pueden estar sin sustituir o pueden llevar uno, dos o tres sustituyentes que están seleccionados, independientemente entre sí, del grupo que consiste en alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y halógeno, y en el que el heterociclilo de 3 a 7 miembros contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados, independientemente entre sí, del grupo que consiste en oxígeno, azufre, nitrógeno y un grupo NR<sup>3</sup>, siendo también posible que cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, fenilo y heterociclilo de 3 a 7 miembros estén fusionados con un anillo carbocíclico de 5 a 7 miembros saturado, insaturado o aromático o con un anillo heterocíclico de 5 a 7 miembros y dicho anillo condensado puede estar sin sustituir o puede él mismo llevar uno, dos, tres, cuatro, cinco o seis sustituyentes que están seleccionados, independientemente entre sí, del grupo que consiste en halógeno y alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; en el que R<sup>a</sup> es hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> o alquinoxil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

35

40

45

y/o un enantiómero, diaestereómero, tautómero, solvato, forma cristalina o sal veterinariamente aceptable del mismo solo o en combinación con un agente parasiticida adicional para su uso en el tratamiento, control, prevención o

protección contra la infestación o infección por parásitos, en el que el compuesto es para administración oral, tópica o parenteral a un animal.

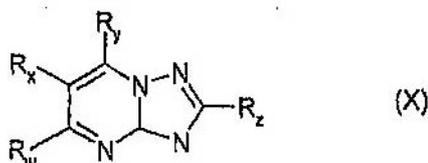
#### ANTECEDENTES DE LA INVENCION

5

**[0002]** Es generalmente un objetivo de los agronomistas y veterinarios poseer medios suficientes para controlar y combatir los parásitos cuando pretenden invadir o atacar animales.

**[0003]** Los documentos DD 55 956, DD 99 794 y FR 1567021 describen [1,2,4]-triazolo[1,5-a]pirimidinas de la fórmula general (X) que tienen una actividad farmacéutica

10



en la que  $R_w$ ,  $R_z$  pueden ser hidrógeno, alquilo inferior, alcoxilalquilo, halógeno, arilo o arilalquilo,  $R_x$  puede ser hidrógeno, halógeno, alquilo inferior, alquenilo inferior, arilalquilo o arilo y  $R_y$  pueden ser un grupo amino opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes están seleccionados, entre otros, de alquilo, cicloalquilo, alquenilo, hidroxilalquilo, alquilaminoalquilo, alcoxilalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo o heteroalquilo. El documento WO 03/039259 describe compuestos de 1,2,4-triazolo[1,5-a]pirimidina sustituidos que tienen actividad fungicida. La actividad insecticida y acaricida en la protección de cultivos de algunos de los compuestos de fórmula I se ha descrito en el documento WO 2005/025315 (publicación de patente de EE.UU. 2006/264446).

20

**[0004]** La actividad de los compuestos contra plagas agrícolas no sugiere su idoneidad para el control de endo- y ectoparásitos en y sobre animales que requieren, por ejemplo, bajas dosificaciones no eméticas en el caso de administración oral, compatibilidad metabólica con el animal, baja toxicidad, y una manipulación segura.

25

**[0005]** Hasta la fecha, no se han descrito 6-halógeno-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]pirimidinas para su uso en o sobre animales.

**[0006]** Sorprendentemente, ahora se ha encontrado que los compuestos de fórmula I son adecuados para combatir endo- y ectoparásitos en y sobre animales.

30

#### RESUMEN DE LA INVENCION

**[0007]** Es un objetivo de la presente invención proporcionar compuestos para su uso en el tratamiento, control, prevención o protección contra la infestación o infección por parásitos en el que el compuesto es para administración oral, tópica o parenteral a un animal.

35

**[0008]** Otro objetivo de la invención es proporcionar pesticidas más seguros para animales.

**[0009]** Otro objetivo de la invención es proporcionar pesticidas para animales que puedan usarse en dosis más bajas que los pesticidas existentes.

40

**[0010]** Otro objetivo de la invención es proporcionar pesticidas para animales que proporcionan un largo control residual de los parásitos.

45

**[0011]** Estos objetivos se cumplen por completo o en parte por la presente invención.

**[0012]** La invención también proporciona un compuesto de fórmula I solo o en combinación con un agente parasiticida adicional o una composición que comprende un compuesto de fórmula I solo o en combinación con un agente parasiticida adicional para su uso en el tratamiento, control, prevención y protección de animales contra la infección por parásitos, en el que el compuesto es para administración oral, tópica o parenteral o administración a un animal.

50

**[0013]** La descripción también proporciona un proceso para la preparación de una composición para tratar, controlar, prevenir o proteger animales contra la infestación o infección por parásitos que comprende una cantidad parasiticidamente eficaz de un compuesto de fórmula I solo o en combinación con un agente parasiticida adicional o una composición que comprende un compuesto de fórmula I solo o en combinación con un agente parasiticida adicional.

**[0014]** La descripción también proporciona procedimientos de eliminación de parásitos de vertebrados que incluyen endo- y ecto-parásitos. Dependiendo de los pares huésped-parásito, un procedimiento según la descripción pueden encargarse de un aspecto terapéutico, cuando pretende prevenir o tratar parasitosis que son patógenas en su naturaleza o sus efectos inducidos, o un procedimiento puede ser sin ningún fin terapéutico, cuando el tratamiento consiste en combatir parásitos que producen efectos no patológicos en sus huéspedes, tales como signos de molestia o un aspecto antiestético.

**[0015]** La descripción también proporciona composiciones que hacen posible la implementación de estos procedimientos  
La invención también proporciona compuestos para su uso en nuevos procedimientos para combatir parásitos que hacen posible eliminar muchos ectoparásitos de vertebrados, en particular de mamíferos.

**[0016]** La invención también proporciona compuestos para su uso en un procedimiento que, por una única administración, hace posible eliminar endo- o ecto-parásitos con una eficacia extremadamente alta durante un largo periodo de tiempo.

#### DESCRIPCIÓN DETALLADA DE LA INVENCION

25 Compuestos parasiticidas

**[0017]** En los sustituyentes, los compuestos parasiticidas usados en la invención pueden tener para una constitución dada diferente disposición espacial de los átomos, por ejemplo, pueden llevar uno o más centros de quiralidad, en cuyo caso están presentes como mezclas de estereoisómeros, tales como enantiómeros o diaestereómeros. La presente invención proporciona tanto los estereoisómeros puros, por ejemplo, los enantiómeros o diaestereómeros puros, como mezclas de los mismos.

**[0018]** También están englobados por la invención los tautómeros, solvatos y estructuras cristalinas de los compuestos parasiticidas. Las estructuras cristalinas también incluyen formas polimórficas de los compuestos parasiticidas.

**[0019]** Sales de los compuestos parasiticidas que son adecuadas para el uso según la invención son especialmente sales veterinariamente aceptables. Pueden formarse en un procedimiento habitual, por ejemplo tratando el compuesto con un ácido del anión en cuestión.

**[0020]** Sales veterinariamente útiles adecuadas son las sales de aquellos cationes y/o aniones, respectivamente, que no tienen ningún efecto adverso sobre la acción de los compuestos según la presente invención, que son útiles para combatir parásitos perjudiciales. Así, cationes adecuados incluyen los iones de los metales alcalinos, tales como litio, sodio y potasio, de los metales alcalinotérreos, tales como calcio, magnesio y bario, y de los metales de transición, tales como manganeso, cobre, cinc y hierro, y también el ión amonio que, si se desea, puede llevar uno a cuatro sustituyentes alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y/o un sustituyente fenilo o bencilo (ejemplos de iones amonio incluyen, pero no se limitan a, diisopropilamonio, tetrametilamonio, tetrabutilamonio, trimetilbencilamonio), iones fosfonio, iones sulfonio (que incluyen, pero no se limitan a, tri(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)sulfonio), e iones sulfoxonio (que incluyen, pero no se limitan a, tri(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)sulfoxonio).

**[0021]** Aniones adecuados incluyen cloruro, bromuro, fluoruro, hidrogenosulfato, sulfato, dihidrogenofosfato, hidrogenofosfato, fosfato, nitrato, hidrogenocarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato y los aniones de los ácidos alcanóicos C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, tales como formiato, acetato, propionato y butirato. Pueden formarse tratando los compuestos de fórmula I con un ácido del anión correspondiente, tal como ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.

**[0022]** En la definición de fórmula I mostrada anteriormente, los sustituyentes tienen los siguientes significados:

Los restos orgánicos mencionados en las definiciones anteriores de las variables son, al igual que el término

halógeno, términos colectivos para el listado individual de miembros de grupos individuales. El prefijo C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub> indica en cada caso el posible número de átomos de carbono en el grupo.

**[0023]** El término halógeno indica en cada caso flúor, bromo, cloro o yodo. En una realización de la invención, el 5 halógeno es flúor o cloro.

**[0024]** Ejemplos de otros significados son:

El término "alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>", como se usa en el presente documento, y los restos alquilo de alquilamino y dialquilamino 10 se refieren a un grupo de hidrocarburo saturado de cadena lineal o ramificado seleccionado de los intervalos que consiste en tener 1 a 10 átomos de carbono, 1 a 6 átomos de carbono y 1 a 4 grupos carbono, respectivamente. Ejemplos de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> incluyen metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-

15 dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo, 1-etil-2-metilpropilo, heptilo, octilo, 2-etilhexilo, nonilo y decilo y sus isómeros. Alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> significa, por ejemplo, metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo o 1,1-dimetiletilo.

20 **[0025]** El término "cadena de alquileo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> que puede comprender un heteroátomo seleccionado del grupo que consiste en oxígeno y azufre", como se usa en el presente documento, se refiere a, por ejemplo, metanodiilo, etano-1,1-diilo, etano-1,2-diilo, propano-1,1-diilo, propano-1,2-diilo, propano-1,3-diilo, propano-2,2-diilo, butano-1,1-diilo, butano-1,2-diilo, butano-1,3-diilo, butano-1,4-diilo, 2-metilpropano-1,3-diilo, 2-metilpropano-1,2-diilo, 2-metilpropano-1,1-diilo, 1-metilpropano-1,2-diilo, 1-metilpropano-2,2-diilo, 1-metilpropano-1,1-diilo, pentano-1,1-diilo, pentano-1,2-

25 diilo, pentano-1,3-diilo, pentano-1,5-diilo, pentano-2,3-diilo, pentano-2,2-diilo, 1-metilbutano-1,1-diilo, 1-metilbutano-1,2-diilo, 1-metilbutano-1,3-diilo, 1-metilbutano-1,4-diilo, 2-metilbutano-1,1-diilo, 2-metilbutano-1,2-diilo, 2-metilbutano-1,3-diilo, 2-metilbutano-1,4-diilo, 2,2-dimetilpropano-1,1-diilo, 2,2-dimetilpropano-1,3-diilo, 1,1-dimetilpropano-1,3-diilo, 1,1-dimetilpropano-1,2-diilo, 2,3-dimetilpropano-1,3-diilo, 2,3-dimetilpropano-1,2-diilo, 1,3-dimetilpropano-1,3-diilo, hexano-1,1-diilo, hexano-1,2-diilo, hexano-1,3-diilo, hexano-1,4-diilo, hexano-1,5-diilo, hexano-1,6-diilo, hexano-2,5-diilo, 2-metilpentano-1,1-diilo, 1-metilpentano-1,2-diilo, 1-metilpentano-1,3-diilo, 1-metilpentano-1,4-diilo, 1-metilpentano-1,5-diilo, 2-metilpentano-1,1-diilo, 2-metilpentano-1,2-diilo, 2-metilpentano-1,3-diilo, 2-metilpentano-1,4-diilo, 2-metilpentano-1,5-diilo, 3-metilpentano-1,1-diilo, 3-metilpentano-1,2-diilo, 3-metilpentano-1,3-diilo, 3-metilpentano-1,4-diilo, 3-metilpentano-1,5-diilo, 1,1-dimetilbutano-1,2-diilo, 1,1-dimetilbutano-1,3-diilo, 1,1-dimetilbutano-1,4-diilo, 1,2-dimetilbutano-1,1-diilo, 1,2-dimetilbutano-1,2-diilo, 1,2-

35 dimetilbutano-1,3-diilo, 1,2-dimetilbutano-1,4-diilo, 1,3-dimetilbutano-1,1-diilo, 1,3-dimetilbutano-1,2-diilo, 1,3-dimetilbutano-1,3-diilo, 1,3-dimetilbutano-1,4-diilo, 1-etilbutano-1,1-diilo, 1-etilbutano-1,2-diilo, 1-etilbutano-1,3-diilo, 1-etilbutano-1,4-diilo, 2-etilbutano-1,1-diilo, 2-etilbutano-1,2-diilo, 2-etilbutano-1,3-diilo, 2-etilbutano-1,4-diilo, 2-etilbutano-2,3-diilo, 2,2-dimetilbutano-1,1-diilo, 2,2-dimetilbutano-1,3-diilo, 2,2-dimetilbutano-1,4-diilo, 1-isopropilpropano-1,1-diilo, 1-isopropilpropano-1,2-diilo, 1-isopropilpropano-1,3-diilo, 2-isopropilpropano-1,1-diilo, 2-

40 isopropilpropano-1,2-diilo, 2-isopropilpropano-1,3-diilo, 1,2,3-trimetilpropano-1,1-diilo, 1,2,3-trimetilpropano-1,2-diilo o 1,2,3-trimetilpropano-1,3-diilo.

**[0026]** Si el grupo alquileo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> comprende un heteroátomo, el heteroátomo puede disponerse en la cadena de alquileo en cualquier posición o en el extremo de la cadena de manera que conecte la cadena de alquileo con el 45 radical R<sup>4</sup>. En una realización de la invención, el heteroátomo no está dispuesto en el extremo de la cadena de alquileo. En otra realización de la invención, el heteroátomo es oxígeno.

**[0027]** El término "haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>", como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena lineal o ramificado que tiene 1 a 10 átomos de carbono (como se ha mencionado 50 anteriormente), en el que algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden sustituirse con átomos de halógeno como se ha mencionado anteriormente, por ejemplo, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, tal como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo 55 y similares.

**[0028]** El término "fluoroalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>", como se usa en el presente documento, se refiere a un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> que lleva 1, 2, 3, 4 o 5 átomos de flúor, por ejemplo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,1,2,2-tetrafluoroetilo o pentafluoroetilo.

- [0029]** El término, "alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>", como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena lineal o ramificado que tiene 1 a 10 átomos de carbono (como se ha mencionado anteriormente) que está unido mediante un átomo de oxígeno. Ejemplos incluyen alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> tal como metoxi, etoxi, OCH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, OCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, n-butoxi, OCH(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, OCH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, OC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, n-pentoxi, 1-metilbutoxi, 2-metilbutoxi, 3-metilbutoxi, 1,1-dimetilpropoxi, 1,2-dimetilpropoxi, 2,2-dimetilpropoxi, 1-etilpropoxi, n-hexoxi, 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, 1-etil-2-metilpropoxi y similares.
- [0030]** El término "haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>", como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> como se ha mencionado anteriormente que está parcialmente o completamente sustituido con flúor, cloro, bromo y/o yodo, es decir, por ejemplo, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> tal como clorometoxi, diclorometoxi, triclorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi, 2-bromoetoxi, 2-yodoetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, pentafluoroetoxi, 2-fluoropropoxi, 3-fluoropropoxi, 2,2-difluoropropoxi, 2,3-difluoropropoxi, 2-cloropropoxi, 3-cloropropoxi, 2,3-dicloropropoxi, 2-bromopropoxi, 3-bromopropoxi, 3,3,3-trifluoropropoxi, 3,3,3-tricloropropoxi, 2,2,3,3,3-pentafluoropropoxi, heptafluoropropoxi, 1-(fluorometil)-2-fluoroetoxi, 1-(clorometil)-2-cloroetoxi, 1-(bromometil)-2-bromoetoxi, 4-fluorobutoxi, 4-clorobutoxi, 4-bromobutoxi, nonafluorobutoxi, 5-fluoro-1-pentoxi, 5-cloro-1-pentoxi, 5-bromo-1-pentoxi, 5-yodo-1-pentoxi, 5,5,5-tricloro-1-pentoxi, undecafluoropentoxi, 6-fluoro-1-hexoxi, 6-cloro-1-hexoxi, 6-bromo-1-hexoxi, 6-yodo-1-hexoxi, 6,6,6-tricloro-1-hexoxi o dodecafluorohexoxi. En una realización de la invención, "haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>" está seleccionado del grupo que consiste en clorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi y 2,2,2-trifluoroetoxi.
- [0031]** El término "alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>", como se usa en el presente documento, se refiere a alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> que está sustituido con alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> como se ha mencionado anteriormente, es decir, por ejemplo, CH<sub>2</sub>-OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>-OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, n-propoximetilo, CH<sub>2</sub>-OCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, n-butoximetilo, (1-metilpropoxi)metilo, (2-metilpropoxi)metilo, CH<sub>2</sub>-OC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, 2-(metoxi)etilo, 2-(etoxi)etilo, 2-(n-propoxi)etilo, 2-(1-metiletoxi)etilo, 2-(n-butoxi)etilo, 2-(1-metilpropoxi)etilo, 2-(2-metilpropoxi)etilo, 2-(1,1-dimetiletoxi)etilo, 2-(metoxi)propilo, 2-(etoxi)propilo, 2-(n-propoxi)propilo, 2-(1-metiletoxi)propilo, 2-(n-butoxi)propilo, 2-(1-metilpropoxi)propilo, 2-(2-metilpropoxi)propilo, 2-(1,1-dimetiletoxi)propilo, 3-(metoxi)propilo, 3-(etoxi)propilo, 3-(n-propoxi)propilo, 3-(1-metiletoxi)propilo, 3-(n-butoxi)propilo, 3-(1-metilpropoxi)propilo, 3-(2-metilpropoxi)propilo, 3-(1,1-dimetiletoxi)propilo, 2-(metoxi)butilo, 2-(etoxi)butilo, 2-(n-propoxi)butilo, 2-(1-metiletoxi)butilo, 2-(n-butoxi)butilo, 2-(1-metilpropoxi)butilo, 2-(2-metilpropoxi)butilo, 2-(1,1-dimetiletoxi)butilo, 3-(metoxi)butilo, 3-(etoxi)butilo, 3-(n-propoxi)butilo, 3-(1-metiletoxi)butilo, 3-(n-butoxi)butilo, 3-(1-metilpropoxi)butilo, 3-(2-metilpropoxi)butilo, 3-(1,1-dimetiletoxi)butilo, 4-(metoxi)butilo, 4-(etoxi)butilo, 4-(n-propoxi)butilo, 4-(1-metiletoxi)butilo, 4-(n-butoxi)butilo, 4-(1-metilpropoxi)butilo, 4-(2-metilpropoxi)butilo, 4-(1,1-dimetiletoxi)butilo y similares.
- [0032]** El término "alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>", como se usa en el presente documento, se refiere a alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> que está sustituido con alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> como se ha mencionado anteriormente, es decir, por ejemplo, OCH<sub>2</sub>-OCH<sub>3</sub>, OCH<sub>2</sub>-OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, n-propoximetoxi, OCH<sub>2</sub>-OCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, n-butoximetoxi, (1-metilpropoxi)metoxi, (2-metilpropoxi)metoxi, CH<sub>2</sub>-OC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, 2-(metoxi)etoxi, 2-(etoxi)etoxi, 2-(n-propoxi)etoxi, 2-(1-metiletoxi)etoxi, 2-(n-butoxi)etoxi, 2-(1-metilpropoxi)etoxi, 2-(2-metilpropoxi)etoxi, 2-(1,1-dimetiletoxi)etoxi, 2-(metoxi)propoxi, 2-(etoxi)propoxi, 2-(n-propoxi)propoxi, 2-(1-metiletoxi)propoxi, 2-(n-butoxi)propoxi, 2-(1-metilpropoxi)propoxi, 2-(2-metilpropoxi)propoxi, 2-(1,1-dimetiletoxi)propoxi, 3-(metoxi)propoxi, 3-(etoxi)propoxi, 3-(n-propoxi)propoxi, 3-(1-metiletoxi)propoxi, 3-(n-butoxi)propoxi, 3-(1-metilpropoxi)propoxi, 3-(2-metilpropoxi)propoxi, 3-(1,1-dimetiletoxi)propoxi, 2-(metoxi)butoxi, 2-(etoxi)butoxi, 2-(n-propoxi)butoxi, 2-(1-metiletoxi)butoxi, 2-(n-butoxi)butoxi, 2-(1-metilpropoxi)butoxi, 2-(2-metilpropoxi)butoxi, 2-(1,1-dimetiletoxi)butoxi, 3-(metoxi)butoxi, 3-(etoxi)butoxi, 3-(n-propoxi)butoxi, 3-(1-metiletoxi)butoxi, 3-(n-butoxi)butoxi, 3-(1-metilpropoxi)butoxi, 3-(2-metilpropoxi)butoxi, 3-(1,1-dimetiletoxi)butoxi, 4-(metoxi)butoxi, 4-(etoxi)butoxi, 4-(n-propoxi)butoxi, 4-(1-metiletoxi)butoxi, 4-(n-butoxi)butoxi, 4-(1-metilpropoxi)butoxi, 4-(2-metilpropoxi)butoxi, 4-(1,1-dimetiletoxi)butoxi y similares.
- [0033]** El término "alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>", como se usa en el presente documento, se refiere a alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que está sustituido con alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> como se ha mencionado anteriormente, es decir, por ejemplo, 2-(2-metoxietiloxi)etiloxi, 2-(2-etoxietiloxi)etiloxi.
- [0034]** El término "alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-carbonilo", como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena lineal o ramificado que tiene 1 a 10 átomos de carbono (como se ha mencionado anteriormente) unido mediante el átomo de carbono del grupo carbonilo en cualquier enlace en el grupo alquilo. Ejemplos incluyen

alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-carbonilo tal como CO-CH<sub>3</sub>, CO-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, n-propilcarbonilo, 1-metiletilcarbonilo, n-butylcarbonilo, 1-metilpropilcarbonilo, 2-metilpropilcarbonilo, 1,1-dimetiletilcarbonilo, n-pentilcarbonilo, 1-metilbutylcarbonilo, 2-metilbutylcarbonilo, 3-metilbutylcarbonilo, 1,1-dimetilpropilcarbonilo, 1,2-dimetilpropilcarbonilo, 2,2-dimetilpropilcarbonilo, 1-etilpropilcarbonilo, n-hexilcarbonilo, 1-metilpentilcarbonilo, 2-metilpentilcarbonilo, 3-metilpentilcarbonilo, 4-metilpentilcarbonilo, 1,1-dimetilbutylcarbonilo, 1,2-dimetilbutylcarbonilo, 1,3-dimetilbutylcarbonilo, 2,2-dimetilbutylcarbonilo, 2,3-dimetilbutylcarbonilo, 3,3-dimetilbutylcarbonilo, 1-etilbutylcarbonilo, 2-etilbutylcarbonilo, 1,1,2-trimetilpropilcarbonilo, 1,2,2-trimetilpropilcarbonilo, 1-etil-1-metilpropilcarbonilo o 1-etil-2-metilpropilcarbonilo y similares.

10 **[0035]** El término “alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-carbonilo”, como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alcoxi de cadena lineal o ramificado (como se ha mencionado anteriormente) que tiene 1 a 10 átomos de carbono unido mediante el átomo de carbono del grupo carbonilo. Ejemplos incluyen (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, por ejemplo CO-OCH<sub>3</sub>, CO-OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, COO-CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, CO-OCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, n-butoxicarbonilo, CO-OCH(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, CO-OCH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CO-OC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, n-pentoxicarbonilo, 1-metilbutoxicarbonilo, 2-metilbutoxicarbonilo, 3-metilbutoxicarbonilo, 2,2-dimetilpropoxicarbonilo, 1-etilpropoxicarbonilo, n-hexoxicarbonilo, 1,1-dimetilpropoxicarbonilo, 1,2-dimetilpropoxicarbonilo, 1-metilpentoxicarbonilo, 2-metilpentoxicarbonilo, 3-metilpentoxicarbonilo, 4-metilpentoxicarbonilo, 1,1-dimetilbutoxicarbonilo, 1,2-dimetilbutoxicarbonilo, 1,3-dimetilbutoxicarbonilo, 2,2-dimetilbutoxicarbonilo, 2,3-dimetilbutoxicarbonilo, 3,3-dimetilbutoxicarbonilo, 1-etilbutoxicarbonilo, 2-etilbutoxicarbonilo, 1,1,2-trimetilpropoxicarbonilo, 1,2,2-trimetilpropoxicarbonilo, 1-etil-1-metilpropoxicarbonilo o 1-etil-2-metilpropoxicarbonilo.

15 **[0036]** El término “alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfanilo: alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-S-),” como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena lineal o ramificado que tiene 1 a 10 átomos de carbono (como se ha mencionado anteriormente) que está unido mediante un átomo de azufre, por ejemplo, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tal como metiltio, etiltio, propiltio, 1-metileltio, butiltio, 1-metilpropiltio, 2-metilpropiltio o 1,1-dimetileltio.

20 **[0037]** El término “alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfínilo” (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-S(=O)-), como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo de hidrocarburo saturado de cadena lineal o ramificado (como se ha mencionado anteriormente) que tiene 1 a 10 átomos de carbono unido mediante el átomo de azufre del grupo sulfínilo en cualquier enlace en el grupo alquilo. Ejemplos incluyen alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfínilo: SO-CH<sub>3</sub>, SO-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, n-propilsulfínilo, 1-metiletilsulfínilo, n-butilsulfínilo, 1-metilpropilsulfínilo, 2-metilpropilsulfínilo, 1,1-dimetiletilsulfínilo, n-pentilsulfínilo, 1-metilbutilsulfínilo, 2-metilbutilsulfínilo, 3-metilbutilsulfínilo, 1,1-dimetilpropilsulfínilo, 1,2-dimetilpropilsulfínilo, 2,2-dimetilpropilsulfínilo, 1-etilpropilsulfínilo, n-hexilsulfínilo, 1-metilpentilsulfínilo, 2-metilpentilsulfínilo, 3-metilpentilsulfínilo, 4-metilpentilsulfínilo, 1,1-dimetilbutilsulfínilo, 1,2-dimetilbutilsulfínilo, 1,3-dimetilbutilsulfínilo, 2,2-dimetilbutilsulfínilo, 2,3-dimetilbutilsulfínilo, 3,3-dimetilbutilsulfínilo, 1-etilbutilsulfínilo, 2-etilbutilsulfínilo, 1,1,2-trimetilpropilsulfínilo, 1,2,2-trimetilpropilsulfínilo, 1-etil-1-metilpropilsulfínilo o 1-etil-2-metilpropilsulfínilo.

30 **[0038]** El término “alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfonilo” (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-S(=O)<sub>2</sub>-), como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena lineal o ramificado que tiene 1 a 10 átomos de carbono (como se ha mencionado anteriormente) que está unido mediante el átomo de azufre del grupo sulfonilo en cualquier enlace en el grupo alquilo. Ejemplos incluyen alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfonilo tal como SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, n-propilsulfonilo, SO<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, n-butilsulfonilo, 1-metilpropilsulfonilo, 2-metilpropilsulfonilo, SO<sub>2</sub>-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, n-pentilsulfonilo, 1-metilbutilsulfonilo, 2-metilbutilsulfonilo, 3-metilbutilsulfonilo, 1,1-dimetilpropilsulfonilo, 1,2-dimetilpropilsulfonilo, 2,2-dimetilpropilsulfonilo, 1-etilpropilsulfonilo, n-hexilsulfonilo, 1-metilpentilsulfonilo, 2-metilpentilsulfonilo, 3-metilpentilsulfonilo, 4-metilpentilsulfonilo, 1,1-dimetilbutilsulfonilo, 1,2-dimetilbutilsulfonilo, 1,3-dimetilbutilsulfonilo, 2,2-dimetilbutilsulfonilo, 2,3-dimetilbutilsulfonilo, 3,3-dimetilbutilsulfonilo, 1-etilbutilsulfonilo, 2-etilbutilsulfonilo, 1,1,2-trimetilpropilsulfonilo, 1,2,2-trimetilpropilsulfonilo, 1-etil-1-metilpropilsulfonilo o 1-etil-2-metilpropilsulfonilo y similares.

40 **[0039]** El término “alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>”, como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo de hidrocarburo insaturado de cadena lineal o ramificado que tiene 2 a 10 átomos de carbono y un doble enlace en cualquier posición, tal como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metil-etenilo, 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-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-

dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo y 1-etil-2-metil-2-propenilo.

5

**[0040]** El término “alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>”, como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo de hidrocarburo insaturado de cadena lineal o ramificado que tiene 2 a 10 átomos de carbono y que contiene al menos un triple enlace, tal como etinilo, prop-1-in-1-ilo, prop-2-in-1-ilo, n-but-1-in-1-ilo, n-but-1-in-3-ilo, n-but-1-in-4-ilo, n-but-2-in-1-ilo, n-pent-1-in-1-ilo, n-pent-1-in-3-ilo, n-pent-1-in-4-ilo, n-pent-1-in-5-ilo, n-pent-2-in-1-ilo, n-pent-2-in-4-ilo, n-pent-2-in-5-ilo, 3-metilbut-1-in-3-ilo, 3-metilbut-1-in-4-ilo, n-hex-1-in-1-ilo, n-hex-1-in-3-ilo, n-hex-1-in-4-ilo, n-hex-1-in-5-ilo, n-hex-1-in-6-ilo, n-hex-2-in-1-ilo, n-hex-2-in-4-ilo, n-hex-2-in-5-ilo, n-hex-2-in-6-ilo, n-hex-3-in-1-ilo, n-hex-3-in-2-ilo, 3-metilpent-1-in-1-ilo, 3-metilpent-1-in-3-ilo, 3-metilpent-1-in-4-ilo, 3-metilpent-1-in-5-ilo, 4-metilpent-1-in-1-ilo, 4-metilpent-2-in-4-ilo o 4-metilpent-2-in-5-ilo y similares.

10

15 **[0041]** El término “cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>”, como se usa en el presente documento, se refiere a un radical de hidrocarburo monocíclico que tiene 3 a 10 átomos de carbono, en particular 3 a 8 átomos de carbono, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, ciclononilo o ciclodecilo.

**[0042]** El término “cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>”, como se usa en el presente documento, se refiere a un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que lleva un radical cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> como se ha definido anteriormente, por ejemplo, ciclopropilmetilo, 1-ciclopropiletilo, 2-ciclopropiletilo, 1-ciclopropilprop-1-ilo, 2-ciclopropilprop-1-ilo, 3-ciclopropilprop-1-ilo, 1-ciclopropilbut-1-ilo, 2-ciclopropilbut-1-ilo, 3-ciclopropilbut-1-ilo, 4-ciclopropilbut-1-ilo, 1-ciclopropilbut-2-ilo, 2-ciclopropilbut-2-ilo, 3-ciclopropilbut-2-ilo, 3-ciclopropilbut-2-ilo, 4-ciclopropilbut-2-ilo, 1-(ciclopropilmetil)-et-1-ilo, 1-(ciclopropilmetil)-1-(metil)-et-1-ilo, 1-(ciclopropilmetil)-prop-1-ilo, ciclobutilmetilo, 1-ciclobutiletilo, 2-ciclobutiletilo, 1-ciclobutilprop-1-ilo, 2-ciclobutilprop-1-ilo, 3-ciclobutilprop-1-ilo, 1-ciclobutilbut-1-ilo, 2-ciclobutilbut-1-ilo, 3-ciclobutilbut-1-ilo, 4-ciclobutilbut-1-ilo, 1-ciclobutilbut-2-ilo, 2-ciclobutilbut-2-ilo, 3-ciclobutilbut-2-ilo, 3-ciclobutilbut-2-ilo, 4-ciclobutilbut-2-ilo, 1-(ciclobutilmetil)-et-1-ilo, 1-(ciclobutilmetil)-1-(metil)-et-1-ilo, 1-(ciclobutilmetil)prop-1-ilo, ciclopentilmetilo, 1-ciclopentiletilo, 2-ciclopentiletilo, 1-ciclopentilprop-1-ilo, 2-ciclopentilprop-1-ilo, 3-ciclopentilprop-1-ilo, 1-ciclopentilbut-1-ilo, 2-ciclopentilbut-1-ilo, 3-ciclopentilbut-1-ilo, 4-ciclopentilbut-1-ilo, 1-ciclopentilbut-2-ilo, 2-ciclopentilbut-2-ilo, 3-ciclopentilbut-2-ilo, 3-ciclopentilbut-2-ilo, 4-ciclopentilbut-2-ilo, 1-(ciclopentilmetil)-et-1-ilo, 1-(ciclopentilmetil)-1-(metil)-et-1-ilo, 1-(ciclopentilmetil)-prop-1-ilo, ciclohexilmetilo, 1-ciclohexiletilo, 2-ciclohexiletilo, 1-ciclohexilprop-1-ilo, 2-ciclohexilprop-1-ilo, 3-ciclohexilprop-1-ilo, 1-ciclohexilbut-1-ilo, 2-ciclohexilbut-1-ilo, 3-ciclohexilbut-1-ilo, 4-ciclohexilbut-1-ilo, 1-ciclohexilbut-2-ilo, 2-ciclohexilbut-2-ilo, 3-ciclohexilbut-2-ilo, 3-ciclohexilbut-2-ilo, 4-ciclohexilbut-2-ilo, 1-(ciclohexilmetil)-et-1-ilo, 1-(ciclohexilmetil)-1-(metil)-et-1-ilo, 1-(ciclohexilmetil)prop-1-ilo, 1-(ciclohexilmetil)prop-1-ilo, cicloheptilmetilo, 1-cicloheptiletilo, 2-cicloheptiletilo, 1-cicloheptilprop-1-ilo, 2-cicloheptilprop-1-ilo, 3-cicloheptilprop-1-ilo, 1-cicloheptilbut-1-ilo, 2-cicloheptilbut-1-ilo, 3-cicloheptilbut-1-ilo, 4-cicloheptilbut-1-ilo, 1-cicloheptilbut-2-ilo, 2-cicloheptilbut-2-ilo, 3-cicloheptilbut-2-ilo, 3-cicloheptilbut-2-ilo, 4-cicloheptilbut-2-ilo, 1-(cicloheptilmetil)-et-1-ilo, 1-(cicloheptilmetil)-1-(metil)-et-1-ilo, 1-(cicloheptilmetil)-prop-1-ilo, ciclooctilmetilo, 1-ciclooctiletilo, 2-ciclooctiletilo, 1-ciclooctilprop-1-ilo, 2-ciclooctilprop-1-ilo, 3-ciclooctilprop-1-ilo, 1-ciclooctilbut-1-ilo, 2-ciclooctilbut-1-ilo, 3-ciclooctilbut-1-ilo, 4-ciclooctilbut-1-ilo, 1-ciclooctilbut-2-ilo, 2-ciclooctilbut-2-ilo, 3-ciclooctilbut-2-ilo, 3-ciclooctilbut-2-ilo, 4-ciclooctilbut-2-ilo, 1-(ciclooctilmetil)-et-1-ilo, 1-(ciclooctilmetil)-1-(metil)-et-1-ilo o 1-(ciclooctilmetil)-prop-1-ilo.

25

30

35

**[0043]** El término “fenil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>”, como se usa en el presente documento, se refiere a alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que está sustituido con fenilo, que puede por su parte estar sin sustituir o lleva uno, dos o tres sustituyentes, tales como bencilo, 1-feniletilo, 2-feniletilo, 1-fenilprop-1-ilo, 2-fenilprop-1-ilo, 3-fenilprop-1-ilo, 1-fenilbut-1-ilo, 2-fenilbut-1-ilo, 3-fenilbut-1-ilo, 4-fenilbut-1-ilo, 1-fenilbut-2-ilo, 2-fenilbut-2-ilo, 3-fenilbut-2-ilo, 4-fenilbut-2-ilo, 1-(bencil)et-1-ilo, 1-(bencil)-1-(metil)et-1-ilo o 1-(bencil)-prop-1-ilo. En una realización de la invención, “fenil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>” está seleccionado del grupo que consiste en bencilo, 1-feniletilo, 2-feniletilo, (R)-1-feniletilo y (S)-1-feniletilo.

45

50 **[0044]** El término “heterociclilo”, como se usa en el presente documento, se refiere a un radical heterocíclico de 3 a 7 miembros que tiene 3, 4, 5, 6 o 7 miembros de anillo, en el que 1, 2, 3 o 4 de estos miembros de anillo son heteroátomos seleccionados, independientemente entre sí, del grupo que consiste en oxígeno, nitrógeno, azufre y un grupo NR<sup>5</sup>, en el que R<sup>5</sup> tiene los significados que se definen en R<sup>3</sup> anteriormente. El heterociclo puede ser un heterociclo unido a carbono o puede unirse mediante un heteroátomo. El heterociclo puede ser aromático (heteroarilo) o estar parcialmente o completamente saturado.

55

**[0045]** Además, el radical heterociclilo puede condensarse con un anillo carbocíclico de 5 a 7 miembros saturado, insaturado o aromático o con un anillo heterocíclico de 5 a 7 miembros que puede llevar por su parte uno, dos, tres, cuatro, cinco o seis sustituyentes que están seleccionados, independientemente entre sí, del grupo que consiste en

halógeno tal como flúor, cloro, bromo y alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tal como metilo.

**[0046]** Ejemplos de anillos heteroaromáticos monocíclicos incluyen triazinilo, pirazinilo, pirimidilo, piridazinilo, piridilo, tienilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, tetrazolilo, tiazolilo, oxazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo, isotiazolilo o isoxazolilo.

**[0047]** Ejemplos de anillos no aromáticos incluyen pirrolidinilo, pirazolinilo, imidazolinilo, pirrolinilo, pirazolinilo, imidazolinilo, tetrahidrofuranilo, dihidrofuranilo, 1,3-dioxolanilo, dioxolenilo, tiolanilo, dihidrotiofenilo, oxazolidinilo, isoxazolidinilo, oxazolinilo, isoxazolinilo, tiazolinilo, isotiazolinilo, tiazolidinilo, isotiazolidinilo, oxatiolanilo, piperidinilo, piperazinilo, piranilo, dihidropiranilo, tetrahidropiranilo, dioxanilo, tiopiranilo, dihidrotiopiranilo, tetrahidrotiopiranilo, morfolinilo, tiazinilo y similares.

**[0048]** El término "condensado con un anillo carbocíclico de 5 a 7 miembros saturado, insaturado o aromático o con un anillo heterocíclico de 5 a 7 miembros", como se usa en el presente documento, se refiere a un radical cíclico que lleva un carbociclo C<sub>5</sub>-C<sub>7</sub> saturado condensado como se ha definido anteriormente, un carbociclo C<sub>5</sub>-C<sub>7</sub> mono- o diinsaturado o fenilo o a un anillo heterocíclico de 5-7 miembros como se ha definido anteriormente.

**[0049]** Ejemplos de cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> condensado con un anillo carbocíclico de 5 a 7 miembros saturado, insaturado o aromático son indan-1-ilo, indan-2-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-2-ilo, decalin-1-ilo, decalin-2-ilo o hidrindanilo y similares.

**[0050]** Ejemplos de fenilo condensado con un anillo carbocíclico de 5 a 7 miembros saturado, insaturado o aromático o con un anillo heterocíclico de 5 a 7 miembros son indan-5-ilo, indan-6-ilo, dihidronaftalen-5-ilo, dihidronaftalen-6-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-5-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-6-ilo, quinolinilo, isoquinolinilo, indolilo, indolizínilo, isoindolilo, indazolilo, benzofurilo, benzotienilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, 1,3-benzodioxolilo, 1,4-benzodioxanilo, bencimidazolilo, dihidroindolilo, dihidroindolizínilo, dihidroisoindolilo, dihidroquinolinilo, dihidroisoquinolinilo, cromenilo, cromanilo y similares.

**[0051]** Ejemplos de heterocíclico de 3 a 7 miembros que llevan un anillo carbocíclico de 5 a 7 miembros saturado, insaturado o aromático condensado o un anillo heterocíclico de 5 a 7 miembros son quinolinilo, isoquinolinilo, indolilo, indolizínilo, isoindolilo, indazolilo, benzofurilo, benzotienilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, 1,3-benzodioxolilo, 1,4-benzodioxanilo, bencimidazolilo, dihidroindolilo, dihidroindolizínilo, dihidroisoindolilo, dihidroquinolinilo, dihidroisoquinolinilo, cromenilo, cromanilo y similares.

**[0052]** Realizaciones de los compuestos de 6-halógeno-[1,2,4]-triazolo-[1,5a]-pirimidina usados en la invención

**[0053]** Se da una realización de la invención para los compuestos para su uso, en los que los sustituyentes tienen el siguiente significado:

en el que en los compuestos de fórmula I, A es un enlace sencillo.

en el que en los compuestos de fórmula I, A es una cadena de alquileo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>. En una realización de la invención, la cadena de alquileo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> está seleccionada de CH<sub>2</sub>, C<sub>2</sub>H<sub>4</sub>, CH(CH<sub>3</sub>) y CH(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>).

en el que en los compuestos de fórmula I, el radical R<sup>4</sup> está seleccionado de fenilo, fenil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, en el que cada grupo fenilo y cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> puede estar sin sustituir o puede llevar uno o dos sustituyentes como se ha definido anteriormente.

En una realización para el radical R<sup>4</sup>, el radical es cis-ciclohexilo cuando hay un sustituyente en la posición 4 del ciclohexilo, que puede llevar uno o dos sustituyentes adicionales como se ha definido anteriormente.

En otra realización para el radical R<sup>4</sup>, el radical es ciclohexilo, que lleva un sustituyente en la posición 4 tal como alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

En otra realización más para el radical R<sup>4</sup>, el radical es 1-feniletilo, que es un enantiómero S.

En otra realización adicional para el radical R<sup>4</sup>, el radical es 1-feniletilo, que lleva un sustituyente en la posición 4 del fenilo, en el que el sustituyente está seleccionado del grupo que consiste en halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

**[0060]** En una realización para el radical R<sup>1</sup>, el radical está seleccionado de hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfino y alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonilo. En otra realización para el radical R<sup>1</sup>, el radical es hidrógeno.

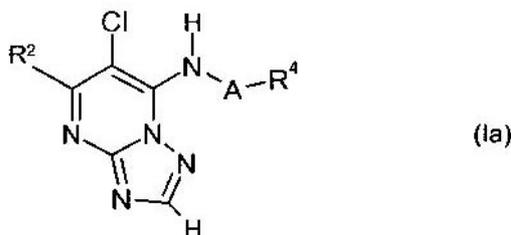
5

**[0061]** En una realización para el radical R<sup>2</sup>, el radical está seleccionado de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>. En otra realización para el radical R<sup>2</sup>, el radical está seleccionado de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> y fluoroalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>.

10 **[0062]** En una realización para el radical R<sup>3</sup>, el radical está seleccionado de hidrógeno o alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>. En otra realización para el radical R<sup>3</sup>, el radical es hidrógeno.

**[0063]** En una realización de la invención, el radical X en los compuestos de fórmula I es cloro.

15 **[0064]** En otra realización de la invención, los compuestos de la invención son los compuestos de 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidina de fórmula I, en la que X es Cl y R<sup>1</sup> y R<sup>3</sup> son H (como se muestra en fórmula Ia), y en la que R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> tienen los significados dados en la Tabla A.



20

TABLA A

N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup> -A
A-1.	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -ciclohexil-
A-2.	CH <sub>3</sub>	cis-4-CH <sub>3</sub> -ciclohexil-
A-3.	CH <sub>3</sub>	trans-4-CH <sub>3</sub> -ciclohexil-
A-4.	CH <sub>3</sub>	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -ciclohexil-
A-5.	CH <sub>3</sub>	cis-4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -ciclohexil-
A-6.	CH <sub>3</sub>	trans-4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -ciclohexil-
A-7.	CH <sub>3</sub>	4-n-propil-ciclohexil-
A-8.	CH <sub>3</sub>	cis-4-n-propil-ciclohexil-
A-9.	CH <sub>3</sub>	trans-4-n-propil-ciclohexil-
A-10.	CH <sub>3</sub>	4-isopropil-ciclohexil-
A-11.	CH <sub>3</sub>	cis-4-isopropil-ciclohexil-
A-12.	CH <sub>3</sub>	trans-4-isopropil-ciclohexil-
A-13.	CH <sub>3</sub>	4-n-butilciclohexil-
A-14.	CH <sub>3</sub>	cis-4-n-butilciclohexil-
A-15.	CH <sub>3</sub>	trans-4-n-butilciclohexil-
A-16.	CH <sub>3</sub>	4-terc-butilciclohexil-
A-17.	CH <sub>3</sub>	cis-4-terc-butilciclohexil-
A-18.	CH <sub>3</sub>	trans-4-terc-butilciclohexil-
A-19.	CH <sub>3</sub>	4-(2-butil)ciclohexil-
A-20.	CH <sub>3</sub>	cis-4-(2-butil)ciclohexil-
A-21.	CH <sub>3</sub>	trans-4-(2-butil)ciclohexil-
A-22.	CH <sub>3</sub>	4-(ciclohexil-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-ciclohexil-
A-23.	CH <sub>3</sub>	cis-4-(ciclohexil-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-ciclohexil-
A-24.	CH <sub>3</sub>	trans-4-(ciclohexil-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-ciclohexil-
A-25.	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -
A-26.	CH <sub>3</sub>	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -

N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup> -A
A-27.	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -
A-28.	CH <sub>3</sub>	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -
A-29.	CH <sub>3</sub>	4-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -
A-30.	CH <sub>3</sub>	4-fenoxifenil
A-31.	CH <sub>3</sub>	bencilo
A-32.	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-33.	CH <sub>3</sub>	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-34.	CH <sub>3</sub>	4-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-35.	CH <sub>3</sub>	4-isopropil-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-36.	CH <sub>3</sub>	4-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-37.	CH <sub>3</sub>	4-isobutil-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-38.	CH <sub>3</sub>	4-terc-buil-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-39.	CH <sub>3</sub>	4-F <sub>3</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-40.	CH <sub>3</sub>	4-metoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-41.	CH <sub>3</sub>	4-etoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-42.	CH <sub>3</sub>	4-n-propoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-43.	CH <sub>3</sub>	4-isopropoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-44.	CH <sub>3</sub>	4-n-butoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-45.	CH <sub>3</sub>	4-terc-butoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-46.	CH <sub>3</sub>	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-47.	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-48.	CH <sub>3</sub>	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-49.	CH <sub>3</sub>	3,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -
A-50.	CH <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -
A-51.	CH <sub>3</sub>	3,4-Br <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -
A-52.	CH <sub>3</sub>	4-(4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-53.	CH <sub>3</sub>	4-(4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-54.	CH <sub>3</sub>	4-(4-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-55.	CH <sub>3</sub>	4-(4-iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-56.	CH <sub>3</sub>	4-(4-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-57.	CH <sub>3</sub>	4-(4-iso-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-58.	CH <sub>3</sub>	4-(4-terc-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-59.	CH <sub>3</sub>	4-(4-H <sub>3</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-60.	CH <sub>3</sub>	4-(4-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-61.	CH <sub>3</sub>	4-(4-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-62.	CH <sub>3</sub>	4-(4-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-63.	CH <sub>3</sub>	4-(4-terc-butoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-64.	CH <sub>3</sub>	4-(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-65.	CH <sub>3</sub>	4-(4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-66.	CH <sub>3</sub>	4-(3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-67.	CH <sub>3</sub>	4-(3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-68.	CH <sub>3</sub>	4-(3-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-69.	CH <sub>3</sub>	4-(3-iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-70.	CH <sub>3</sub>	4-(3-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-71.	CH <sub>3</sub>	4-(3-iso-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-72.	CH <sub>3</sub>	4-(3-terc-butil-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-73.	CH <sub>3</sub>	4-(3-H <sub>3</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-74.	CH <sub>3</sub>	4-(3-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-75.	CH <sub>3</sub>	4-(3-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-76.	CH <sub>3</sub>	4-(3-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-77.	CH <sub>3</sub>	4-(3-terc-butoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-78.	CH <sub>3</sub>	4-(3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-79.	CH <sub>3</sub>	4-(3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-80.	CH <sub>3</sub>	4-(3-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-81.	CH <sub>3</sub>	4-(2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -

N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup> -A
A-82.	CH <sub>3</sub>	4-(2-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-83.	CH <sub>3</sub>	4-(2-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-84.	CH <sub>3</sub>	4-(2-iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-85.	CH <sub>3</sub>	4-(2-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-86.	CH <sub>3</sub>	4-(2-iso-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-87.	CH <sub>3</sub>	4-(2-terc-butil-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-88.	CH <sub>3</sub>	4-(2-H <sub>3</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-89.	CH <sub>3</sub>	4-(2-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-90.	CH <sub>3</sub>	4-(2-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-91.	CH <sub>3</sub>	4-(2-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-92.	CH <sub>3</sub>	4-(2-terc-butoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-93.	CH <sub>3</sub>	4-(2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-94.	CH <sub>3</sub>	4-(2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-95.	CH <sub>3</sub>	4-(2-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-96.	CH <sub>3</sub>	4-(3,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-97.	CH <sub>3</sub>	4-(3,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-98.	CH <sub>3</sub>	4-(3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-99.	CH <sub>3</sub>	4-(3-F-4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-100.	CH <sub>3</sub>	4-(3-Cl-4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-101.	CH <sub>3</sub>	4-(3-CH <sub>3</sub> -4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-102.	CH <sub>3</sub>	4-(3-Cl-4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-103.	CH <sub>3</sub>	4-(3-Cl-4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-104.	CH <sub>3</sub>	4-(3-CH <sub>3</sub> -4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-105.	CH <sub>3</sub>	(±) fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-106.	CH <sub>3</sub>	(R) fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-107.	CH <sub>3</sub>	(S) fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-108.	CH <sub>3</sub>	(±) 4-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-109.	CH <sub>3</sub>	(R) 4-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-110.	CH <sub>3</sub>	(S) 4-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-111.	CH <sub>3</sub>	(±) 4-Cl-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-112.	CH <sub>3</sub>	(R) 4-Cl-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-113.	CH <sub>3</sub>	(S) 4-Cl-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-114.	CH <sub>3</sub>	(±) 4-Br-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-115.	CH <sub>3</sub>	(R) 4-Br-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-116.	CH <sub>3</sub>	(S) 4-Br-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-117.	CH <sub>3</sub>	(±) 4-Cl-2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-118.	CH <sub>3</sub>	(R) 4-Cl-2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-119.	CH <sub>3</sub>	(S) 4-Cl-2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-120.	CH <sub>3</sub>	(±) 6-Cl-2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-121.	CH <sub>3</sub>	(R) 6-Cl-2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-122.	CH <sub>3</sub>	(S) 6-Cl-2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-123.	CH <sub>3</sub>	(±) 2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-124.	CH <sub>3</sub>	(R) 2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-125.	CH <sub>3</sub>	(S) 2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-126.	CH <sub>3</sub>	(S) 2,4-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-127.	CH <sub>3</sub>	(±) 2,4-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-128.	CH <sub>3</sub>	(R) 2,4-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-129.	CH <sub>3</sub>	(S) 2,5-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-130.	CH <sub>3</sub>	(±) 2,5-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-131.	CH <sub>3</sub>	(R) 2,5-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-132.	CH <sub>3</sub>	(S) 2,6-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-133.	CH <sub>3</sub>	(±) 2,6-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-134.	CH <sub>3</sub>	(R) 2,6-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-135.	CH <sub>3</sub>	(±) 2-CH <sub>3</sub> O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-136.	CH <sub>3</sub>	(R) 2-CH <sub>3</sub> O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-

N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup> -A
A-137.	CH <sub>3</sub>	(S) 2-CH <sub>3</sub> O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-138.	CH <sub>3</sub>	(±) 4-CH <sub>3</sub> O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-139.	CH <sub>3</sub>	(R) 4-CH <sub>3</sub> O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-140.	CH <sub>3</sub>	(S) 4-CH <sub>3</sub> O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-141.	CH <sub>3</sub>	(±) 4-H <sub>5</sub> C <sub>2</sub> -O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-142.	CH <sub>3</sub>	(R) 4-H <sub>5</sub> C <sub>2</sub> -O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-143.	CH <sub>3</sub>	(S) 4-H <sub>5</sub> C <sub>2</sub> -O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-144.	CH <sub>3</sub>	(±) 4-n-propoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-145.	CH <sub>3</sub>	(R) 4-n-propoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-146.	CH <sub>3</sub>	(S) 4-n-propoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-147.	CH <sub>3</sub>	(±) 4-n-butoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-148.	CH <sub>3</sub>	(R) 4-n-butoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-149.	CH <sub>3</sub>	(S) 4-n-butoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-150.	CH <sub>3</sub>	(±) 4-terc-butoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-151.	CH <sub>3</sub>	(R) 4-terc-butoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-152.	CH <sub>3</sub>	(S) 4-terc-butoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-153.	CH <sub>3</sub>	(±) 4-CH <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-154.	CH <sub>3</sub>	(R) 4-CH <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-155.	CH <sub>3</sub>	(S) 4-CH <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-156.	CH <sub>3</sub>	(±) 4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-157.	CH <sub>3</sub>	(R) 4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-158.	CH <sub>3</sub>	(S) 4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-159.	CH <sub>3</sub>	(±) 4-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-160.	CH <sub>3</sub>	(R) 4-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-161.	CH <sub>3</sub>	(S) 4-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-162.	CH <sub>3</sub>	(±) 4-iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-163.	CH <sub>3</sub>	(R) 4-iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-164.	CH <sub>3</sub>	(S) 4-iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-165.	CH <sub>3</sub>	(±) 4-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-166.	CH <sub>3</sub>	(R) 4-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-167.	CH <sub>3</sub>	(S) 4-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-168.	CH <sub>3</sub>	(±) 4-terc-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-169.	CH <sub>3</sub>	(R) 4-terc-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-170.	CH <sub>3</sub>	(S) 4-terc-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-171.	CH <sub>3</sub>	(±) 4-cicl.-C <sub>6</sub> H <sub>9</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-172.	CH <sub>3</sub>	(R) 4-cicl.-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-173.	CH <sub>3</sub>	(S) 4-cicl.-C <sub>6</sub> H <sub>9</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-174.	CH <sub>3</sub>	(±) 4-OCF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-175.	CH <sub>3</sub>	(R) 4-OCF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-176.	CH <sub>3</sub>	(S) 4-OCF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-177.	CH <sub>3</sub>	(±) 4-CF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-178.	CH <sub>3</sub>	(R) 4-CF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-179.	CH <sub>3</sub>	(S) 4-CF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-180.	CH <sub>3</sub>	(±) 3-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-181.	CH <sub>3</sub>	(R) 3-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-182.	CH <sub>3</sub>	(S) 3-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-183.	CH <sub>3</sub>	(±) 3-Cl-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-184.	CH <sub>3</sub>	(R) 3-Cl-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-185.	CH <sub>3</sub>	(S) 3-Cl-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-186.	CH <sub>3</sub>	(±) 3-Br-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-187.	CH <sub>3</sub>	(R) 3-Br-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-188.	CH <sub>3</sub>	(S) 3-Br-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-189.	CH <sub>3</sub>	(±) 3-CF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-190.	CH <sub>3</sub>	(R) 3-CF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-191.	CH <sub>3</sub>	(S) 3-CF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-

N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup> -A
A-192.	CH <sub>3</sub>	(±) 3,4-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-193.	CH <sub>3</sub>	(R) 3,4-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-194.	CH <sub>3</sub>	(S) 3,4-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-195.	CH <sub>3</sub>	(±) 3,4-Cl <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-196.	CH <sub>3</sub>	(R) 3,4-Cl <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-197.	CH <sub>3</sub>	(S) 3,4-Cl <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-198.	CH <sub>3</sub>	(±) 3,4-Br <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-199.	CH <sub>3</sub>	(R) 3,4-Br <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-200.	CH <sub>3</sub>	(S) 3,4-Br <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-201.	CH <sub>3</sub>	(±) 4-Difluorometoxifenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-202.	CH <sub>3</sub>	(R) 4-Difluorometoxifenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-203.	CH <sub>3</sub>	(S) 4-Difluorometoxifenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-204.	CH <sub>3</sub>	(±) 4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-205.	CH <sub>3</sub>	(R) 4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-206.	CH <sub>3</sub>	(S) 4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-207.	CH <sub>3</sub>	(±) (5,5,7,7-tetrametilindan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-208.	CH <sub>3</sub>	(R) (5,5,7,7-tetrametilindan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-209.	CH <sub>3</sub>	(S) (5,5,7,7-tetrametilindan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-210.	CH <sub>3</sub>	(±) (1,1,4,4,-tetrametil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-211.	CH <sub>3</sub>	(R) (1,1,4,4,-tetrametil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-212.	CH <sub>3</sub>	(S) (1,1,4,4,-tetrametil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-213.	CH <sub>3</sub>	(±) (1,1-dimetil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-214.	CH <sub>3</sub>	(R) (1,1-dimetil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-215.	CH <sub>3</sub>	(S) (1,1-dimetil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-216.	CH <sub>3</sub>	(±) (1,1,4,4,7-pentametil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-217.	CH <sub>3</sub>	(R) (1,1,4,4,7-pentametil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-218.	CH <sub>3</sub>	(S) (1,1,4,4,7-pentametil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-219.	CH <sub>3</sub>	(±) (1,1,7-trimetil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-220.	CH <sub>3</sub>	(R) (1,1,7-trimetil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-221.	CH <sub>3</sub>	(S) (1,1,7-trimetil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-222.	CH <sub>3</sub>	(±) (2-mety)-1,3-dioxan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-223.	CH <sub>3</sub>	(R) 2-metil-1,3-dioxan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-224.	CH <sub>3</sub>	(S) 2-metil-1,3-dioxan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-225.	CH <sub>3</sub>	(±) (2,5,5-trimetil-1,3-dioxan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-226.	CH <sub>3</sub>	(R) 2,5,5-trimetil-1,3-dioxan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-227.	CH <sub>3</sub>	(S) 2,5,5-trimetil-1,3-dioxan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-228.	CH <sub>3</sub>	(±) (2,2-difluorobenzodioxol-5-il)CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-
A-229.	CH <sub>3</sub>	(R) (2,2-difluorobenzodioxol-5-il)CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-
A-230.	CH <sub>3</sub>	(S) (2,2-difluorobenzodioxol-5-il)CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-
A-231.	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-232.	CH <sub>3</sub>	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-233.	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-234.	CH <sub>3</sub>	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-235.	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-236.	CH <sub>3</sub>	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-237.	CH <sub>3</sub>	4-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-238.	CH <sub>3</sub>	4-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-239.	CH <sub>3</sub>	4-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-240.	CH <sub>3</sub>	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-241.	CH <sub>3</sub>	4-H <sub>3</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-242.	CH <sub>3</sub>	4-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-243.	CH <sub>3</sub>	4-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-244.	CH <sub>3</sub>	4-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-245.	CH <sub>3</sub>	4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-246.	CH <sub>3</sub>	4-F <sub>3</sub> CO-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -

N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup> -A
A-247.	CH <sub>3</sub>	4-F <sub>3</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-248.	CH <sub>3</sub>	3-F <sub>3</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-249.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub> -ciclohexil-
A-250.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	cis-4-CH <sub>3</sub> -ciclohexil-
A-251.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	trans-4-CH <sub>3</sub> -ciclohexil-
A-252.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -ciclohexil-
A-253.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	cis-4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -ciclohexil-
A-254.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	trans-4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -ciclohexil-
A-255.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-n-propil-ciclohexil-
A-256.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	cis-4-n-propil-ciclohexil-
A-257.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	trans-4-n-propil-ciclohexil-
A-258.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-isopropil-ciclohexil-
A-259.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	cis-4-isopropil-ciclohexil-
A-260.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	trans-4-isopropil-ciclohexil-
A-261.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-n-butilciclohexil-
A-262.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	cis-4-n-butilciclohexil-
A-263.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	trans-4-n-butilciclohexil-
A-264.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(2-butil)ciclohexil-
A-265.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	cis-4-(2-butil)ciclohexil-
A-266.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	trans-4-(2-butil)ciclohexil-
A-267.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-terc-butilciclohexil-
A-268.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	cis-4-terc-butilciclohexil-
A-269.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	trans-4-terc-butilciclohexil-
A-270.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(ciclohexil-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-ciclohexil-
A-271.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	cis-4-(ciclohexil-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-ciclohexil-
A-272.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	trans-4-(ciclohexil-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-ciclohexil-
A-273.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -
A-274.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -
A-275.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -
A-276.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -
A-277.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -
A-278.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-fenoxifenilo
A-279.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	bencilo
A-280.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-281.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-282.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-283.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-isopropil-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-284.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-285.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-isobutil-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-286.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-terc-butil-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-287.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-F <sub>3</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-288.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-metoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-289.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-etoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-290.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-n-propoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-291.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-isopropoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-292.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-n-butoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-293.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-terc-butoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-294.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-295.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-296.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-297.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	3,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -
A-298.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -
A-299.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	3,4-Br <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -
A-300.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-301.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -

N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup> -A
A-302.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(4-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-303.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(4-iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-304.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(4-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-305.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(4-iso-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-306.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(4-terc-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-307.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(4-H <sub>3</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-308.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(4-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-309.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(4-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-310.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(4-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-311.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(4-terc-butoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-312.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-313.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-314.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-315.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-316.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-317.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3-iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-318.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-319.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3-iso-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-320.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3-terc-butyl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-321.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3-H <sub>3</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-322.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-323.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-324.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-325.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3-terc-butoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-326.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-327.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-328.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-329.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-330.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(2-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-331.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(2-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-332.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(2-iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-333.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(2-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-334.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(2-iso-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-335.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(2-terc-butyl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-336.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(2-H <sub>3</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-337.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(2-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-338.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(2-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-339.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(2-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-340.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(2-terc-butoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-341.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-342.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-343.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(2-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-344.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-345.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-346.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-347.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3-F-4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-348.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3-Cl-4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-349.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3-CH <sub>3</sub> -4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-350.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3-Cl-4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-351.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3-Cl-4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-352.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(3-CH <sub>3</sub> -4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-353.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-354.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-355.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-356.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 4-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-

N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup> -A
A-357.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 4-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-358.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 4-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-359.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 4-Cl-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-360.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 4-Cl-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-361.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 4-Cl-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-362.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 4-Br-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-363.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 4-Br-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-364.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 4-Br-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-365.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 4-Cl-2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-366.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 4-Cl-2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-367.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 4-Cl-2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-368.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 6-Cl-2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-369.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 6-Cl-2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-370.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 6-Cl-2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-371.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-372.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-373.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-374.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 2,4-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-375.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 2,4-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-376.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 2,4-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-377.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 2,5-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-378.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 2,5-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-379.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 2,5-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-380.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 2,6-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-381.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 2,6-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-382.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 2,6-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-383.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 2-CH <sub>3</sub> O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-384.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 2-CH <sub>3</sub> O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-385.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 2-CH <sub>3</sub> O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-386.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 4-CH <sub>3</sub> O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-387.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 4-CH <sub>3</sub> O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-388.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 4-CH <sub>3</sub> O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-389.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 4-H <sub>5</sub> C <sub>2</sub> -O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-390.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 4-H <sub>5</sub> C <sub>2</sub> -O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-391.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 4-H <sub>5</sub> C <sub>2</sub> -O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-392.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 4-n-propoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-393.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 4-n-propoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-394.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 4-n-propoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-395.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 4-n-butoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-396.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 4-n-butoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-397.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 4-n-butoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-398.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 4-terc-butoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-399.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 4-terc-butoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-400.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 4-terc-butoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-401.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 4-CH <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-402.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 4-CH <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-403.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 4-CH <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-404.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-405.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-406.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-407.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 4-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-408.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 4-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-409.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 4-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-410.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 4-iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-411.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 4-iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-

N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup> -A
A-412.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 4-iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-413.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 4-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-414.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 4-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-415.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 4-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-416.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 4-terc-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-417.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 4-terc-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-418.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 4-terc-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-419.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 4-cicl.-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-420.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 4-cicl.-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-421.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 4-cicl.-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-422.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 4-OCF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-423.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 4-OCF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-424.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 4-OCF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-425.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 4-CF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-426.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 4-CF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-427.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 4-CF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-428.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 3-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-429.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 3-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-430.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 3-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-431.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 3-Cl-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-432.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 3-Cl-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-433.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 3-Cl-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-434.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 3-Br-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-435.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 3-Br-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-436.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 3-Br-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-437.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 3-CF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-438.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 3-CF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-439.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 3-CF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-440.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 3,4-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-441.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 3,4-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-442.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 3,4-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-443.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 3,4-Cl <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-444.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 3,4-Cl <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-445.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 3,4-Cl <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-446.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 3,4-Br <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-447.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 3,4-Br <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-448.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 3,4-Br <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-449.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 4-Difluorometoxifenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-450.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 4-Difluorometoxifenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-451.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 4-Difluorometoxifenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-452.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) 4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-453.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-454.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-455.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) (5,5,7,7-tetrametilindan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-456.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) (5,5,7,7-tetrametilindan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-457.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) (5,5,7,7-tetrametilindan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-458.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) (1,1,4,4,-tetrametil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-459.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) (1,1,4,4,-tetrametil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-460.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) (1,1,4,4,-tetrametil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-461.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) (1,1-dimetil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-462.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) (1,1-dimetil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-463.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) (1,1-dimetil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-464.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) (1,1,4,4,7-pentametil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-465.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) (1,1,4,4,7-pentametil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-466.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) (1,1,4,4,7-pentametil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-

N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup> -A
A-467.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) (1,1,7-trimetil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-468.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) (1,1,7-trimetil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-469.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) (1,1,7-trimetil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-470.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) (2-metil-1,3-dioxan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-471.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 2-metil-1,3-dioxan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-472.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 2-metil-1,3-dioxan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-473.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) (2,5,5-trimetil-1,3-dioxan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-474.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) 2,5,5-trimetil-1,3-dioxan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-475.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) 2,5,5-trimetil-1,3-dioxan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-476.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(±) (2,2-difluorobenzodioxol-5-il)CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-
A-477.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(R) (2,2-difluorobenzodioxol-5-il)CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-
A-478.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	(S) (2,2-difluorobenzodioxol-5-il)CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-
A-479.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-480.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-481.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-482.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-483.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-484.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-485.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-486.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-487.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-488.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-489.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-H <sub>3</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-490.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-491.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-492.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-493.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-494.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-F <sub>3</sub> CO-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-495.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	4-F <sub>3</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-496.	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	3-F <sub>3</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-497.	CH <sub>3</sub> CHF	4-CH <sub>3</sub> -ciclohexil-
A-498.	CH <sub>3</sub> CHF	cis-4-CH <sub>3</sub> -ciclohexil-
A-499.	CH <sub>3</sub> CHF	trans-4-CH <sub>3</sub> -ciclohexil-
A-500.	CH <sub>3</sub> CHF	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -ciclohexil-
A-501.	CH <sub>3</sub> CHF	cis-4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -ciclohexil-
A-502.	CH <sub>3</sub> CHF	trans-4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -ciclohexil-
A-503.	CH <sub>3</sub> CHF	4-n-propil-ciclohexil-
A-504.	CH <sub>3</sub> CHF	cis-4-n-propil-ciclohexil-
A-505.	CH <sub>3</sub> CHF	trans-4-n-propil-ciclohexil-
A-506.	CH <sub>3</sub> CHF	4-isopropil-ciclohexil-
A-507.	CH <sub>3</sub> CHF	cis-4-isopropil-ciclohexil-
A-508.	CH <sub>3</sub> CHF	trans-4-isopropil-ciclohexil-
A-509.	CH <sub>3</sub> CHF	4-n-butilciclohexil-
A-510.	CH <sub>3</sub> CHF	cis-4-n-butilciclohexil-
A-511.	CH <sub>3</sub> CHF	trans-4-n-butilciclohexil-
A-512.	CH <sub>3</sub> CHF	4-terc-butilciclohexil-
A-513.	CH <sub>3</sub> CHF	cis-4-terc-butilciclohexil-
A-514.	CH <sub>3</sub> CHF	trans-4-terc-butilciclohexil-
A-515.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(2-butil)ciclohexil-
A-516.	CH <sub>3</sub> CHF	cis-4-(2-butil)ciclohexil-
A-517.	CH <sub>3</sub> CHF	trans-4-(2-butil)ciclohexil-
A-518.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(ciclohexil-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-ciclohexil-
A-519.	CH <sub>3</sub> CHF	cis-4-(ciclohexil-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-ciclohexil-
A-520.	CH <sub>3</sub> CHF	trans-4-(ciclohexil-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-ciclohexil-
A-521.	CH <sub>3</sub> CHF	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -

N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup> -A
A-522.	CH <sub>3</sub> CHF	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -
A-523.	CH <sub>3</sub> CHF	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -
A-524.	CH <sub>3</sub> CHF	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -
A-525.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -
A-526.	CH <sub>3</sub> CHF	4-fenoxifenilo
A-527.	CH <sub>3</sub> CHF	bencilo
A-528.	CH <sub>3</sub> CHF	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-529.	CH <sub>3</sub> CHF	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-530.	CH <sub>3</sub> CHF	4-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-531.	CH <sub>3</sub> CHF	4-isopropil-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-532.	CH <sub>3</sub> CHF	4-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-533.	CH <sub>3</sub> CHF	4-isobutil-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-534.	CH <sub>3</sub> CHF	4-terc-buil-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-535.	CH <sub>3</sub> CHF	4-F <sub>3</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-536.	CH <sub>3</sub> CHF	4-metoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-537.	CH <sub>3</sub> CHF	4-etoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-538.	CH <sub>3</sub> CHF	4-n-propoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-539.	CH <sub>3</sub> CHF	4-isopropoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-540.	CH <sub>3</sub> CHF	4-n-butoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-541.	CH <sub>3</sub> CHF	4-terc-butoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-542.	CH <sub>3</sub> CHF	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-543.	CH <sub>3</sub> CHF	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-544.	CH <sub>3</sub> CHF	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> -
A-545.	CH <sub>3</sub> CHF	3,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -
A-546.	CH <sub>3</sub> CHF	3,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -
A-547.	CH <sub>3</sub> CHF	3,4-Br <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -
A-548.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-549.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-550.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(4-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-551.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(4-iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-552.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(4-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-553.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(4-iso-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-554.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(4-terc-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-555.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(4-H <sub>3</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-556.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(4-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-557.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(4-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-558.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(4-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-559.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(4-terc-butoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-560.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-561.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-562.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-563.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-564.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-565.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3-iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-566.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-567.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3-iso-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-568.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3-terc-butil-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-569.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3-H <sub>3</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-570.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-571.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-572.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-573.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3-terc-butoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-574.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-575.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-576.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -

N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup> -A
A-577.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-578.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(2-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-579.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(2-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-580.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(2-iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-581.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(2-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-582.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(2-iso-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-583.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(2-terc-butyl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-584.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(2-H <sub>3</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-585.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(2-H <sub>3</sub> C- <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-586.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(2-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-587.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(2-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-588.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(2-terc-butoxi-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-589.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-590.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-591.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(2-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-592.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-593.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-594.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-595.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3-F--4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-596.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3-Cl-4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-597.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3-CH <sub>3</sub> -4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-598.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3-Cl-4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-599.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3-Cl-4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-600.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(3-CH <sub>3</sub> -4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -
A-601.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-602.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-603.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-604.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 4-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-605.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 4-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-606.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 4-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-607.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 4-Cl-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-608.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 4-Cl-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-609.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 4-Cl-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-610.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 4-Br-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-611.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 4-Br-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-612.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 4-Br-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-613.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 4-Cl-2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-614.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 4-Cl-2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-615.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 4-Cl-2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-616.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 6-Cl-2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-617.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 6-Cl-2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-618.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 6-Cl-2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-619.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-620.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-621.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 2-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-622.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 2,4-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-623.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 2,4-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-624.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 2,4-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-625.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 2,5-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-626.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 2,5-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-627.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 2,5-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-628.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 2,6-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-629.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 2,6-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-630.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 2,6-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-631.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 2-CH <sub>3</sub> O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-

N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup> -A
A-632.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 2-CH <sub>3</sub> O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-633.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 2-CH <sub>3</sub> O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-634.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 4-CH <sub>3</sub> O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-635.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 4-CH <sub>3</sub> O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-636.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 4-CH <sub>3</sub> O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-637.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 4-H <sub>5</sub> C <sub>2</sub> -O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-638.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 4-H <sub>5</sub> C <sub>2</sub> -O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-639.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 4-H <sub>5</sub> C <sub>2</sub> -O-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-640.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 4-n-propoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-641.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 4-n-propoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-642.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 4-n-propoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-643.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 4-n-butoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-644.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 4-n-butoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-645.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 4-n-butoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-646.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 4-terc-butoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-647.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 4-terc-butoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-648.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 4-terc-butoxi-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-649.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 4-CH <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-650.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 4-CH <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-651.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 4-CH <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-652.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-653.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-654.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-655.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 4-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-656.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 4-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-657.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 4-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-658.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 4-iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-659.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 4-iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-660.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 4-iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-661.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 4-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-662.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 4-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-663.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 4-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-664.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 4-terc-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-665.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 4-terc-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-666.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 4-terc-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-667.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 4-cicl.-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-668.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 4-cicl.-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-669.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 4-cicl.-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-670.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 4-OCF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-671.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 4-OCF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-672.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 4-OCF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-673.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 4-CF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-674.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 4-CF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-675.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 4-CF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-676.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 3-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-677.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 3-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-678.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 3-F-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-679.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 3-Cl-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-680.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 3-Cl-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-681.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 3-Cl-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-682.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 3-Br-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-683.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 3-Br-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-684.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 3-Br-fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-685.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 3-CF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-686.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 3-CF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-

N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup> -A
A-687.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 3-CF <sub>3</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-688.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 3,4-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-689.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 3,4-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-690.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 3,4-F <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-691.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 3,4-Cl <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-692.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 3,4-Cl <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-693.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 3,4-Cl <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-694.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 3,4-Br <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-695.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 3,4-Br <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-696.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 3,4-Br <sub>2</sub> -fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-697.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 4-Difluorometoxifenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-698.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 4-Difluorometoxifenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-699.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 4-Difluorometoxifenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-700.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) 4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-701.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-702.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-703.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) (5,5,7,7-tetrametilindan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-704.	CH <sub>3</sub> CHF	(R)(5,5,7,7-tetrametilindan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-705.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) (5,5,7,7-tetrametilindan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-706.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) (1,1,4,4,-tetrametil-1,2,3,4- tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-707.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) (1,1,4,4,-tetrametil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-708.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) (1,1,4,4,-tetrametil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-709.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) (1,1-dimetil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-710.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) (1,1-dimetil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-711.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) (1,1-dimetil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-712.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) (1,1,4,4,7-pentametil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-713.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) (1,1,4,4,7-pentametil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-714.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) (1,1,4,4,7-pentametil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-715.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) (1,1,7-trimetil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-716.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) (1,1,7-trimetil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-717.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) (1,1,7-trimetil-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-6-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-718.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) (2-metil-1,3-dioxan-2-y)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-719.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 2-metil-1,3-dioxan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-720.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 2-metil-1,3-dioxan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-721.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) (2,5,5-trimetil-1,3-dioxan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-722.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) 2,5,5-trimetil-1,3-dioxan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-723.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) 2,5,5-trimetil-1,3-dioxan-2-il)-CH(CH <sub>3</sub> )-
A-724.	CH <sub>3</sub> CHF	(±) (2,2-difluorobenzodioxol-5-il)CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-
A-725.	CH <sub>3</sub> CHF	(R) (2,2-difluorobenzodioxol-5-il)CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-
A-726.	CH <sub>3</sub> CHF	(S) (2,2-difluorobenzodioxol-5-il)CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-
A-727.	CH <sub>3</sub> CHF	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-728.	CH <sub>3</sub> CHF	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-729.	CH <sub>3</sub> CHF	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-730.	CH <sub>3</sub> CHF	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-731.	CH <sub>3</sub> CHF	4-CH <sub>3</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-732.	CH <sub>3</sub> CHF	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-733.	CH <sub>3</sub> CHF	4-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-734.	CH <sub>3</sub> CHF	4-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-735.	CH <sub>3</sub> CHF	4-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-736.	CH <sub>3</sub> CHF	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-737.	CH <sub>3</sub> CHF	4-H <sub>3</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-738.	CH <sub>3</sub> CHF	4-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-739.	CH <sub>3</sub> CHF	4-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-740.	CH <sub>3</sub> CHF	4-H <sub>3</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-H <sub>2</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-741.	CH <sub>3</sub> CHF	4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -

N.º	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup> -A
A-742.	CH <sub>3</sub> CHF	4-F <sub>3</sub> CO-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-743.	CH <sub>3</sub> CHF	4-F <sub>3</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
A-744.	CH <sub>3</sub> CHF	3-F <sub>3</sub> C-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -

- [0065]** Ejemplos de un grupo de compuestos usados son las 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I, en la que X es Cl, R<sup>1</sup> es CH<sub>3</sub> y R<sup>3</sup> es H y R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> juntos tienen los significados dados en la Tabla A.
- 5 **[0066]** Ejemplos de un segundo grupo de compuestos usados son las 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I, en la que X es Cl, R<sup>1</sup> es OCH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup> es H y R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> juntos tienen los significados dados en la Tabla A.
- [0067]** Ejemplos de un tercer grupo de compuestos usados también son las 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I, en la que X es Cl, R<sup>1</sup> es SCH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup> es H y R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> juntos tienen los significados dados en la Tabla A.
- 10 **[0068]** Ejemplos de un cuarto grupo de compuestos usados también son las 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I, en la que X es Cl, R<sup>1</sup> es SOCH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup> es H y R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> juntos tienen los significados dados en la Tabla A.
- 15 **[0069]** Ejemplos de un quinto grupo de compuestos usados también son las 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I, en la que X es Cl, R<sup>1</sup> es SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup> es H y R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> juntos tienen los significados dados en la Tabla A.
- [0070]** Ejemplos de un sexto grupo de compuestos usados también son las 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I, en la que X es Cl, R<sup>1</sup> es CF<sub>3</sub>, R<sup>3</sup> es H y R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> juntos tienen los significados dados en la Tabla A.
- 20 **[0071]** Ejemplos de un séptimo grupo de compuestos usados también son las 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I, en la que X es Cl, R<sup>1</sup> es CN, R<sup>3</sup> es H y R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> juntos tienen los significados dados en la Tabla A.
- 25 **[0072]** Ejemplos de un octavo grupo de compuestos usados también son las 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I, en la que X es Cl, R<sup>1</sup> es OH, R<sup>3</sup> es H y R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> juntos tienen los significados dados en la Tabla A.
- 30 **[0073]** Ejemplos de un noveno grupo de compuestos usados también son las 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I, en la que X es Cl, R<sup>1</sup> es OCHF<sub>2</sub>, R<sup>3</sup> es H y R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> juntos tienen los significados dados en la Tabla A.
- [0074]** Ejemplos de un décimo grupo de compuestos usados también son las 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I, en la que X es Cl, R<sup>1</sup> es OCF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, R<sup>3</sup> es H y R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> juntos tienen los significados dados en la Tabla A.
- 35 **[0075]** Ejemplos de un undécimo grupo de compuestos usados también son las 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I, en la que X es Cl, R<sup>1</sup> es OCF<sub>3</sub>, R<sup>3</sup> es H y R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> juntos tienen los significados dados en la Tabla A.
- 40 **[0076]** Ejemplos de un duodécimo grupo de compuestos usados también son las 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I, en la que X es Cl, R<sup>1</sup> es OCH<sub>2</sub>C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>, R<sup>3</sup> es H y R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> juntos tienen los significados dados en la Tabla A.
- 45 **[0077]** Ejemplos de un décimo tercer grupo de compuestos usados también son las 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I, en la que X es Cl, R<sup>1</sup> es OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup> es H y R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> juntos tienen los significados dados en la Tabla A.
- 50 **[0078]** Ejemplos de un décimo cuarto grupo de compuestos usados también son las 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I, en la que X es Cl, R<sup>1</sup> es OCH<sub>2</sub>C≡CH, R<sup>3</sup> es H y R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> juntos tienen los significados dados en la Tabla A.
- 55 **[0079]** Ejemplos de un décimo quinto grupo de compuestos usados también son las 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I, en la que X es Cl, R<sup>1</sup> es OCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, R<sup>3</sup> es H y R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> juntos tienen los significados

dados en la Tabla A.

**[0080]** Ejemplos de un décimo sexto grupo de compuestos usados también son las 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I, en la que X es Cl, R<sup>1</sup> es O-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup> es H y R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> juntos tienen los significados dados en la Tabla A.

**[0081]** Ejemplos de un décimo séptimo grupo de compuestos usados también son las 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I, en la que X es Cl, R<sup>1</sup> es O-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup> es H y R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> juntos tienen los significados dados en la Tabla A.

**[0082]** Ejemplos de un décimo octavo grupo de compuestos usados también son las 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I, en la que X es Cl, R<sup>1</sup> es S-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup> es H y R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> juntos tienen los significados dados en la Tabla A.

**[0083]** Ejemplos de un décimo noveno grupo de compuestos usados también son las 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I, en la que X es Cl, R<sup>1</sup> es S-CH<sub>2</sub>C(O)-O-CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup> es H y R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> juntos tienen los significados dados en la Tabla A.

**[0084]** Ejemplos de un vigésimo grupo de compuestos usados también son las 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I, en la que X es Cl, R<sup>1</sup> es S-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)-O-CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup> es H y R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> juntos tienen los significados dados en la Tabla A.

**[0085]** Ejemplos de un vigésimo primer grupo de compuestos usados también son las 6-cloro-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I, en la que X es Cl, R<sup>1</sup> es S-CH<sub>2</sub>C(O)-OH, R<sup>3</sup> es H y R<sup>4</sup>-A y R<sup>2</sup> juntos tienen los significados dados en la Tabla A.

Procedimiento de preparación de compuestos de 6-halógeno-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]-pirimidina

**[0086]** Las 6-halógeno-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidinas de fórmula I según la presente invención pueden prepararse como se describe en el documento WO2005/025315 (publicación de patente de EE.UU. 2006/264446). Pueden prepararse, por ejemplo, similarmente a un proceso descrito en Pharmazie, 1971, 26, 534 ff o en el documento DD 99 794, o cualquier otro procedimiento que entra dentro de la competencia de un experto en la materia que es un especialista en la síntesis química. Para la preparación química de los productos de la invención, se considera que el experto en la materia tiene disponible, entre otros, todo el contenido de "Chemical Abstracts" y de los documentos que se citan en su interior, textos de química orgánica tales como March's Advanced Organic Chemistry – Reactions, Mechanisms and Structure (6ª Edición), Wiley-Interscience, (2007); Vogel's Textbook of Practical Organic Chemistry (5ª Edición), Longman Scientific & Technical, (1989); Protective Groups in Organic Synthesis (3ª Edición), Wiley Interscience, (1999); etc.

Realizaciones de parásitos

**[0087]** Parásito, dentro del significado de la presente invención, se entiende que significa no solo parásitos verdaderos, sino también insectos u otra plaga capaz de contaminar huéspedes ocasionales o permanentes o de otro modo dañarlos. Los parásitos elegidos como diana por la invención están principalmente compuestos por artrópodos que incluye insectos y Arachnida, que incluye Acarina.

**[0088]** Una realización de la descripción es un procedimiento de eliminación de parásitos de vertebrados y que incluyen pero no excluyen, ectoparásitos de vertebrados que incluyen, pero no se limitan a, mamíferos, en los que los ectoparásitos incluyen artrópodos, tales como insectos y Arachnida; en el que una cantidad eficazmente parasiticida de un compuesto de fórmula I como se ha definido anteriormente se administra al animal mediante una vía de administración que hace posible buena eficacia del compuesto contra dichos parásitos.

**[0089]** Otra realización de la descripción es un procedimiento de eliminación de pulgas que incluyen Ctenocephalides spp. y las especies felis; garrapatas, que incluyen Rhipicephalus spp., y las especies sanguineus y Boophilus spp., que incluyen las especies microplus; parásitos causantes de miasis o sarna, que incluyen Sarcoptes spp., y las especies cabiei; y piojos, que incluye Damalinia spp. y Linognathus spp., en animales de compañía (tales como perros y gatos), ganado vacuno, cabras y ovejas, y Suidae (que incluyen cerdos).

**[0090]** Los compuestos de fórmula I o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos y

composiciones que los comprenden son preferentemente para su uso en controlar y prevenir infestaciones e infecciones en animales que incluyen animales de sangre caliente (incluyendo seres humanos) y peces. Son, por ejemplo, adecuados para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en mamíferos que incluyen, pero no se limitan a, ganado vacuno, ovejas, porcinos, camellos, ciervos, caballos, cerdos, aves de corral, llamas, alpacas, 5 conejos, cabras, perros y gatos, búfalo de agua, burros, gamos y renos, y también en animales que llevan pelo que incluyen, pero no se limitan a, visón, chinchilla y mapache, aves tales como gallinas, gansos, pavos y patos, y peces que incluyen, pero no se limitan a, peces de agua dulce y de agua salada tales como trucha, carpa y anguilas.

**[0091]** En una realización de la invención, los compuestos de fórmula I o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos y las composiciones que los comprenden son para su uso en controlar y 10 prevenir infestaciones e infecciones en animales domésticos, tales como perros o gatos.

**[0092]** Las infestaciones en animales de sangre caliente y peces incluyen, pero no se limitan a, piojos, piojos masticadores, garrapatas, larvas nasales, moscas piojo, moscas picadoras, moscas muscoides, moscas, larvas de moscas miasíticas, niguas, jejenes, mosquitos y pulgas.

**[0093]** Los compuestos de fórmula I o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos y las composiciones que los comprenden son adecuados para el control sistémico y/o no sistémico de ecto- y/o 15 endoparásitos. Son activos contra todos o algunos de los estadios de desarrollo de los parásitos.

**[0094]** Como se describe en el presente documento, los compuestos de fórmula I son para su uso en combatir ectoparásitos.

**[0095]** Como se describe en el presente documento, los compuestos de fórmula I son para su uso en combatir parásitos de los siguiente ordenes y especies, respectivamente:

25 pulgas (Siphonaptera), por ejemplo, *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans* y *Nosopsyllus fasciatus*,

cucarachas (Blattaria - Blattodea), por ejemplo, *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, 30 *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae* y *Blatta orientalis*,

moscas, mosquitos (Diptera), por ejemplo, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, 35 *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochilomyia hominivorax*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Hapiodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, 40 *Lucilla caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonia* spp., *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Prosimullum mixtum*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga* sp., *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola* y *Tabanus similis*,

45 piojos (Phthiraptera), por ejemplo, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*.

**[0096]** Garrapatas y ácaros parasíticos (Parasitiformes): garrapatas (Ixodida), por ejemplo, *Ixodes scapularis*, 50 *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata* y ácaros parasíticos (Mesostigmata), por ejemplo, *Ornithonyssus bacoti* y *Dermanyssus gallinae*,

**[0097]** Actiniedida (Prostigmata) y Acaridida (Astigmata), por ejemplo, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., 55 *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp. y *Laminosioptes* spp.,

**[0098]** Escarabajos (Heteroptera): *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp.,

Rhodnius ssp., Panstrongylus ssp. y Arilus critatus,

**[0099]** Anoplurida, por ejemplo, Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phtirus spp. y Solenopotes spp,

5

**[0100]** Mallophagida (subórdenes Amblycerina y Ischnocerina), por ejemplo, Trimenopon spp., Menopon spp., Trinoton spp., Bovicola spp., Werneckiella spp., Lepikentron spp., Trichodectes spp. y Felicola spp,

**[0101]** Ascárides (Nematoda):

10

Tricocéfalos, por ejemplo, Trichinellidae (Trichinella spp.), Trichuridae (Trichuris spp., Capillaria spp.),

Rhabditida, por ejemplo, Rhabditis spp., Strongyloides spp., Helicephalobus spp.,

15

Strongylida, por ejemplo, Strongylus spp., Ancylostoma spp., Necator americanus, Bunostomum spp. (helminto), Trichostrongylus spp., Haemonchus contortus., Ostertagia spp., Cooperia spp., Nematodirus spp., Dictyocaulus spp., Cyathostoma spp., Oesophagostomum spp., Stephanurus dentatus, Ollulanus spp., Chabertia spp., Stephanurus dentatus, Syngamus trachea, Ancylostoma spp., Uncinaria spp., Globocephalus spp., Necator spp., Metastrongylus spp., Muellerius capillaris, Protostrongylus spp., Anglostrongylus spp., Parelaphostrongylus spp. Aleurostrongylus abstrusus y Dioctophyma renale,

20

**[0102]** Ascárides intestinales (Ascaridida), por ejemplo, Ascaris lumbricoides, Ascaris suum, Ascaridia galli, Parascaris equorum, Enterobius vermicularis (lombriz intestinal), Toxocara canis, Toxascaris leonine, Skrjabinema spp. y Oxyuris equi,

25

Camallanida, por ejemplo, Dracunculus medinensis (gusano de Guinea)

**[0103]** Spirurida, por ejemplo, Thelazia spp., Wuchereria spp., Brugia spp., Onchocerca spp., Dirofilaria immitis, Dipetalonema spp., Setaria spp., Elaeophora spp., Spirocerca lupi y Habronema spp.,

30

**[0104]** Acantocéfalos (Acanthocephala), por ejemplo, Acanthocephalus spp., Macracanthorhynchus hirudinaceus y Oncicola spp,

**[0105]** Planarios (Plathelminthes):

35

Duelas (Trematoda), por ejemplo, Fasciola spp., Fascioloides magna, Paragonimus spp.,

Dicrocoelium spp., Fasciolopsis buski, Clonorchis sinensis, Schistosoma spp.,

40

Trichobilharzia spp., Alaria alata, Paragonimus spp. y Nanocyetes spp,

**[0106]** Cercomeromorpha, en particular Cestoda (tenias), por ejemplo, Diphyllbothrium spp., Tenia spp., Echinococcus spp., Dipylidium caninum, Multiceps spp., Hymenolepis spp., Mesocestoides spp., Vampirolepis spp., Moniezia spp., Anoplocephala spp., Sirometra spp., Anoplocephala spp. e Hymenolepis spp.

45

**[0107]** Los compuestos de fórmula I y las composiciones que los contienen son útiles para el control de plagas de los órdenes Diptera, Siphonaptera e Ixodida.

**[0108]** Como se describe en el presente documento, los compuestos de fórmula I y las composiciones que los contienen son para su uso en combatir mosquitos.

50

**[0109]** Como se describe en el presente documento, los compuestos de fórmula I y las composiciones que los contienen son para su uso en combatir moscas.

55

**[0110]** Como se describe en el presente documento, los compuestos de fórmula I y las composiciones que los contienen son para su uso en combatir pulgas.

**[0111]** Como se describe en el presente documento, los compuestos de fórmula I y las composiciones que los contienen son para su uso en combatir garrapatas.

**[0112]** Los compuestos de fórmula I también útiles para combatir endoparásitos que Incluyen pero no se limitan a ascárides (Nematoda), acantocéfalos y planarios.

5 Aplicaciones

**[0113]** La administración puede llevarse a cabo tanto profilácticamente como terapéuticamente.

**[0114]** La administración de los compuestos activos se lleva a cabo directamente o en forma de preparaciones adecuadas, por vía oral, por vía tópica/dérmica o por vía parenteral.

**[0115]** Para administración por vía oral a animales de sangre caliente, los compuestos de fórmula I pueden formularse como piensos para animales, premezclas de piensos para animales, concentrados de piensos para animales, píldoras, disoluciones, pastas, suspensiones, rociados, geles, comprimidos, bolos y cápsulas. Además, los compuestos de fórmula I pueden administrarse a los animales en su agua de beber.

**[0116]** Para administración por vía oral, la forma de dosificación elegida debe proporcionar al animal una cantidad de aproximadamente 0,01 mg/kg a aproximadamente 100 mg/kg de peso corporal del animal por día de compuesto de fórmula I. En otra realización de administración por vía oral, la forma de dosificación proporciona al animal una cantidad de aproximadamente 0,5 mg/kg a aproximadamente 100 mg/kg de peso corporal del animal por día.

**[0117]** Alternativamente, los compuestos de fórmula I pueden ser para administración a los animales por vía parenteral, por ejemplo, por inyección intra-ruminal, intramuscular, intravenosa o subcutánea. Los compuestos de fórmula I pueden dispersarse o disolverse en un vehículo fisiológicamente aceptable para inyección subcutánea. Alternativamente, los compuestos de fórmula I pueden formularse dentro de un implante para administración subcutánea. Además, el compuesto de fórmula I puede ser para administración transdérmica a animales. Para administración parenteral, la forma de dosificación elegida debe proporcionar al animal aproximadamente 0,01 mg/kg a aproximadamente 100 mg/kg de peso corporal del animal por día de compuesto de fórmula I.

**[0118]** Los compuestos de fórmula I también pueden ser para administración tópica a los animales en forma de gotas, polvos extensibles, polvos, collares, medallones, esprays, champús, formulaciones de aplicación transcutánea y aplicación epicutánea y en pomadas o emulsiones de aceite en agua o de agua en aceite. Para administración tópica, las gotas y esprays normalmente contienen una cantidad de compuesto de fórmula I seleccionada de los intervalos de aproximadamente 0,5 ppm a aproximadamente 5.000 ppm y aproximadamente 1 ppm a aproximadamente 3.000 ppm. Además, los compuestos de fórmula I pueden formularse como marcas para las orejas para animales, que incluye cuadrúpedos tales como ganado vacuno y ovejas.

**[0119]** Otro aspecto de la descripción es procedimientos terapéuticos previstos para el tratamiento o la prevención de parasitosis que tienen consecuencias patógenas, en los que, por ejemplo, los compuestos de fórmula I se aplican en la eliminación de parásitos causantes de miasis, en animales tales como ganado vacuno, caballos, cabras u ovejas, en regiones en las que existe una presión significativa de estos parásitos causantes de miasis.

**[0120]** Otro aspecto de la descripción es procedimientos terapéuticos previstos para el tratamiento o la prevención de parasitosis que tienen consecuencias patógenas, en los que, por ejemplo, los compuestos de fórmula I se aplican en la eliminación de garrapatas, en animales tales como ganado vacuno o perros, en regiones en las que la presión de garrapatas es de tal naturaleza que produzca consecuencias patógenas a escala significativa.

**[0121]** Otro objeto de la descripción es procedimientos con un fin no terapéutico, por ejemplo, limpieza de pelajes de animales tales como perros y otros animales de compañía, que así se libran de parásitos tales como pulgas, y sus desechos y excrementos. El animal tratado presenta un pelaje que es agradable a la vista y agradable al tacto.

**[0122]** Otros procedimientos no terapéuticos según la descripción se aplican, por ejemplo, en combatir moscas perjudiciales, en animales de compañía o animales productores de beneficio. En otra realización del procedimiento no terapéutico, los animales se crían bajo condiciones intensivas o en manadas.

55 Formas de la composición

**[0123]** Otro objeto de la descripción es composiciones para la implementación de procedimientos con un fin terapéutico según la invención.

**[0124]** Otro objeto de la descripción es composiciones para la implementación de procedimientos no terapéuticos según la invención, en particular para limpiar pelajes.

5 **[0125]** Formas de composición adecuadas incluyen, pero no se limitan a:

Disoluciones tales como disoluciones orales, concentrados para administración por vía oral después de dilución,

10 Disoluciones para su uso sobre la piel o en cavidades del cuerpo, formulaciones de aplicación epicutánea, geles; emulsiones y suspensiones para administración oral o dérmica; preparaciones semi-sólidas;

Formulaciones en las que el compuesto activo se procesa en una base de pomada o en una emulsión de aceite en agua o base de agua en aceite;

15 Preparaciones sólidas tales como polvos, premezclas o concentrados, gránulos, sedimentos, comprimidos, bolos, cápsulas; aerosoles y inhalantes, y artículos moldeados que contienen compuesto activo.

**[0126]** Composiciones adecuadas para inyección se preparan disolviendo el principio activo en un disolvente adecuado y opcionalmente añadiendo adicionalmente componentes tales como ácidos, bases, sales tampón, conservantes y solubilizantes. Las disoluciones se filtran y se envasan estériles.

20 Disolventes adecuados son disolventes fisiológicamente tolerable tales como agua, alcanoles tales como etanol, butanol, alcohol bencílico, glicerol, propilenglicol, polietilenglicoles, N-metil-pirrolidona, 2-pirrolidona, y mezclas de los mismos.

25

**[0127]** Los compuestos parasiticidas usados en la presente invención pueden opcionalmente disolverse en aceites vegetales o sintéticos fisiológicamente tolerables que son adecuados para inyección.

**[0128]** Solubilizantes adecuados son disolventes que promueven la disolución del compuesto activo en el disolvente principal o previenen su precipitación. Ejemplos son polivinilpirrolidona, poli(alcohol vinílico), aceite de ricino polioxietilado y éster de sorbitano polioxietilado.

30

**[0129]** Conservantes adecuados son alcohol bencílico, triclorobutanol, ésteres del ácido p-hidroxibenzoico y n-butanol.

35

**[0130]** Las disoluciones orales se administran directamente. Los concentrados se administran por vía oral después de dilución previa a la concentración de uso. Las disoluciones orales y los concentrados se preparan según el estado de la técnica y como se ha descrito anteriormente para disoluciones para inyección, no siendo necesarios procedimientos estériles.

40

**[0131]** Las disoluciones para su uso sobre la piel se dejan chorrear, se extienden, se frotran, se rocían o se pulverizan.

**[0132]** Las disoluciones para su uso sobre la piel se preparan según el estado de la técnica y según lo que se ha descrito anteriormente para disoluciones para inyección, no siendo necesarios procedimientos estériles. Disolventes adecuados adicionales son polipropilenglicol, feniletanol, fenoxietanol, éster tal como acetato de etilo o de butilo, benzoato de bencilo, éteres tales como éter alquílico de alquilenglicol, por ejemplo éter monometílico de dipropilenglicol, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, hidrocarburos aromáticos, aceites vegetales y sintéticos, dimetilformamida, dimetilacetamida, transcutol, solcetal, carbonato de propileno, y mezclas de los mismos.

50

**[0133]** Puede ser ventajoso añadir espesantes durante la preparación. Espesantes adecuados son espesantes inorgánicos tales como bentonitas, ácido silícico coloidal, monoestearato de aluminio, y espesantes orgánicos tales como derivados de celulosa, poli(alcoholes vinílicos) y sus copolímeros, acrilatos y metacrilatos.

55 **[0134]** Los geles se aplican a o se extienden sobre la piel o se introducen dentro de cavidades del cuerpo. Los geles se preparan tratando disoluciones que han sido preparadas como se describe en el caso de las disoluciones para inyección con suficiente espesante tal que resulte un material claro que tiene una consistencia similar a pomada. Los espesantes empleados son los espesantes dados anteriormente.

**[0135]** Las formulaciones de aplicación epicutánea se vierten o pulverizan sobre áreas limitadas de la piel, penetrando el compuesto activo en la piel y actuando sistémicamente.

**[0136]** Las formulaciones de aplicación epicutánea se preparan disolviendo, suspendiendo o emulsionando el compuesto activo en un disolvente compatible con la piel adecuado o una mezcla de disolventes. Si es apropiado, se añaden otros auxiliares tales como colorantes, sustancias promotoras de la bioabsorción, antioxidantes, fotoestabilizadores, adhesivos.

**[0137]** Disolventes adecuados son:

10

agua, alcanoles, glicoles, polietilenglicoles, polipropilenglicoles, glicerol, alcoholes aromáticos tales como alcohol bencílico, feniletanol, fenoxietanol, ésteres tales como acetato de etilo, acetato de butilo, benzoato de bencilo, éteres tales como éteres alquílicos de alquilenglicol tales como éter monometílico de dipropilenglicol, éter monobutílico de dietilenglicol, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, carbonatos cíclicos tales como carbonato de propileno, carbonato de etileno, hidrocarburos aromáticos y/o alifáticos, aceites vegetales o sintéticos, DMF, dimetilacetamida, n-alquilpirrolidonas tales como metilpirrolidona, n-butilpirrolidona o n-octilpirrolidona, N-metilpirrolidona, 2-pirrolidona, 2,2-dimetil-4-oxi-metilen-1,3-dioxolano y glicerolformal.

15

**[0138]** Colorantes adecuados son todos los colorantes permitidos para su uso en animales y que pueden disolverse o suspenderse.

20

**[0139]** Sustancias promotoras de la absorción adecuadas son, por ejemplo, DMSO, aceites de extensión tales como miristato de isopropilo, pelargonato de dipropilenglicol, aceites de silicona y copolímeros de los mismos, con poliéteres, ésteres de ácidos grasos, triglicéridos, alcoholes grasos.

25

**[0140]** Antioxidantes adecuados son sulfitos o metabisulfitos tales como metabisulfito de potasio, ácido ascórbico, butilhidroxitolueno (BHT), butilhidroxianisol, tocoferol.

**[0141]** Fotoestabilizadores adecuados son, por ejemplo, ácido novantisólico.

30

**[0142]** Adhesivos adecuados son, por ejemplo, derivados de celulosa, derivados de almidón, poliacrilatos, polímeros naturales tales como alginatos, gelatina.

**[0143]** Las emulsiones pueden administrarse por vía oral, dérmicamente o como inyecciones.

35

**[0144]** Las emulsiones son cualquiera de las emulsiones de agua en aceite (W/O), de aceite en agua (O/W), de agua en aceite en agua (W/O/W), de aceite en agua en aceite (O/W/O), de Pickering o emulsiones que están libres de emulsionante.

**[0145]** Se preparan disolviendo el compuesto activo tanto en la fase hidrófoba como en la hidrófila y homogeneizando ésta con el disolvente de la otra fase con la ayuda de emulsionantes adecuados y, si es apropiado, otros auxiliares tales como colorantes, sustancias promotoras de la absorción, conservantes, antioxidantes, fotoestabilizadores, sustancias potenciadoras de la viscosidad.

40

**[0146]** Fases hidrófobas (aceites) adecuadas son:

45

parafinas líquidas, aceites de silicona, aceites vegetales naturales tales como aceite de sésamo, aceite de almendra, aceite de ricino, triglicéridos sintéticos tales como biglicérido caprílico/cáprico, mezcla de triglicéridos con ácidos grasos vegetales de la longitud de cadena C<sub>8</sub>-C<sub>12</sub> u otros ácidos grasos naturales especialmente seleccionados, mezclas de glicéridos parciales de ácidos grasos saturados o insaturados que posiblemente también contienen grupos hidroxilo, mono- y diglicéridos de los ácidos grasos C<sub>8</sub>-C<sub>10</sub>,

50

ésteres de ácidos grasos tales como estearato de etilo, adipato de di-n-butirilo, laurato de hexilo, pelargonato de dipropilenglicol, ésteres de un ácido graso ramificado de longitud de cadena media con alcoholes grasos saturados de longitud de cadena C<sub>16</sub>-C<sub>18</sub>, miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, ésteres del ácido caprílico/cáprico de alcoholes grasos saturados de longitud de cadena C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>, estearato de isopropilo, oleato de oleílo, oleato de decilo, oleato de etilo, lactato de etilo, ésteres cerosos de ácidos grasos tales como grasa sintética de la glándula coccígea de pato, ftalato de dibutilo, adipato de diisopropilo, y mezclas de ésteres relacionadas con los últimos, alcoholes grasos tales como alcohol isotridecílico, 2-octildodecanol, alcohol cetilestearílico, alcohol oleico, y ácidos grasos

55

tales como ácido oleico y mezclas de los mismos.

**[0147]** Fases hidrófilas adecuadas son:

5 agua, alcoholes tales como propilenglicol, glicerol, sorbitol y mezclas de los mismos.

**[0148]** Emulsionantes adecuados son:

10 tensioactivos no iónicos, por ejemplo, aceite de ricino polietoxilado, monooleato de sorbitano polietoxilado, monoestearato de sorbitano, monoestearato de glicerol, estearato de polioxietilo, poliglicoléter de alquilfenol;

15 tensioactivos anfólicos tales como N-lauril-p-iminodipropionato de di-sodio o lecitina; tensioactivos aniónicos, tales como laurilsulfato de sodio, éter sulfatos de alcoholes grasos, sal de monoetanolamina de éster del ácido mono/dialquilpoliglicoléter ortofosfórico;

tensioactivos activos para cationes, tales como cloruro de cetiltrimetilamonio.

20 **[0149]** Auxiliares adicionales adecuados son:

25 sustancias que potencian la viscosidad y estabilizan la emulsión, tales como carboximetilcelulosa, metilcelulosa y otros derivados de celulosa y de almidón, poliacrilatos, alginatos, gelatina, goma arábiga, polivinilpirrolidona, poli(alcohol vinílico), copolímeros de metil vinil éter y anhídrido maleico, polietilenglicoles, ceras, ácido silícico coloidal o mezclas de las sustancias mencionadas.

30 **[0150]** Las suspensiones pueden administrarse por vía oral o por vía tópica/dérmica. Se preparan suspendiendo el compuesto activo en un agente de suspensión, si es apropiado con adición de otros auxiliares tales como agentes humectantes, colorantes, sustancias promotoras de la bioabsorción, conservantes, antioxidantes, fotoestabilizadores.

**[0151]** Agentes de suspensión líquidos son todos los disolventes homogéneos y mezclas de disolventes.

**[0152]** Agentes humectantes adecuados (dispersantes) son los emulsionantes dados anteriormente.

35 **[0153]** Otros auxiliares que pueden mencionarse son aquellos dados anteriormente.

**[0154]** Las preparaciones semi-sólidas pueden administrarse por vía oral o por vía tópica/dérmica. Se diferencian de las suspensiones y emulsiones descritas anteriormente solo por su mayor viscosidad.

40 **[0155]** Para la producción de preparaciones sólidas, el compuesto activo se mezcla con excipientes adecuados, si es apropiado con la adición de auxiliares, y se llevan a la forma deseada.

45 **[0156]** Excipientes adecuados son todas las sustancias inertes sólidas fisiológicamente tolerables. Aquellos usados son sustancias inorgánicas y orgánicas. Las sustancias inorgánicas son, por ejemplo, cloruro sódico, carbonatos tales como carbonato cálcico, hidrogenocarbonatos, óxidos de aluminio, óxido de titanio, ácidos silícicos, tierras arcillosas, sílice precipitada o coloidal, o fosfatos. Las sustancias orgánicas son, por ejemplo, azúcar, celulosa, alimentos y piensos tales como leche en polvo, harina animal, harinas y triturados de grano, almidones.

50 **[0157]** Auxiliares adecuados son conservantes, antioxidantes y/o colorantes que se han mencionado anteriormente.

**[0158]** Otros auxiliares adecuados son lubricantes y deslizantes tales como estearato de magnesio, ácido esteárico, talco, bentonitas, sustancias promotoras de la disgregación tales como almidón o polivinilpirrolidona reticulada, aglutinantes tales como almidón, gelatina o polivinilpirrolidona lineal, y aglutinantes secos tales como 55 celulosa microcristalina.

**[0159]** En general, "cantidad parasiticidamente eficaz" significa la cantidad de principio activo necesaria para lograr un efecto observable sobre el crecimiento, que incluye los efectos de necrosis, muerte, retardo, prevención y eliminación, destrucción, o disminución de otro modo de la aparición y actividad del organismo diana. La cantidad

parasiticidamente eficaz puede variar para los diversos compuestos/composiciones usados en la invención. Una cantidad parasiticidamente eficaz de las composiciones también variará según las condiciones reinantes tales como efecto parasiticida deseado y duración, especies diana, modo de aplicación, y similares. Una cantidad parasiticidamente eficaz debe producir concentraciones en sangre y/o de tejido, o concentraciones residuales sobre/en la piel, que son tóxicas por ingestión o contacto por artrópodos parasíticos, que incluyen, pero no se limitan a, artrópodos picadores, chupadores o mordedores.

**[0160]** Según una realización de la descripción, la administración de la dosis eficaz al animal se lleva a cabo una vez o un número muy pequeño de veces durante una duración de la actividad de al menos un mes, que puede ser ventajosamente dos o tres meses o incluso seis meses. En otras palabras, esta realización es aproximadamente un procedimiento de combate permanente en un entorno en el que el animal está sometido a una fuerte presión parasítica, en el que una administración sistémica o tópica se lleva a cabo a una frecuencia muy por debajo de una administración diaria, tal como, por ejemplo, una administración mensual, o incluso inferior a una frecuencia mensual, por ejemplo trimestral o bi-anual.

**[0161]** Además, es particularmente notable y sorprendente que sea capaz de actuar eficazmente y durante periodos de tiempo tan largos contra ectoparásitos que viven en los integumentos o sobre el pelo del animal por la administración de dosis relativamente bajas y no tóxicas por administración sistémica o tópica, sin requerir el empleo de medios de liberación controlada y de larga duración. Aunque no se desea ceñirse a teoría alguna, parece que la eficacia a largo plazo está relacionada con la combinación de una persistencia muy larga del compuesto con una toxicidad excepcional por ingestión y/o contacto con el parásito.

**[0162]** La dosis eficaz administrada en el procedimiento según la descripción puede ser un intervalo seleccionado del grupo que consiste en entre aproximadamente 0,001 mg/kg y aproximadamente 100 mg/kg, aproximadamente 0,01 mg/kg y aproximadamente 100 mg/kg y aproximadamente 1 a aproximadamente 50 mg/kg de peso del animal.

**[0163]** Para la mayoría de las especies huésped, la dosis y la composición para administración sistémica se eligen para mantener un nivel en suero de un compuesto según la fórmula I de superior o igual a aproximadamente 1 ng/ml, por ejemplo, aproximadamente 1 a aproximadamente 50 ng/ml.

**[0164]** Otra realización del procedimiento para combatir los parásitos según la descripción es el combate de pulgas y garrapatas de animales de compañía pequeños, tal como perros y gatos. Los niveles en suero para la administración sistémica están seleccionados del grupo de intervalos que consiste en aproximadamente 10 a aproximadamente 50 ng/ml y aproximadamente 20 a aproximadamente 30 ng/ml contra pulgas y aproximadamente 10 a aproximadamente 75 ng/ml y aproximadamente 30 a aproximadamente 50 ng/ml contra garrapatas.

**[0165]** Otra realización más del procedimiento para combatir parásitos según la descripción es el combate de garrapatas, moscas y parásitos causantes de miasis que parasitan animales grandes tales como ganado vacuno, cabras y ovejas.

**[0166]** Otra realización del procedimiento de combate de parásitos según la descripción es el tratamiento de sarna porcina.

**[0167]** Una realización para la administración de la composición es por la vía oral o parenteral o por una formulación tópica con o sin un efecto transcutáneo.

**[0168]** En otra realización para la administración de la composición, las composiciones según la descripción se proporcionan para administración en una dosis única o una dosis repetida un pequeño número de veces y comprenden una dosis de compuesto de fórmula (I) seleccionado de los intervalos que consisten en entre aproximadamente 0,01 y aproximadamente 100 mg/kg y aproximadamente 1 y aproximadamente 50 mg/kg de peso corporal del animal.

**[0169]** Las composiciones son eficaces a lo largo de un intervalo de dosis bastante amplio, que hace posible proporcionar las mismas dosificaciones para animales pequeños que tienen tamaños relativamente diferentes.

**[0170]** Para administración por vía oral, la composición puede prepararse opcionalmente en el momento de uso, por ejemplo, por mezcla simple de una preparación en polvo o disuelta de una composición que contiene el compuesto de fórmula I dentro del alimento del animal tal como alimento preparado para perros o gatos.

**[0171]** La composición puede, sin embargo, también proporcionarse en cualquier otra forma adecuada para administración por vía oral, tal como, por ejemplo, disoluciones o suspensiones que van a tomarse por vía oral, emulsiones, microemulsiones, cremas, sedimentos, comprimidos, cápsulas de gelatina u otros.

5 **[0172]** En una realización para el excipiente que forma parte de la composición para administración por vía oral, el excipiente facilita la liberación de los compuestos parasiticidas dentro de los intestinos. En otra realización del excipiente usado, se forma una cápsula de gelatina gastroprotegida o comprimido gastrorresistente.

10 **[0173]** En una realización de la descripción para animales grandes, las composiciones se administran en forma de polvos, o composiciones resistentes al rumen, bolos o dispositivos intra-ruminales.

**[0174]** Para administración por vía parenteral, tal como la vía subcutánea o intramuscular, el compuesto de fórmula I pueden estar contenido en un excipiente líquido que es biológicamente adecuado para inyección en la forma de disolución, suspensión, emulsión o microemulsión.

15

**[0175]** La composición parenteral también puede producirse en la forma particulada, tal como nanopartículas y nanocápsulas, micropartículas, microcápsulas o liposomas, o alternativamente en forma de un implante.

20 **[0176]** La composición según la descripción puede presentarse en forma de una dosis única sin medios de liberación controlada. En este caso, la dosis es entre aproximadamente 1 y aproximadamente 20 mg/kg de peso corporal, que hace posible un actividad de larga duración de varias semanas a varios meses, que es completamente sorprendente.

25 **[0177]** El compuesto de fórmula I también pueden estar contenido en un material que proporciona liberación controlada. Por ejemplo, el compuesto según la invención pueden estar contenido en microesferas, gránulos o implantes que hacen posible la liberación por difusión y/o erosión.

30 **[0178]** Una composición liberable con una dosis seleccionada de los intervalos que consisten en entre aproximadamente 1 y aproximadamente 50 mg/kg, aproximadamente 10 y aproximadamente 30 mg/kg, y 20 mg/kg de peso corporal, por consiguiente hace posible una actividad de larga duración durante varios meses, incluso un año.

35 **[0179]** En una realización de la descripción para administración por vía parenteral, las formulaciones de liberación controlada son mediante inyección que es adecuada para el caso de gatos u otros animales con metabolización rápida.

40 **[0180]** En una realización de la descripción para composiciones del paso transcutáneo, la composición puede comprender las formas en partículas o liposomales anteriormente mencionadas, en combinación con un promotor de la absorción.

**[0181]** En una realización de la descripción, la composición según la descripción también puede comprender al menos otro componente parasiticida relevante, tal como un insecticida, acaricida, parasiticida, etc.

45 **[0182]** En una realización de la descripción, el otro parasiticida es una parasiticida endectocida de tipo lactona macrocíclica. Este parasiticida de tipo lactona macrocíclica incluye, pero no se limita a, avermectinas y derivados de las mismas, que incluyen, pero no se limita a, abamectina, dimadectina, doramectina, emamectina, eprinomectina, ivermectina, latidectina, lepimectina, selamectina y milbemicina, y derivados de las mismas, que incluyen, pero no se limitan a, milbemectina, moxidectina, nemedectina y milbemicina D.

50 **[0183]** La serie de compuestos de avermectina y milbemicina son potentes agentes antihelmínticos y antiparasíticos contra una amplia gama de parásitos internos y externos. Los compuestos que pertenecen a esta serie son tanto productos naturales como son derivados semi-sintéticos de los mismos. La estructura de estas dos series de compuestos están estrechamente relacionadas y ambas comparten un anillo de lactona macrocíclico de 16 miembros complejo; sin embargo, la milbemicina no contiene el sustituyente aglicona en la posición 13 del anillo de lactona. El producto natural avermectinas se desvelan en la patente de EE.UU. 4.310.519 a Albers-Schonberg, et al., y los compuestos de 22,23-dihidroavermectina se desvelan en Chabala, et al., patente de EE.UU. 4.199.569. Para una discusión general de avermectinas, que incluyen una discusión de sus usos en seres humanos y animales, véase "Ivermectin and Abamectin," W.C. Campbell, ed., Springer-Verlag, New York (1989). Las milbemicinas que existen de forma natural se describen en Aoki et al., patente de EE.UU. 3.950.360, además de en las diversas

- referencias citadas en "The Merck Index" 12<sup>th</sup> ed., S. Budavari, Ed., Merck & Co., Inc. Whitehouse Station, New Jersey (1996). Los derivados semisintéticos de estas clases de compuestos son muy conocidos en la técnica y se describen, por ejemplo, en la patente de EE.UU. 5.077.308, la patente de EE.UU. 4.859.657, la patente de EE.UU. 4.963.582, la patente de EE.UU. 4.855.317, la patente de EE.UU. 4.871.719, la patente de EE.UU. 4.874.749, la
- 5 patente de EE.UU. 4.427.663, la patente de EE.UU. 4.310.519, la patente de EE.UU. 4.199.569, la patente de EE.UU. 5.055.596, la patente de EE.UU. 4.973.711, la patente de EE.UU. 4.978.677 y la patente de EE.UU. 4.920.148. Compuestos especialmente preferidos incluyen ivermectina, emamectina, abamectina, eprinomectina y selamectina.
- 10 **[0184]** Otra clase de compuestos que pueden incluirse en las formulaciones inventivas o procedimientos es reguladores del crecimiento de insectos (IGR). Los compuestos que pertenecen a este grupo son muy conocidos para el profesional y representan una amplia gama de clases químicas diferentes. Estos compuestos actúan todos interfiriendo con el desarrollo o crecimiento de las plagas de insectos. Ya se conocen compuestos con un efecto ovicida y/o larvicida sobre los estadios inmaduros de diversos ectoparásitos, por ejemplo, de la patente de EE.UU.
- 15 N.º 5.439.924. Entre estos compuestos descritos están aquellos compuestos IGR que actúan tanto bloqueando el desarrollo de los estadios inmaduros (huevos y larvas) dentro de estadios de adulto, como inhibiendo la síntesis de quitina. Los reguladores del crecimiento de insectos se describen, por ejemplo, en la patente de EE.UU. 3.748.356; la patente de EE.UU. 3.818.047; la patente de EE.UU. 4.225.598; la patente de EE.UU. 4.798.837; y la patente de EE.UU. 4.751.225, además de en los documentos EP 179.022 o U.K. 2.140.010. La patente francesa N.º A-
- 20 2.713.889, que generalmente describe una combinación de IGR que comprende al menos un compuesto con actividad de la hormona juvenil e inhibidores de la síntesis de quitina, con al menos uno de tres compuestos de N-arildiazol, en particular fipronil, para controlar muchos insectos perjudiciales que pertenecen a órdenes muy variados.
- [0185]** La cantidad eficaz del endectocida en una dosis está seleccionada de un intervalo que consiste en entre
- 25 aproximadamente 0,1 mg/kg y aproximadamente 200 mg/kg y de aproximadamente 1 a aproximadamente 200 mg/kg de peso del animal.
- [0186]** Ejemplos de IGR que pueden usarse en la formulación de la presente invención incluyen compuestos que imitan a hormonas juveniles, en particular:
- 30 Azadiractina - Agridyne
- Diofenolan (Ciba Geigy)
- 35 Fenoxicarb (Ciba Geigy)
- Hidropreno (Sandoz)
- Kinopreno (Sandoz)
- 40 Metopreno (Sandoz)
- Piriproxifeno (Sumitomo/Mgk)
- 45 Tetrahidroazadiractina (Agridyne)
- 4-Cloro-2-(2-cloro-2-metilpropil)-5-(6-yodo-3-piridilmetoxi)piridizin-3(2H)-ona e inhibidores de la síntesis de quitina, en particular:
- 50 clorfluazuron (Ishihara Sangyo)
- ciromazina (Ciba Geigy)
- diflubenzuron (Solvay Duphar)
- 55 fluazuron (Ciba Geigy)
- flucicloخورon (Solvay Duphar)

flufenoxuron (Cyanamid)

hexaflumuron (Dow Elanco)

5 lufenuron (Ciba Geigy)

tebufenozida (Rohm & Haas)

teflubenzuron (Cyanamid)

10

triflumuron (Bayer)

definiéndose estos compuestos por su nombre común internacional (The Pesticide Manual, 10ª edición, 1994, Ed. Clive Tomlin, Gran Bretaña).

15

**[0187]** Los inhibidores de la síntesis de quitina también incluyen compuestos tales como 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-(2-fluoro-4-(trifluorometil)fenilurea, 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-(2-fluoro-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenilurea y 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-(2-fluoro-4-trifluorometil)fenilurea. Novaluron (Isagro, empresa italiana) también es un ejemplo de un IGR.

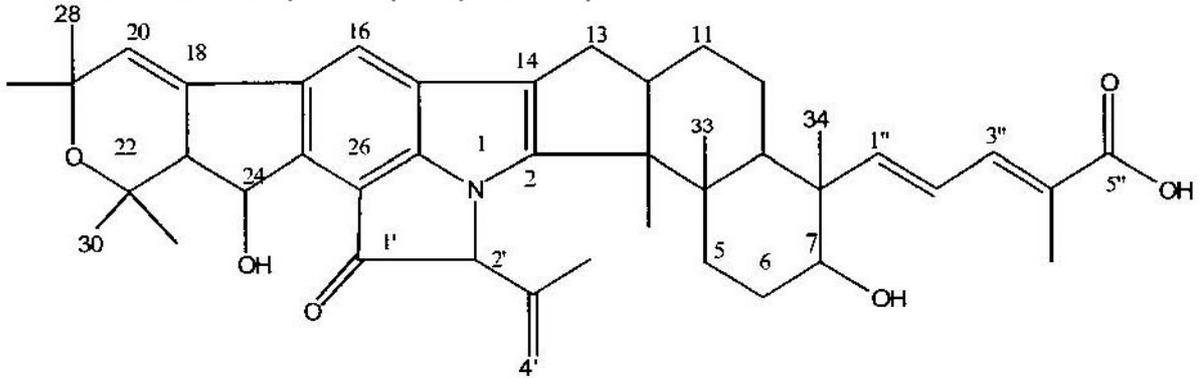
20

**[0188]** IGR especialmente preferidos incluyen metoprenos, piriproxifenos, hidropreno, ciromazina, lufenuron, 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-(2-fluoro-4-(trifluorometil)fenilurea y novaluron.

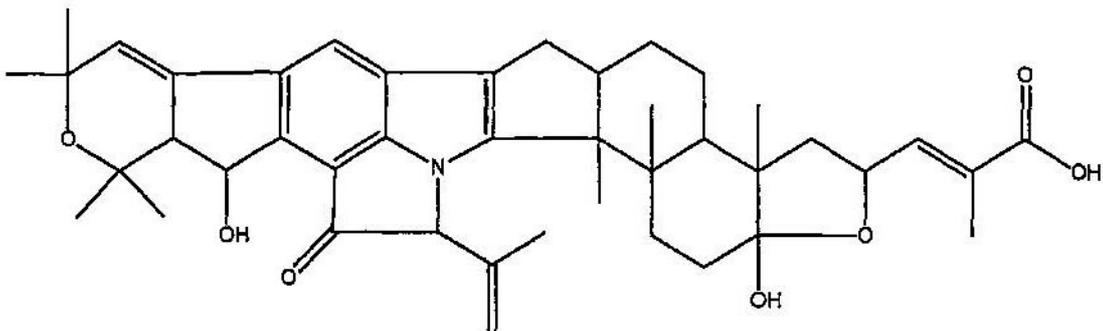
25

**[0189]** También se contemplan, por ejemplo, ácido nodulispórico o derivados del ácido nodulispórico. El ácido nodulispórico y los derivados del ácido nodulispórico se conocen en la técnica como una clase de compuestos que son potentes agentes endo- y ectoantiparasíticos. Estos compuestos se basan en tres estructuras, A, B o C, que tienen las siguientes estructuras:

ácido nodulispórico (compuesto A)

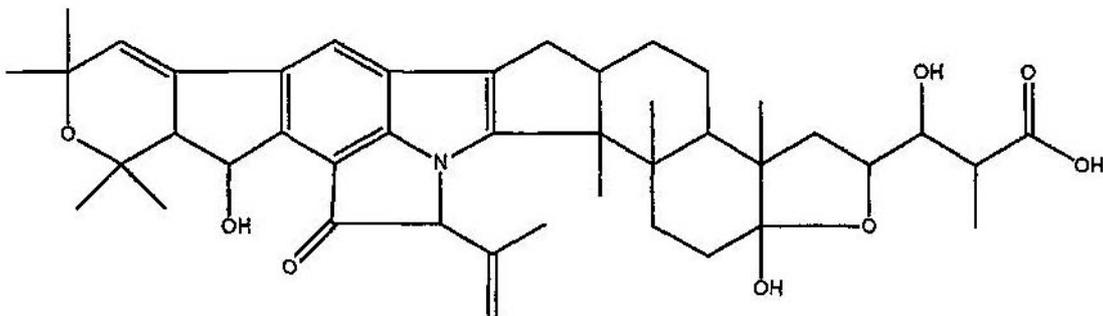


ácido 29,30-dihidro-20,30-oxa-nodulispórico (compuesto B)



y

ácido 31-hidroxi-20,30-oxa-29,30,31,32-tetrahidro-nodulispórico (compuesto C)

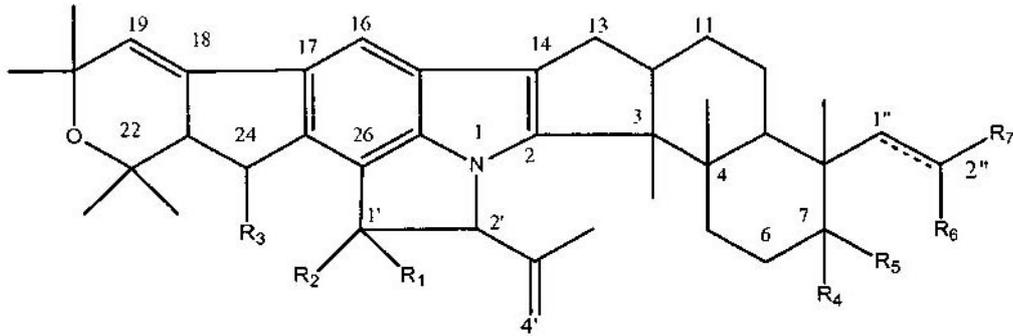


5

[0190] Estos compuestos se obtuvieron del cultivo de fermentación de *Nodulisporium* sp. MF-5954 (ATCC 74245) y el aislamiento y purificación de los tres ácidos nodulispóricos se desvelan en la patente de EE.UU. 5.399.582. Derivados de estos compuestos se describen en el documento WO 96/29073 y las patentes de EE.UU. N.º 5.945.317; 5.962.499; 5.834.260; 6.399.796; 6.221.894; 6.136.838; 5.595.991; 5.299.582; y 5.614.546.

**[0191]** Esta descripción incluye todos los derivados del ácido nodulispórico conocidos en la técnica, que incluyen todos los estereoisómeros, tales como aquellos descritos en las publicaciones anteriores descritas anteriormente. Especialmente se prefieren las formulaciones de aplicación transcutánea que comprenden derivados del ácido nodulispórico de fórmula.

5



**I'**

en la que

10 R<sub>1</sub> es

(1) hidrógeno,

(2) alquilo opcionalmente sustituido,

15

(3) alquenilo opcionalmente sustituido,

(4) alquinilo opcionalmente sustituido,

20 (5) cicloalquilo opcionalmente sustituido,

(6) cicloalquenilo opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes en el alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo y cicloalquenilo son 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de

25 (i) alquilo,

(ii) alquilo, en el que X es O o S(O)<sub>m</sub>.

(iii) cicloalquilo,

30

(iv) hidroxilo,

(v) halógeno,

35 (vi) ciano,

(vii) carboxi,

(viii) NY<sup>1</sup>Y<sup>2</sup>, en el que Y<sup>1</sup> y Y<sup>2</sup> son independientemente H o alquilo,

40

(ix) alcanoilamino, y

(x) aroilamino, en el que dicho aroilo está opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos independientemente

seleccionados de R<sup>f</sup>

(7) arilo o arilalquilo, en el que dicho arilo está opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de R<sup>f</sup>,

5

(8) perfluoroalquilo

(9) un heterociclo de 5 o 6 miembros que contiene de 1 a 4 heteroátomos independientemente seleccionados de átomos de oxígeno, azufre y de nitrógeno opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de hidroxilo, oxo, alquilo y halógeno, y que puede estar saturado o parcialmente insaturado,

10

R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> son independientemente OR<sup>a</sup>, OCO<sub>2</sub>R<sup>b</sup>, OC(O)NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>; o

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> representan =O, =NOR<sup>a</sup> o =N-NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>;

15

R<sub>5</sub> y R<sub>6</sub> son H; o

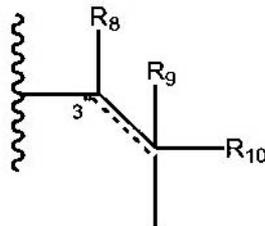
R<sub>5</sub> y R<sub>6</sub> juntos representan -O-;

20 R<sub>7</sub> es

(1) CHO, o

(2) el fragmento

25



R<sub>8</sub> es

30 (1) H,

(2) OR<sup>a</sup>, o

(3) NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>

35

R<sub>9</sub> es

(1) H, o

40 (2) OR<sup>a</sup>;

R<sub>10</sub> es

(1) CN,

45

(2) C(O)OR<sup>b</sup>,

(3) C(O)N(OR<sup>b</sup>)R<sup>c</sup>,

50 (4) C(O)NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>,

- (5) NHC(O)OR<sup>b</sup>,
- (6) NHC(O)NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>,
- 5 (7) CH<sub>2</sub>OR<sup>a</sup>,
- (8) CH<sub>2</sub>OCO<sub>2</sub>R<sup>b</sup>,
- 10 (9) CH<sub>2</sub>OC(O)NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>,
- (10) C(O)NR<sup>c</sup>NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>, o
- (11) C(O)NR<sup>c</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>b</sup>; ----- representa un enlace sencillo o un doble enlace;
- 15 R<sup>a</sup> es
- (1) hidrógeno,
- 20 (2) alquilo opcionalmente sustituido,
- (3) alquenilo opcionalmente sustituido,
- (4) alquinilo opcionalmente sustituido,
- 25 (5) alcanoílo opcionalmente sustituido,
- (6) alquenoílo opcionalmente sustituido,
- 30 (7) alquinoílo opcionalmente sustituido,
- (8) aroílo opcionalmente sustituido,
- (9) arilo opcionalmente sustituido,
- 35 (10) cicloalcanoílo opcionalmente sustituido,
- (11) cicloalquenoílo opcionalmente sustituido,
- 40 (12) alquilsulfonilo opcionalmente sustituido,
- (13) cicloalquilo opcionalmente sustituido,
- (14) cicloalquenilo opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes en el alquilo, alquenilo, alquinilo, alcanoílo, alquenoílo, alquinoílo, aroílo, arilo, cicloalcanoílo, cicloalquenoílo, alquilsulfonilo, cicloalquilo y cicloalquenilo son de 1 a 10 grupos independientemente seleccionados de hidroxilo, alcoxi, cicloalquilo, arilalcoxi, NR<sup>g</sup>R<sup>h</sup>, CO<sub>2</sub>R<sup>b</sup>, CONR<sup>c</sup>R<sup>d</sup> y halógeno,
- 45 (15) perfluoroalquilo,
- 50 (16) arilsulfonilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de alquilo, perfluoroalquilo, nitro, halógeno y ciano,
- (17) un heterociclo de 5 o 6 miembros que contiene 1 a 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno opcionalmente sustituido con 1 a 4 grupos independientemente seleccionados de alquilo, alquenilo, perfluoroalquilo, amino, C(O)NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>, ciano, CO<sub>2</sub>R<sup>b</sup> y halógeno, y que puede estar saturado o parcialmente insaturado;
- R<sup>b</sup> es

- (1) H,
- 5 (2) arilo opcionalmente sustituido,
- (3) alquilo opcionalmente sustituido,
- (4) alquenilo opcionalmente sustituido,
- 10 (5) alquinilo opcionalmente sustituido,
- (6) cicloalquilo opcionalmente sustituido,
- 15 (7) cicloalquenilo opcionalmente sustituido, o
- (8) heterociclo opcionalmente sustituido que contiene de 1 a 4 heteroátomos independientemente seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno; en el que los sustituyentes en el arilo, alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, heterociclo o alquinilo son de 1 a 10 grupos independientemente seleccionados de
- 20 (i) hidroxil,
- (ii) alquilo,
- (iii) oxo,
- 25 (iv)  $\text{SO}_2\text{NR}^g\text{R}^h$ ,
- (v) arilalcoxi,
- 30 (vi) hidroxialquilo,
- (vii) alcoxi,
- (viii) hidroxialcoxi,
- 35 (ix) aminoalcoxi,
- (x) ciano,
- 40 (xi) mercapto,
- (xii) alquil-S(O)<sub>m</sub>,
- (xiii) cicloalquilo opcionalmente sustituido con 1 a 4 grupos independientemente seleccionados de R<sup>e</sup>,
- 45 (xiv) cicloalquenilo,
- (xv) halógeno,
- 50 (xvi) alcanoiloxi,
- (xvii)  $\text{C(O)NR}^g\text{R}^h$ ,
- (xviii)  $\text{CO}_2\text{R}^i$ ,
- 55 (xix) formilo,
- (xx)  $-\text{NR}^g\text{R}^h$ ,

(xxi) heterociclo de 5 a 9 miembros, que puede estar saturado o parcialmente insaturado, que contiene de 1 a 4 heteroátomos independientemente seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno, y opcionalmente sustituido con 1 a 5 grupos independientemente seleccionados de R<sup>e</sup>,

5 (xxii) arilo opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes de arilo son 1,2-metilendioxi o 1 a 5 grupos independientemente seleccionados de R<sup>e</sup>,

(xxiii) arilalcoxi opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes de arilo son 1,2-metilendioxi o 1 a 5 grupos independientemente seleccionados de R<sup>e</sup>, y

10

(xxiv) perfluoroalquilo;

R<sup>c</sup> y R<sup>d</sup> están seleccionados independientemente de R<sup>b</sup>; o

15 R<sup>c</sup> y R<sup>d</sup> junto con el N al que están unidos forman un anillo de 3 a 10 miembros que contiene 0 a 2 heteroátomos adicionales seleccionados de O, S(O)<sub>m</sub> y N, opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de R<sup>g</sup>, hidroxilo, tioxi y oxo;

R<sup>e</sup> es

20

(1) halógeno,

(2) alquilo,

25 (3) perfluoroalquilo,

(4) -S(O)<sub>m</sub>R<sup>i</sup>,

(5) ciano,

30

(6) nitro,

(7) R<sub>10</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>v</sub>-,

35 (8) R<sup>i</sup>CO<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>v</sub>-,

(9) R<sup>i</sup>OCO(CH<sub>2</sub>)<sub>v</sub>-,

(10) arilo opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes son de 1 a 3 de halógeno, alquilo, alcoxi o hidroxilo,

40

(11) SO<sub>2</sub>NR<sup>g</sup>R<sup>h</sup>, o

(12) amino;

45 R<sup>f</sup> es

(1) alquilo,

(2) X-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, en el que X es O o S(O)<sub>m</sub>,

50

(3) alqueno,

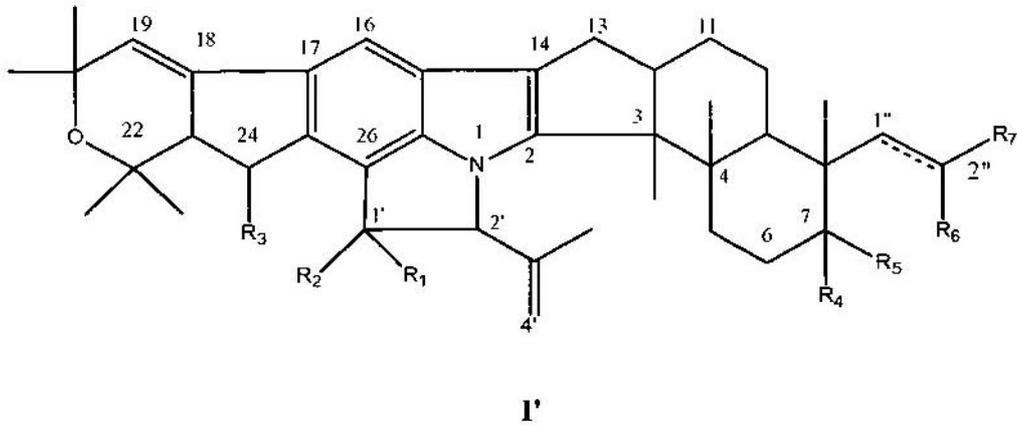
(4) alquino,

55 (5) perfluoroalquilo,

(6) NY<sup>1</sup>Y<sup>2</sup>, en el que Y<sup>1</sup> y Y<sup>2</sup> son independientemente H o alquilo,

(7) hidroxilo,

- (8) halógeno, y
- (9) alcanoilamino,
- 5 R<sup>g</sup> y R<sup>h</sup> son independientemente
- (1) hidrógeno,
- 10 (2) alquilo opcionalmente sustituido con hidroxilo, amino o CO<sub>2</sub>R<sup>l</sup>
- (3) arilo opcionalmente sustituido con halógeno, 1,2-metilendioxi, alcoxi, alquilo o perfluoroalquilo,
- (4) arilalquilo, en el que el arilo está opcionalmente sustituido con perfluoroalquilo o 1,2-metilendioxi;
- 15 (5) alcoxicarbonilo,
- (6) alcanoilo,
- 20 (7) alcanoilalquilo,
- (9) arilo alcoxicarbonilo,
- (10) aminocarbonilo,
- 25 (11) monoalquilaminocarbonilo
- (12) dialquilaminocarbonilo; o
- 30 R<sup>g</sup> y R<sup>h</sup> junto con el N al que están unidos forman un anillo de 3 a 7 miembros que contiene 0 a 2 heteroátomos adicionales seleccionados de O, S(O)<sub>m</sub> y N, opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de R<sup>e</sup> y oxo;
- R<sup>l</sup> es
- 35 (1) hidrógeno,
- (2) perfluoroalquilo,
- 40 (3) alquilo,
- (4) arilo o arilalquilo opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes de arilo son de 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de halógeno, alquilo, alcoxi e hidroxilo;
- 45 m es 0 a 2; y
- v es 0 a 3; o
- una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos.
- 50 **[0192]** En una realización preferida, la presente descripción proporciona formulaciones que comprenden compuestos de fórmula I'



I'

en la que

5 R<sub>1</sub> es

(1) hidrógeno,

(2) alquilo opcionalmente sustituido,

10

(3) alquenilo opcionalmente sustituido,

(4) alquinilo opcionalmente sustituido,

15 (5) cicloalquilo opcionalmente sustituido,

(6) cicloalquenilo opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes en el alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo y cicloalquenilo son 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de

20 (i) alquilo,

(ii) X-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, en el que X es O o S(O)<sub>m</sub>,

(iii) cicloalquilo,

25

(iv) hidroxilo,

(v) halógeno,

30 (vi) ciano,

(vii) carboxi, y

(viii) NY<sup>1</sup>Y<sup>2</sup>, en el que Y<sup>1</sup> y Y<sup>2</sup> son independientemente H o alquilo,

35

(7) arilo o arilalquilo, en el que dicho arilo está opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de R<sup>f</sup>,

(8) perfluoroalquilo,

40

(9) un heterociclo de 5 o 6 miembros que contiene de 1 a 4 heteroátomos independientemente seleccionados de átomos de oxígeno, azufre y de nitrógeno opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos independientemente

seleccionados de hidroxilo, oxo, alquilo y halógeno, y que puede estar saturado o parcialmente insaturado,

R<sub>8</sub> es

- 5 (1) H,  
 (2) OH, o  
 (3) NH<sub>2</sub>;

10

R<sub>9</sub> es

(1) H o

15 (2) OH;

R<sub>10</sub> es

- 20 (1) C(O)OR<sup>b</sup>,  
 (2) C(O)N(OR<sup>b</sup>)R<sup>c</sup>,  
 (3) C(O)NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>,  
 25 (4) NHC(O)OR<sup>b</sup>,  
 (5) NHC(O)NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>,  
 30 (6) CH<sub>2</sub>OR<sup>a</sup>,  
 (7) CH<sub>2</sub>OCO<sub>2</sub>R<sup>b</sup>,  
 (8) CH<sub>2</sub>OC(O)NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>,  
 35 (9) C(O)NR<sup>c</sup>NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>, o  
 (10) C(O)NR<sup>c</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>b</sup>;

R<sup>a</sup> es

40

- (1) hidrógeno,  
 (2) opcionalmente alquilo,

45 (3) alquenoilo opcionalmente sustituido,

(4) alquinilo opcionalmente sustituido,

(5) alcanóilo opcionalmente sustituido,

50

(6) alquenoílo opcionalmente sustituido,

(7) alquinoílo opcionalmente sustituido,

55 (8) aroílo opcionalmente sustituido,

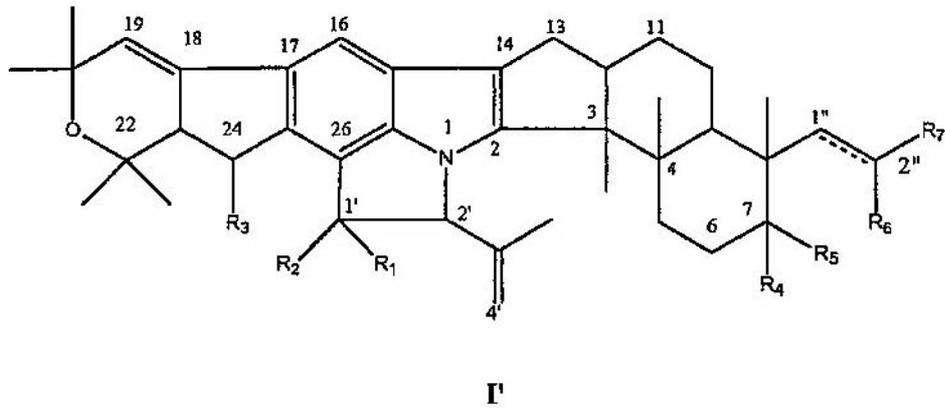
(9) arilo opcionalmente sustituido,

(10) cicloalcanoílo opcionalmente sustituido,

- (11) cicloalquenoílo opcionalmente sustituido,
- (12) alquilsulfonilo opcionalmente sustituido,
- 5 (13) cicloalquilo opcionalmente sustituido,
- (14) cicloalquenoílo opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes en el alquilo, alquenoílo, alquinoílo, aroílo, arilo, cicloalcanoílo, cicloalquenoílo, alquilsulfonilo, cicloalquilo y cicloalquenoílo son de 1 a 10 grupos independientemente seleccionados de hidroxilo, alcoxi, cicloalquilo, arilo alcoxi,  $\text{NR}^g\text{R}^h$ ,  $\text{CO}_2\text{R}^b$ ,  $\text{CONR}^c\text{R}^d$  y halógeno,
- 10 (15) perfluoroalquilo,
- 15 (16) arilsulfonilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de alquilo, perfluoroalquilo, halógeno y ciano,
- (17) un heterociclo de 5 o 6 miembros que contiene 1 a 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno opcionalmente sustituido con 1 a 4 grupos independientemente seleccionados de alquilo, alquenoílo, perfluoroalquilo, amino,  $\text{C}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ , ciano,  $\text{CO}_2\text{R}^b$  y halógeno, y que puede estar saturado o parcialmente insaturado;
- $\text{R}^b$  es
- 25 (1) H,
- (2) arilo opcionalmente sustituido,
- (3) alquilo opcionalmente sustituido,
- 30 (4) alquenoílo opcionalmente sustituido,
- (5) alquinoílo opcionalmente sustituido,
- 35 (6) cicloalquilo opcionalmente sustituido,
- (7) cicloalquenoílo opcionalmente sustituido, o
- (8) heterociclo de 5 a 10 miembros opcionalmente sustituido que contiene de 1 a 4 heteroátomos independientemente seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno; en el que los sustituyentes en el arilo, alquilo, alquenoílo, cicloalquilo, cicloalquenoílo, heterociclo o alquinoílo son de 1 a 10 grupos independientemente seleccionados de
- (i) hidroxilo,
- 45 (ii) alquilo  $\text{C}_1\text{-C}_3$ ,
- (iii) oxo,
- 50 (iv)  $\text{SO}_2\text{NR}^g\text{R}^h$ ,
- (v) arilalcoxi,
- (vi) hidroxialquilo,
- 55 (vii) alcoxi,
- (viii) hidroxialcoxi,

- (ix) aminoalcoxi,  
 (x) ciano,
- 5 (xi) perfluoroalquilo,  
 (xii) alquil-S(O)<sub>m</sub>,  
 (xiii) cicloalquilo opcionalmente sustituido con 1 a 4 grupos independientemente seleccionados de R<sup>e</sup>,
- 10 (xiv) cicloalquenilo,  
 (xv) halógeno,
- 15 (xvi) alcanoiloxi,  
 (xvii) C(O)NR<sup>g</sup>R<sup>h</sup>,  
 (xviii) CO<sub>2</sub>R<sup>i</sup>,
- 20 (xix) arilalcoxi opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes de arilo son 1,2-metilendioxi o 1 a 5 grupos independientemente seleccionados de R<sup>e</sup>,  
 (xx) -NR<sup>g</sup>R<sup>h</sup>,
- 25 (xxi) heterociclo de 5 a 6 miembros, que puede estar saturado o parcialmente insaturado, que contiene de 1 a 4 heteroátomos independientemente seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno, y opcionalmente sustituido con 1 a 5 grupos independientemente seleccionados de R<sup>e</sup>, y
- 30 (xxii) arilo opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes de arilo son 1,2-metilendioxi o 1 a 5 grupos independientemente seleccionados de R<sup>e</sup>;
- R<sup>e</sup> es
- 35 (1) halógeno,  
 (2) alquilo,  
 (3) perfluoroalquilo,
- 40 (4) -S(O)<sub>m</sub>R<sup>i</sup>,  
 (5) ciano,
- 45 (6) amino,  
 (7) R<sup>i</sup>O(CH<sub>2</sub>)<sub>v</sub>-,  
 (8) R<sup>i</sup>CO<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>v</sub>-,
- 50 (9) R<sup>i</sup>OCO(CH<sub>2</sub>)<sub>v</sub>-,  
 (10) arilo opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes son de 1 a 3 de halógeno, alquilo, alcoxi o hidroxilo,
- 55 (11) SO<sub>2</sub>NR<sup>g</sup>R<sup>h</sup>;
- R<sup>f</sup> es
- (1) metilo,

- (2) X-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, en el que X es O o S(O)<sub>m</sub>,
- (3) halógeno,
- 5 (4) acetilamino,
- (5) trifluorometilo,
- 10 (6) NY<sup>1</sup>Y<sup>2</sup>, en el que Y<sup>1</sup> y Y<sup>2</sup> son independientemente H o metilo, y
- (7) hidroxí;
- R<sup>g</sup> y R<sup>h</sup> son independientemente
- 15 (1) hidrógeno,
- (2) alquilo opcionalmente sustituido con hidroxí, amino o CO<sub>2</sub>R<sup>i</sup>
- 20 (3) arilo opcionalmente sustituido con halógeno, 1,2-metilendioxi, alcoxi, alquilo o perfluoroalquilo,
- (4) arilalquilo, en el que el arilo está opcionalmente sustituido con perfluoroalquilo o 1,2-metilendioxi;
- (5) alcoxicarbonilo,
- 25 (6) alcanóilo,
- (7) alcanóilalquilo,
- 30 (9) arilalcoxicarbonilo,
- (10) aminocarbonilo,
- (11) monoalquilaminocarbonilo
- 35 (12) dialquilaminocarbonilo; o
- R<sup>g</sup> y R<sup>h</sup> junto con el N al que están unidos forman un anillo de 5 a 6 miembros que contiene 0 a 2 heteroátomos adicionales seleccionados de O, S(O)<sub>m</sub> y N, opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos independientemente
- 40 seleccionados de R<sup>e</sup> y oxo;
- R<sup>i</sup> es
- (1) hidrógeno,
- 45 (2) perfluoroalquilo,
- (3) alquilo,
- 50 (4) arilalquilo opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes de arilo son de 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de halógeno, alquilo, alcoxi e hidroxilo.
- [0193]** En otra realización preferida, la presente descripción proporciona composiciones que comprenden compuestos de fórmula I'
- 55



en la que

5 R<sup>i</sup> es

(1) hidrógeno,

(2) alquilo opcionalmente sustituido,

10

(3) alquenilo opcionalmente sustituido,

(4) alquinilo opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes en el alquilo, alquenilo y alquinilo son 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de

15

(i) metilo,

(ii) X-metilo, en el que X es O o S(O)<sub>m</sub> y

20

(iii) halógeno,

(5) arilo o arilalquilo, en el que dicho arilo está opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de R<sup>f</sup>.

25

(6) trifluorometilo

R<sub>8</sub> es

(1) H,

30

(2) OH, o

(3) NH<sub>2</sub>

35

R<sub>9</sub> es

(1) H, o

(2) OH;

40

R<sub>10</sub> es

(1) C(O)OR<sup>b</sup>,

45

(2) C(O)N(OR<sup>b</sup>)R<sup>c</sup>,

- (3) C(O)NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>,
- (4) NHC(O)OR<sup>b</sup>,
- 5 (5) NHC(O)NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>,
- (6) CH<sub>2</sub>OR<sup>a</sup>,
- 10 (7) CH<sub>2</sub>OCO<sub>2</sub>R<sup>b</sup>,
- (8) CH<sub>2</sub>OC(O)NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>,
- (9) C(O)NR<sup>c</sup>NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>, o
- 15 (10) C(O)NR<sup>c</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>b</sup>;
- R<sup>a</sup> es
- 20 (1) hidrógeno,
- (2) alquilo opcionalmente sustituido,
- (3) alquenilo opcionalmente sustituido,
- 25 (4) alquinilo opcionalmente sustituido,
- (5) alcanóilo opcionalmente sustituido,
- 30 (6) aroílo opcionalmente sustituido,
- (7) cicloalcanóilo opcionalmente sustituido,
- (8) cicloalquenoílo opcionalmente sustituido,
- 35 (9) alquilsulfonilo opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes en el alquilo, alquenilo, alquinilo, alcanóilo, aroílo, cicloalcanóilo, cicloalquenoílo y alquilsulfonilo son de 1 a 5 grupos independientemente seleccionados de hidroxilo, alcoxi, arilo alcoxi, NR<sup>g</sup>R<sup>h</sup>, CO<sub>2</sub>R<sup>b</sup>, CONR<sup>c</sup>R<sup>d</sup> y halógeno,
- 40 (10) trifluorometilo,
- (11) arilsulfonilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de metilo, trifluorometilo y halógeno,
- 45 (12) un heterociclo de 5 o 6 miembros que contiene 1 a 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno opcionalmente sustituido con 1 a 4 grupos independientemente seleccionados de metilo, trifluorometilo, C(O)NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>, CO<sub>2</sub>R<sup>b</sup> y halógeno, y que puede estar saturado o parcialmente insaturado;
- R<sup>b</sup> es
- 50 (1) H,
- (2) arilo opcionalmente sustituido,
- 55 (3) alquilo opcionalmente sustituido,
- (4) alquenilo opcionalmente sustituido,
- (5) alquinilo opcionalmente sustituido,

- (6) cicloalquilo opcionalmente sustituido,
- (7) cicloalquenilo opcionalmente sustituido, o
- 5 (8) heterociclo de 5 a 6 miembros opcionalmente sustituido que contiene de 1 a 4 heteroátomos independientemente seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno; en el que los sustituyentes en el arilo, alquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, heterociclo o alquinilo son de 1 a 10 grupos independientemente seleccionados de
- 10 (i) hidroxilo,
- (ii) alquilo,
- (iii) oxo,
- 15 (iv)  $\text{SO}_2\text{NR}^g\text{R}^h$ ,
- (v) arilalcoxi,
- 20 (vi) hidroxialquilo,
- (vii) alcoxi,
- (viii) hidroxialcoxi,
- 25 (ix) amino alcoxi,
- (x) ciano,
- 30 (xi) alquil-S(O)<sub>m</sub>,
- (xii) cicloalquilo opcionalmente sustituido con 1 a 4 grupos independientemente seleccionados de R<sup>e</sup>,
- (xiii) cicloalquenilo,
- 35 (xiv) halógeno,
- (xv) alcanoiloxi,
- 40 (xvi)  $\text{C(O)NR}^g\text{R}^h$ ,
- (xvii)  $\text{CO}_2\text{R}^i$ ,
- (xviii)  $-\text{NR}^g\text{R}^h$ ,
- 45 (xix) heterociclo de 5 a 6 miembros, que puede estar saturado o parcialmente insaturado, que contiene de 1 a 4 heteroátomos independientemente seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno, y opcionalmente sustituido con 1 a 5 grupos independientemente seleccionados de R<sup>e</sup>,
- 50 (xx) arilo opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes de arilo son 1,2-metilendioxi o 1 a 5 grupos independientemente seleccionados de R<sup>e</sup>,
- (xxi) arilo opcionalmente sustituido alcoxi, en el que los sustituyentes de arilo son 1,2-metilendioxi o 1 a 5 grupos independientemente seleccionados de R<sup>e</sup>, y
- 55 (xxii) perfluoroalquilo;
- R<sup>e</sup> es

- (1) halógeno,
- (2) alquilo,
- 5 (3) perfluoroalquilo,
- (4)  $-S(O)_mR^i$ ,
- (5) ciano,
- 10 (6)  $R^iO(CH_2)_v-$ ,
- (7)  $R^iCO_2(CH_2)_v-$ ,
- 15 (8)  $R_{10}CO(CH_2)_v-$ ,
- (9) arilo opcionalmente sustituido en el que los sustituyentes are de 1 a 3 de halógeno, alquilo, alcoxi o hidroxilo,
- (10)  $SO_2NR^gR^h$ , o
- 20 (11) amino;
- $R^f$  es
- 25 (1) metilo,
- (2) X-alquilo  $C_1-C_2$ , en el que X es O o  $S(O)_m$ ,
- (3) trifluorometilo,
- 30 (4)  $NY^1Y^2$ , en el que  $Y^1$  y  $Y^2$  son independientemente H o metilo,
- (5) hidroxilo,
- 35 (6) halógeno, y
- (7) acetilamino,
- $R^g$  y  $R^h$  son independientemente
- 40 (1) hidrógeno,
- (2) alquilo opcionalmente sustituido con hidroxilo, amino o  $CO_2R^i$
- 45 (3) arilo opcionalmente sustituido con halógeno, 1,2-metilendioxi, alcoxi, alquilo o perfluoroalquilo,
- (4) arilalquilo, en el que el arilo está opcionalmente sustituido con perfluoroalquilo o 1,2-metilendioxi;
- (5) alcóxicarbonilo,
- 50 (6) alcanóilo,
- (7) alcanóilalquilo,
- 55 (9) arilalcóxicarbonilo,
- (10) aminocarbonilo,
- (11) monoalquilaminocarbonilo,

(12) dialquilaminocarbonilo; o

R<sup>g</sup> y R<sup>h</sup> junto con el N al que están unidos forman un anillo de 5 a 6 miembros que contiene 0 a 2 heteroátomos adicionales seleccionados de O, S(O)<sub>m</sub> y N, opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de R<sup>e</sup> y oxo;

R<sup>i</sup> es

10 (1) hidrógeno,

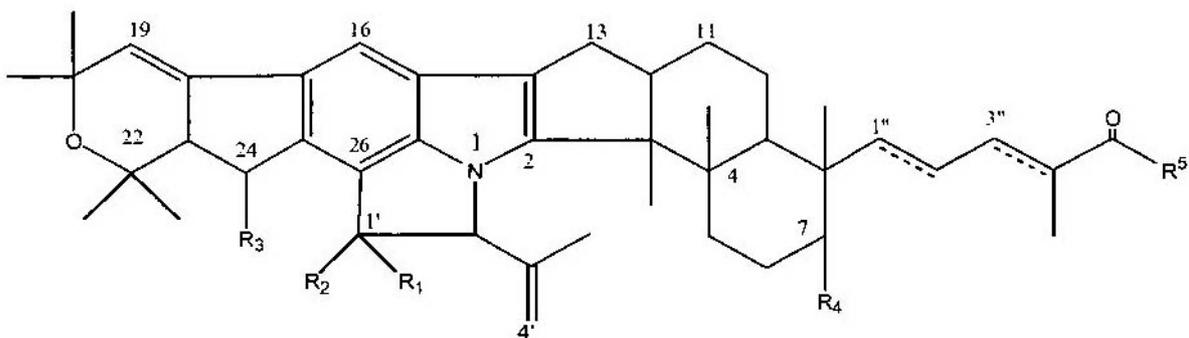
(2) perfluoroalquilo,

(3) alquilo,

15

(4) arilo o arilalquilo opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes de arilo son de 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de halógeno, alquilo, alcoxi e hidroxilo; y todas las otras variables son como se definen bajo la fórmula I' anterior. Lo más especialmente preferido son formulaciones en las que la composición comprende derivados del ácido nodulispórico que son nodulisporamidas, que son compuestos de fórmula

20



en la que R<sub>1</sub> es

25 (1) hidrógeno,

(2) alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> opcionalmente sustituido,

(3) alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub> opcionalmente sustituido,

30

(4) alquino C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub> opcionalmente sustituido,

(5) cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> opcionalmente sustituido,

35 (6) cicloalqueno C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub> opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes en el alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo y cicloalqueno son 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfonilo, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, hidroxilo, halógeno, ciano, carboxilo, amino, monoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-amino, dialquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-amino, alcanilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-amino y benzoilamino, en el que dicho benzoilo está opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, perfluoroalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, amino, hidroxilo, halógeno, monoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-amino, dialquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> y alcanilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-amino,

40 (7) fenil-alquilo C<sub>0</sub>-C<sub>5</sub>, en el que dicho fenilo está opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, perfluoroalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, amino, hidroxilo, carboxilo, halógeno, monoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-amino, dialquil C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-amino y alcanilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-amino,

45

(8) perfluoroalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>,

(9) un anillo de 5 o 6 miembros seleccionado de morfolino, piridilo y piperazino, opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de hidroxilo, oxo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> y halógeno,

5 R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> son independientemente OR<sup>a</sup>, OCO<sub>2</sub>R<sup>b</sup>, OC(O)NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>; o

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> juntos representan =O, =NOR<sup>a</sup> o =N-NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>;

R<sup>5</sup> es NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>,

10

R<sup>a</sup> es

(1) hidrógeno,

15 (2) alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> opcionalmente sustituido,

(3) alquenoilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> opcionalmente sustituido,

(4) alquinilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> opcionalmente sustituido,

20

(5) alcanóilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> opcionalmente sustituido,

(6) alquenoóilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> opcionalmente sustituido,

25 (7) alquinoóilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> opcionalmente sustituido,

(8) benzoóilo opcionalmente sustituido,

(9) fenilo opcionalmente sustituido,

30

(10) cicloalcanoóilo C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub> opcionalmente sustituido,

(11) cicloalquenoóilo C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub> opcionalmente sustituido,

35 (12) alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfonilo opcionalmente sustituido,

(13) cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> opcionalmente sustituido,

(14) cicloalquenoilo C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub> opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes en el alquilo, alquenoilo, alquinilo, alcanóilo, alquenoóilo, alquinoóilo, benzoóilo, fenilo, cicloalcanoóilo, cicloalquenoóilo, alquilsulfonilo, cicloalquilo y cicloalquenoilo son de 1 a 5 grupos independientemente seleccionados de hidroxilo, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, arilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcoxi, NR<sup>g</sup>R<sup>h</sup>, CO<sub>2</sub>R<sup>b</sup>, CONR<sup>c</sup>R<sup>d</sup> y halógeno,

(15) perfluoroalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>,

45

(16) fenilsulfonilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>, perfluoroalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>, nitro, halógeno o ciano,

(17) un anillo de 5 o 6 miembros seleccionado de piperidino, morfolino, piridilo y piperazino opcionalmente sustituido con 1 a 4 grupos independientemente seleccionados de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>, alquenoilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>, perfluoroalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>, amino, C(O)R<sup>c</sup> R<sup>d</sup>, ciano, CO<sub>2</sub>R<sup>b</sup> o halógeno;

R<sup>b</sup> es

55 (1) H,

(2) fenilo opcionalmente sustituido,

(3) alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> opcionalmente sustituido,

(4) alqueno C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> opcionalmente sustituido, o

(5) alqueno C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes en el fenilo, alquilo, alqueno o alqueno son de 1 a 5 grupos independientemente seleccionados de hidroxilo, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, halógeno, alcanilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>, C(O)NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>, CO<sub>2</sub>R<sup>b</sup>, formilo, -NR<sup>g</sup>R<sup>h</sup>, fenilo opcionalmente sustituido, y fenilalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes de fenilo son 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de R<sup>e</sup> ;

R<sup>c</sup> y R<sup>d</sup> son independientemente R<sup>b</sup>; o

10

R<sup>c</sup> y R<sup>d</sup> junto con el N al que están unidos forman un piperidino, morfolino o piperazino opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de R<sup>g</sup> y oxo;

R<sup>e</sup> es

15

(1) halógeno,

(2) alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>,

20 (3) perfluoroalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>,

(4) -S(O)<sub>m</sub>R<sup>i</sup>,

(5) ciano,

25

(6) nitro,

(7) R<sup>i</sup>O(CH<sub>2</sub>)<sub>v</sub>-,

30 (8) R<sup>i</sup>CO<sub>2</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>v</sub>,

(9) R<sup>i</sup>OCO(CH<sub>2</sub>)<sub>v</sub>-,

(10) fenilo opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes son de 1 a 3 halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o hidroxilo;

35

v es 0 a 3;

R<sup>g</sup> y R<sup>h</sup> son independientemente

40

(1) hidrógeno,

(2) alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,

45 (3) arilo,

(4) arilalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,

(5) alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-carbonilo,

50

(6) alquil C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-carbonilo, o

(7) alcanilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>; o

R<sup>g</sup> y R<sup>h</sup> junto con el N al que están unidos forman un piperidino, morfolino o piperazino opcionalmente sustituido con 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de R<sup>g</sup> y oxo;

55

R<sup>i</sup> y R<sup>j</sup> son independientemente

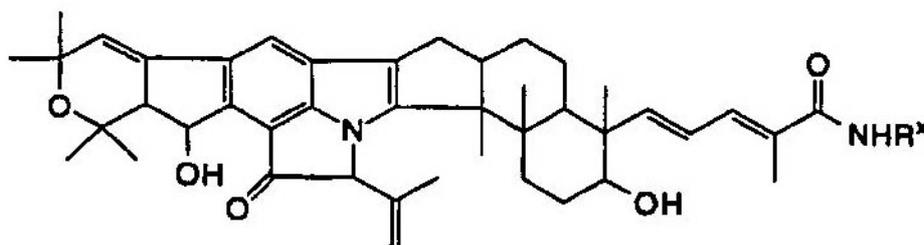
(1) hidrógeno,

(2) perfluoroalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>,

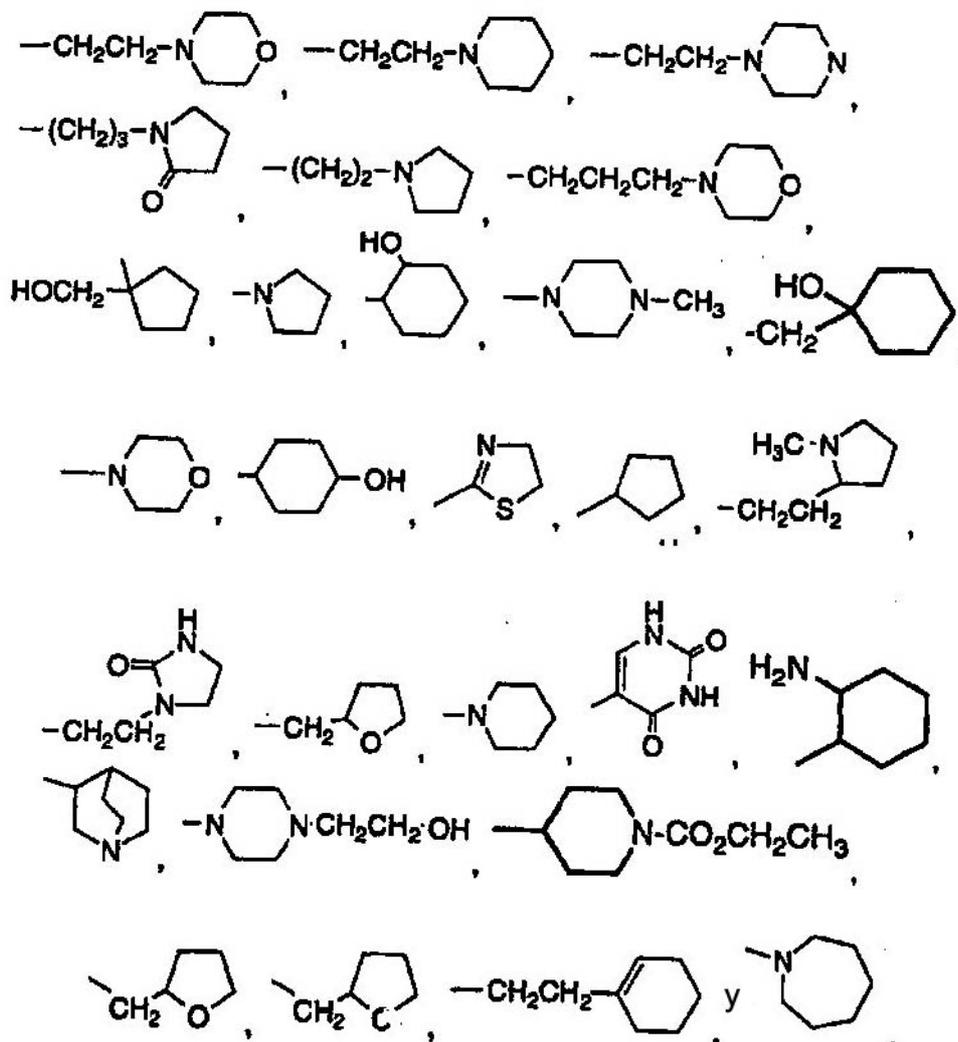
5 (3) alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> opcionalmente sustituido, en el que los sustituyentes son arilo o fenilo sustituido;

(4) fenilo o fenilo sustituido, en el que los sustituyentes son de 1 a 3 grupos independientemente seleccionados de halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o hidroxilo;

10 m es 0 a 2; o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos. Las más especialmente preferidas son composiciones que comprenden compuestos de fórmula



15 en la que R<sup>x</sup> está seleccionado del grupo que consiste en: H, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OH, CH(CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH(OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OH, CH(CH<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>OH, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>OH, (CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>OH, (CH<sub>2</sub>)SOH, CH(CH<sub>2</sub>OH)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, NHC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CN, (CH<sub>2</sub>)<sub>6</sub>OH, CH<sub>2</sub>CH(OH)CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>2</sub>OH)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CONH, CH(CH<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>OH)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OH, CH(CH<sub>2</sub>OH)(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>)CH<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SH, (CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>S(O)CH<sub>3</sub>,  
 20 CH(CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>)CH<sub>2</sub>OH, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>NH<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>N(CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH(OH)CH<sub>2</sub>OH, OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(O)CH<sub>3</sub>, C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OH, *c*-C<sub>3</sub>H<sub>5</sub>, *c*-C<sub>6</sub>H<sub>11</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH≡CH<sub>2</sub>, C(CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>OH)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>C≡CH, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, NHCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)CH<sub>3</sub>, CH(CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>C≡CH, (CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,  
 25 (CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH(CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>)CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, OCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, CH(CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>)CH<sub>2</sub>OH, CH(CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>)CH<sub>2</sub>OH, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>OH, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>OH, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)OH, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CH<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, 1-adamantilo, (CH<sub>2</sub>)<sub>8</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>NHCH<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>N(CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,



5 **[0194]** Un compuesto de nodulisporamida especialmente preferido para composiciones para el uso inventivo es uno en el que en R<sup>x</sup> es con el t-butilo (o "nodulisporamida").

En otra realización de la descripción, el otro parasiticida es un parasiticida ectocida. En una realización del parasiticida ectocida es un arilpirazol. Ejemplos de arilpirazoles adecuados son aquellos descritos en los  
10 documentos EP 295 117 (patentes de EE.UU. 5232940, 5547974, 5608077, 5714191, 5916618 y 6372774).

**[0195]** En una realización del arilpirazol, el grupo arilo está unido al grupo pirazol en la posición 1 del pirazol y el grupo arilo es un grupo fenilo sustituido. En una realización del grupo fenilo sustituido, la sustitución es en la posición 2, 4 y/o 6 del anillo de fenilo y los sustituyentes están seleccionados del grupo que consiste en alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,  
15 halógeno y haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>. En una realización del grupo pirazol, el pirazol está opcionalmente sustituido en la posición 3 con un resto seleccionado del grupo que consiste en ciano, nitro, halógeno, acetilo o formilo; está opcionalmente sustituido en la posición 4 con Z-S(O)<sub>q</sub>, en el que Z es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y q es 0, 1 o 2; y está opcionalmente sustituido en la posición 5 con un grupo amino o un amino sustituido con grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcanóilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

20

**[0196]** En otra realización adicional del compuesto de arilpirazol, el compuesto es 5-amino-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-[(trifluorometil)sulfinil]-1H-pirazol-3-carbonitrilo ("fipronil"), piriprol y pirafuprol.

**[0197]** En una realización de la composición, las proporciones en peso del parasiticida de fórmula I con respecto al parasiticida adicional están entre aproximadamente 5/1 y aproximadamente 20.000/1.

**[0198]** En una realización de la composición, el parasiticida de fórmula I y el parasiticida endectocida asociado van a estar contenidos en una preparación de liberación controlada y sostenida, tal como, por ejemplo, microesferas, gránulos o implantes. Esto puede obtenerse, por ejemplo, mezclando una preparación de liberación controlada de un ectoparasiticida, tal como fipronil, y/o una preparación de liberación controlada de endectocida, tal como ivermectina, en un vehículo adecuado, tal como agua, aceite o un triglicérido de cadena media.

10 **[0199]** En una realización de una preparación de liberación controlada tal, las formulaciones se idean preferentemente para liberar entre 5 y 100 mg/kg/día, por ejemplo, 45 mg/kg/día, de compuesto de fórmula I, y de 0,01 a 15 mg/kg/día de ectoparasiticida, por ejemplo fipronil, o, por ejemplo, 0,5 mg/kg/día de endectocida, por ejemplo ivermectina.

15 **[0200]** En el caso de tales preparaciones de liberación controlada, una dosis para un tratamiento de duración muy larga de un animal comprenderá preferentemente un compuesto de fórmula I y entre 1 y 20 mg/kg de fipronil o entre 2 mg/kg y 3 mg/kg de endectocida, en particular de ivermectina.

**[0201]** Otro objeto de la invención es el uso del compuesto anteriormente mencionado correspondiente a la fórmula I para la preparación de las composiciones capaces de ser empleadas en los procedimientos según la invención.

20 **[0202]** Las composiciones que pueden usarse en la invención pueden comprender generalmente de aproximadamente 0,001 a aproximadamente el 95 % del compuesto de fórmula I.

25 **[0203]** En una realización para la administración de la composición que comprende los compuestos de fórmula I, los compuestos se aplican en cantidades totales seleccionadas de intervalos que consisten en aproximadamente 0,5 mg/kg a aproximadamente 100 mg/kg por día y aproximadamente 1 mg/kg a aproximadamente 50 mg/kg por día.

30 **[0204]** Las preparaciones listas para uso contienen los compuestos que actúan contra parásitos, tales como ectoparásitos, en concentraciones seleccionadas de los intervalos que consisten en aproximadamente 10 ppm a aproximadamente el 80 por ciento en peso, de aproximadamente 0,1 a aproximadamente el 65 por ciento en peso, de aproximadamente el 1 a aproximadamente el 50 por ciento en peso, y de aproximadamente el 5 a aproximadamente el 40 por ciento en peso.

35 **[0205]** Preparaciones que se diluyen antes de uso contienen los compuestos que actúan contra ectoparásitos en concentraciones seleccionadas de los intervalos que consisten en aproximadamente el 0,5 a aproximadamente el 90 por ciento en peso y aproximadamente el 1 a aproximadamente el 50 por ciento en peso.

40 **[0206]** Además, las preparaciones comprenden los compuestos de fórmula I contra endoparásitos en concentraciones en intervalos seleccionados del grupo que consiste en aproximadamente 10 ppm a aproximadamente el 2 por ciento en peso, aproximadamente el 0,005 a aproximadamente el 0,9 por ciento en peso, y aproximadamente el 0,05 a aproximadamente el 0,25 por ciento en peso.

45 **[0207]** En una realización para la administración de la composición que comprende los compuestos de fórmula I, la composición se aplica por vía dérmica o tópica.

**[0208]** En otra realización de la administración de la composición que comprende los compuestos de fórmula I, la administración tópica se realiza en forma de artículos moldeados que contienen el compuesto tales como collares, medallones, marcas para las orejas, bandas para fijar en partes del cuerpo, y tiras y láminas adhesivas.

50 **[0209]** En otra realización de la administración de la composición, las composiciones son formulaciones sólidas que liberan compuestos de fórmula I en cantidades totales seleccionadas de los intervalos que consisten en aproximadamente 10 mg/kg a aproximadamente 300 mg/kg, aproximadamente 20 mg/kg a aproximadamente 200 mg/kg, y aproximadamente 25 mg/kg a aproximadamente 160 mg/kg de peso corporal del animal tratado en el transcurso de tres semanas.

**[0210]** Para la preparación de los artículos moldeados se usan termoplásticos y plásticos flexibles, además de elastómeros y elastómeros termoplásticos. Plásticos y elastómeros adecuados son resinas de polivinilo, poliuretano,

poliacrilato, resinas epoxi, celulosa, derivados de celulosa, poliamidas y poliéster que son suficientemente compatibles con los compuestos de fórmula I. Una lista detallada de plásticos y elastómeros, además de los procedimientos de preparación para los artículos moldeados, se facilita, por ejemplo, en el documento WO 03/086075 (publicación de solicitud de patente de EE.UU. 2005-214336).

5

**[0211]** Orientación adicional para preparar o administrar las composiciones antiparasitcidas pueden encontrarse en textos generales conocidos para aquellos expertos en la materia que incluyen, pero no se limitan a, Plumb's Veterinary Drug Handbook, 5ª Edición, ed. Donald C. Plumb, Blackwell Publishing, (2005) o The Merck Veterinary Manual, 9ª Edición, (enero de 2005))

10

**[0212]** La invención se describe adicionalmente por los siguientes ejemplos no limitantes que ilustran adicionalmente la invención, y no pretenden limitar, ni debe interpretarse que limiten, el alcance de la invención.

**EJEMPLOS**

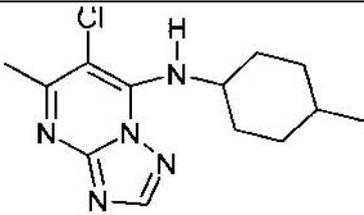
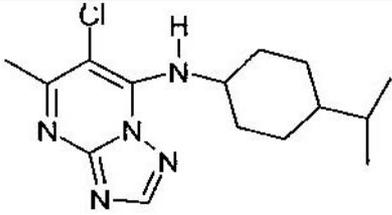
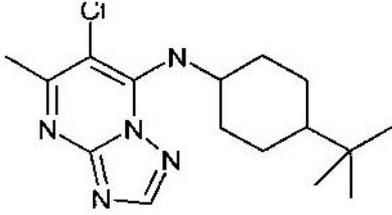
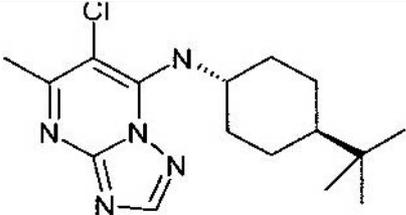
15

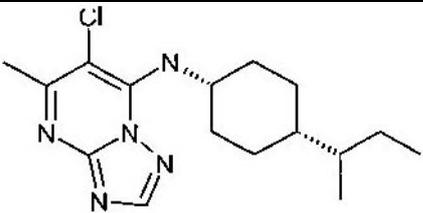
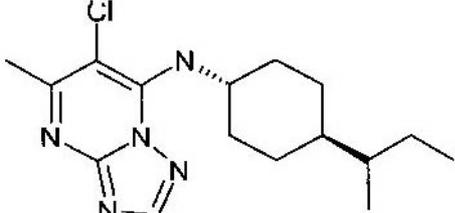
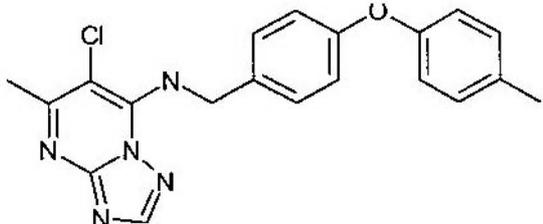
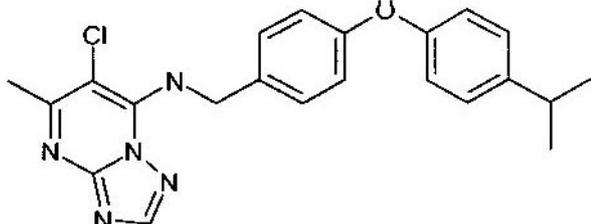
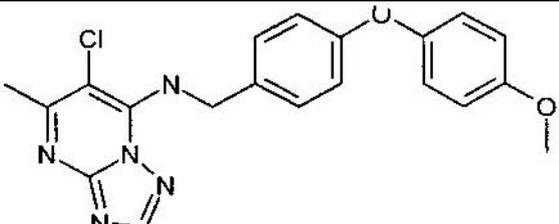
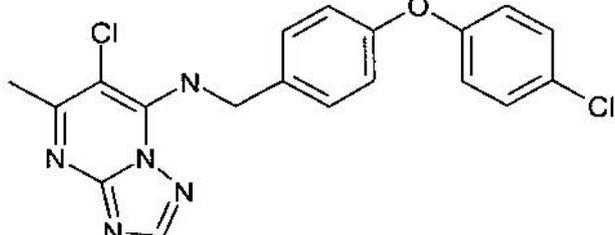
**Ejemplos de compuestos**

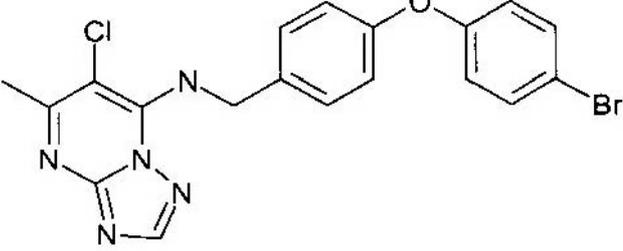
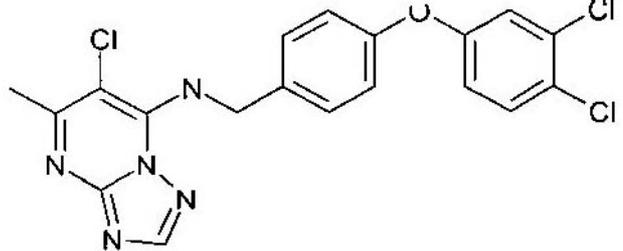
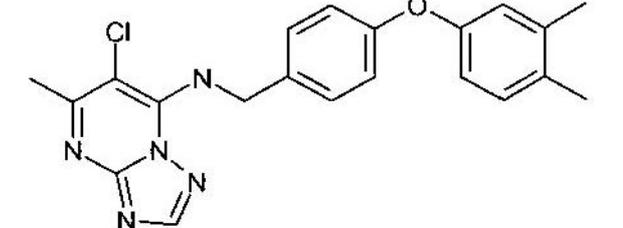
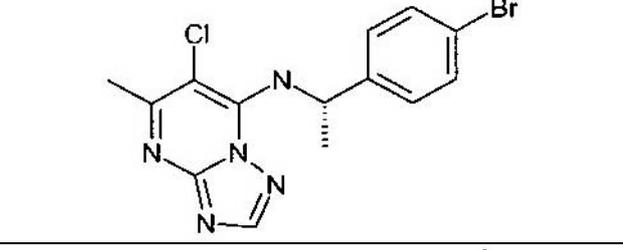
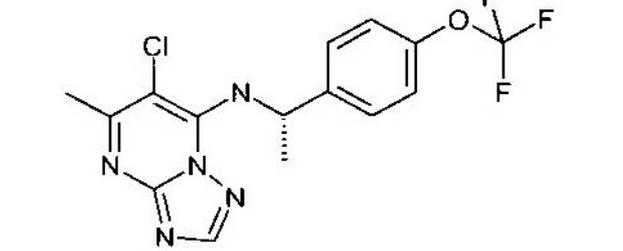
**[0213]** Ejemplos de compuestos de fórmula I se dan en la siguiente Tabla C:

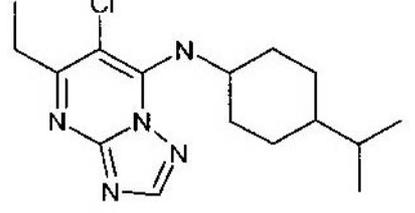
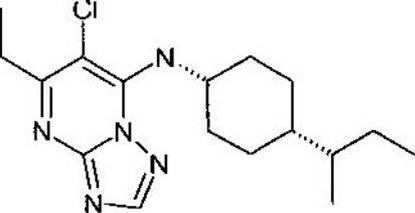
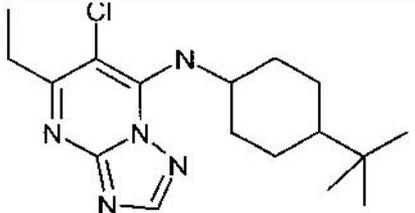
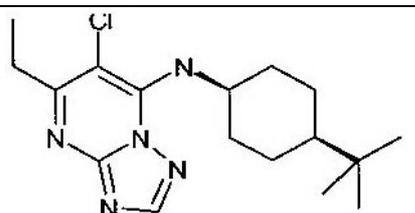
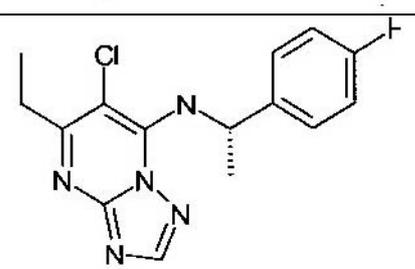
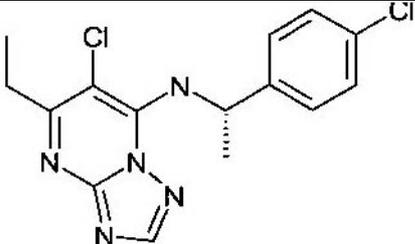
20

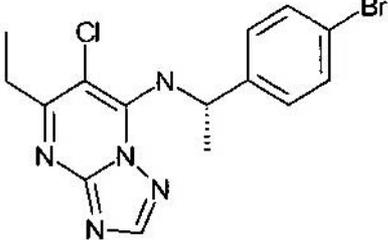
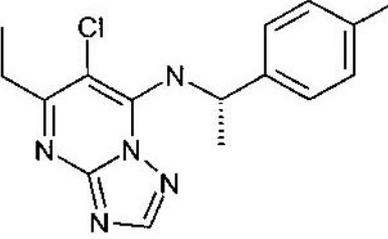
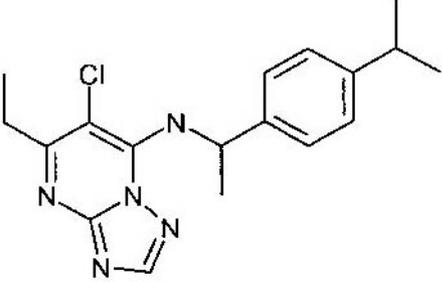
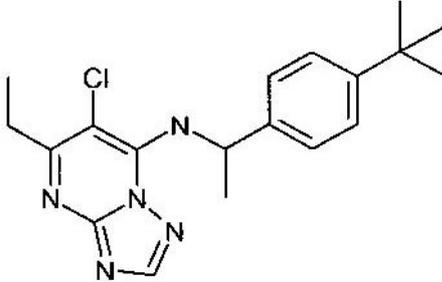
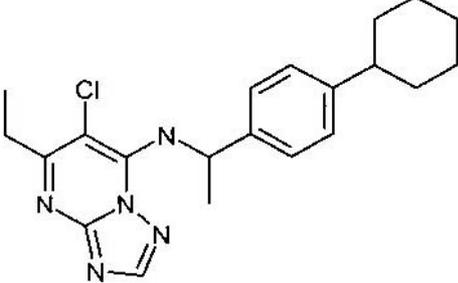
Tabla C:

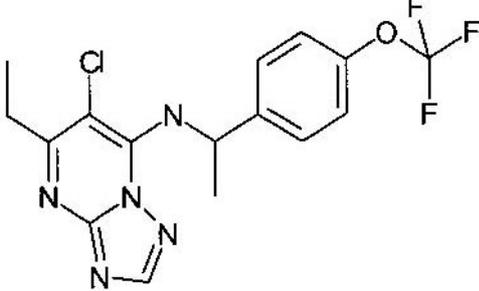
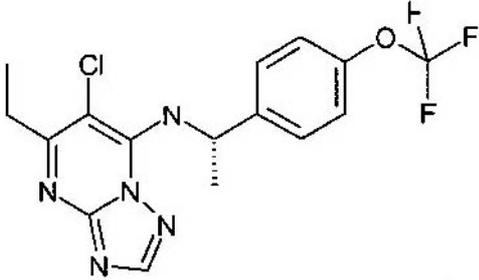
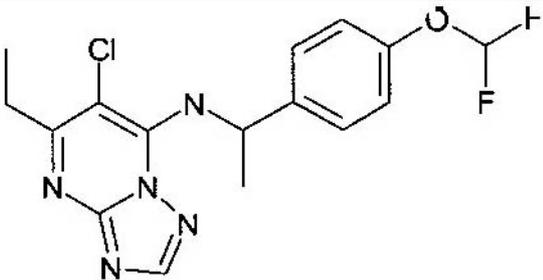
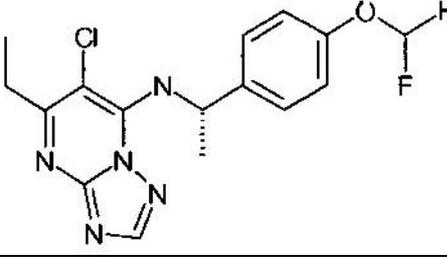
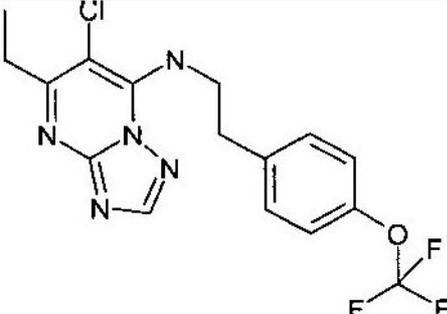
Compuesto N.º	Estructura	Comentario
C.I.1		Mezcla isomérica
C.I.2		Mezcla isomérica
C.I.3		Mezcla de isómero cis-trans
C.I.4		Isómero trans

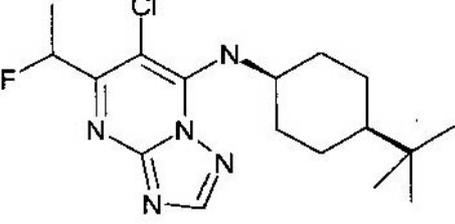
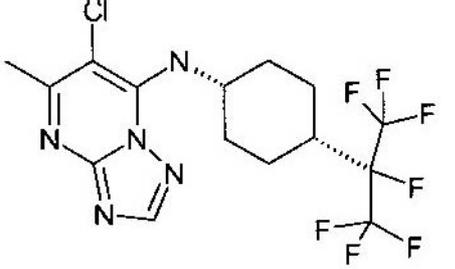
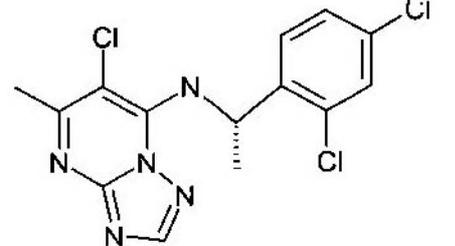
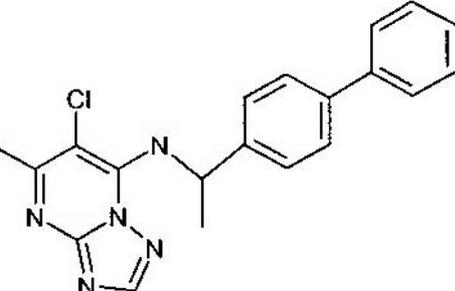
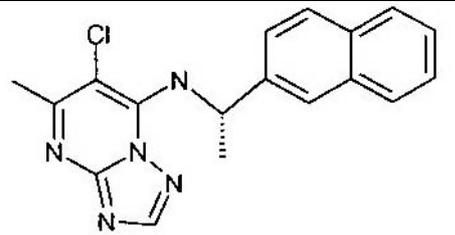
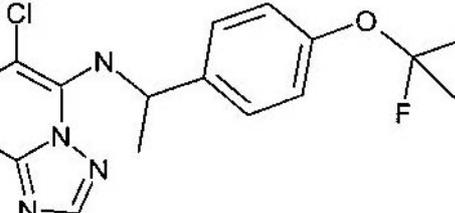
Compuesto N.º	Estructura	Comentario
C.I.5		90 % de isómero cis
C.I.6		95 % de isómero trans
C.I.7		
C.I.8		
C.I.9		
C.I.10		

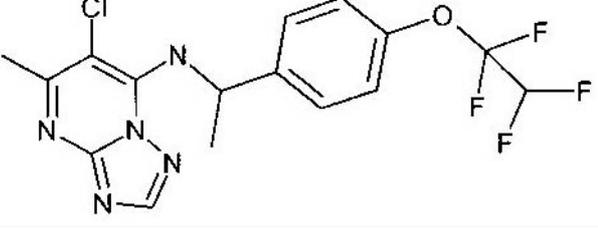
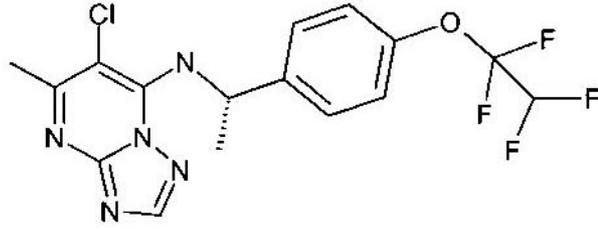
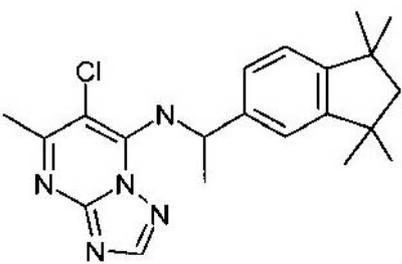
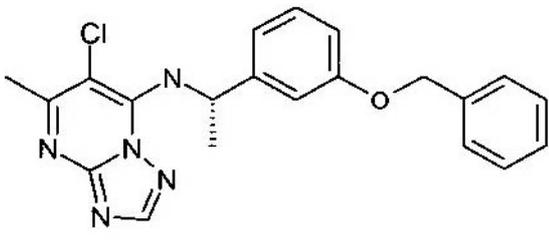
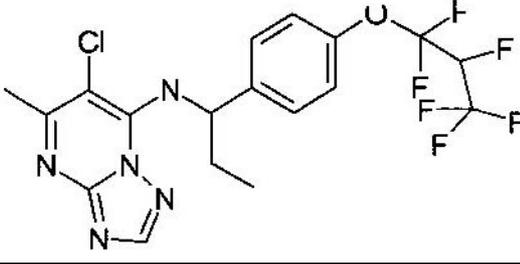
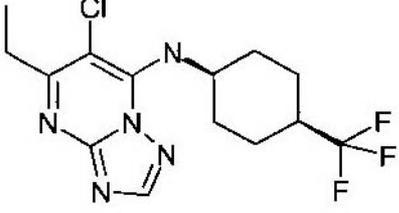
Compuesto N.º	Estructura	Comentario
C.I.11		
C.I.12		
C.I.13		
C.I.14		Enantiómero S
C.I.15		Enantiómero S
C.I.16		Mezcla de isómeros

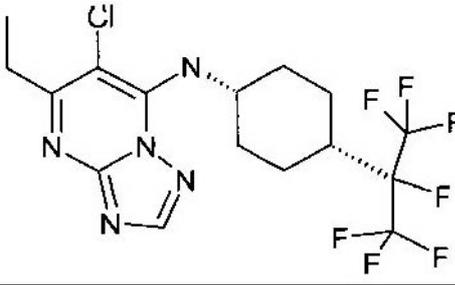
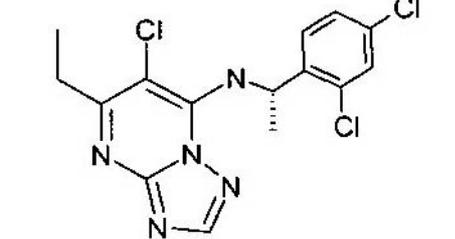
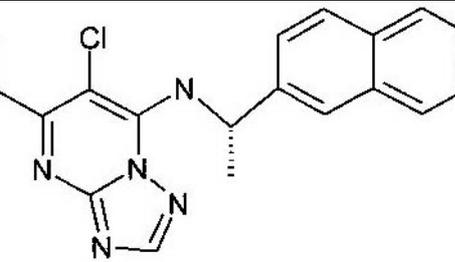
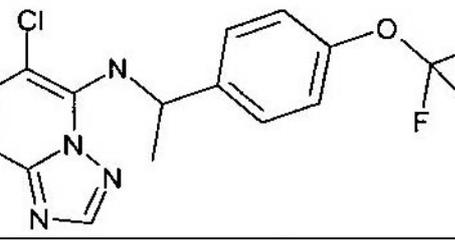
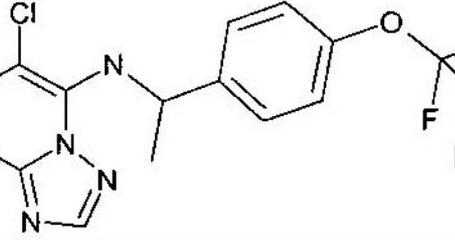
Compuesto N.º	Estructura	Comentario
C.I.17		Mezcla de isómeros
C.I.18		90 % de isómero cis
C.I.19		Mezcla de isómeros
C.I.20		Isómero cis
C.I.21		Enantiómero S
C.I.22		Enantiómero S

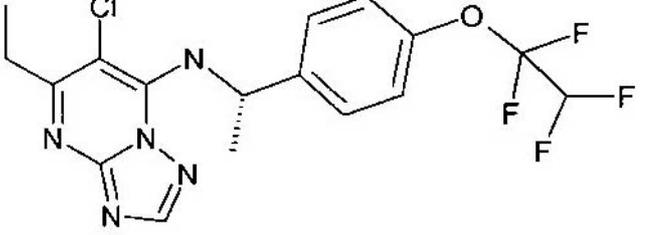
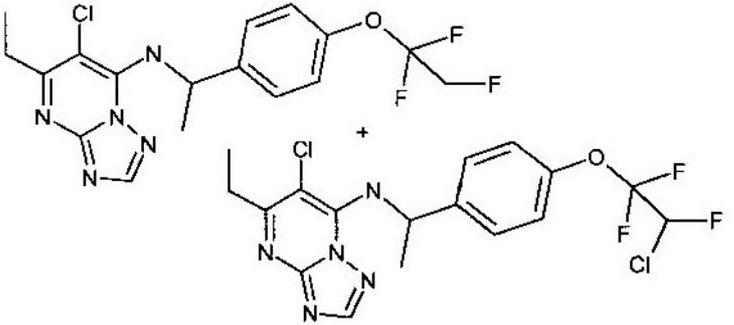
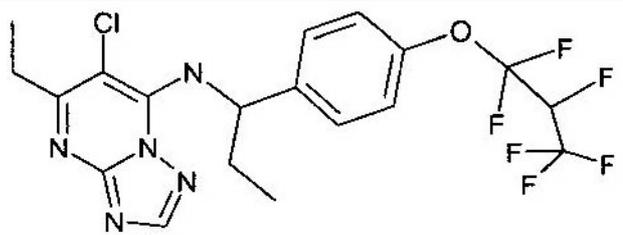
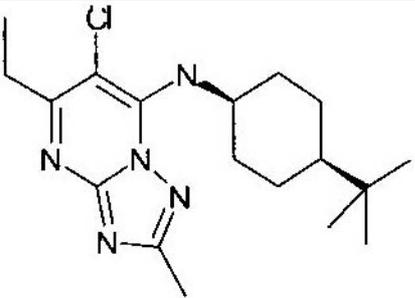
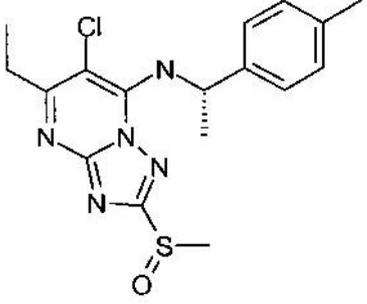
Compuesto N.º	Estructura	Comentario
C.I.23		Enantiómero S
C.I.24		Enantiómero S
C.I.25		Racemato
C.I.26		Racemato
C.I.27		Racemato

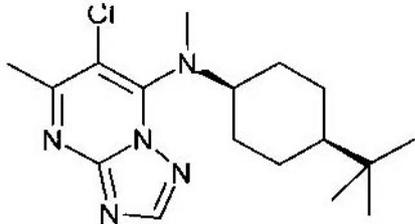
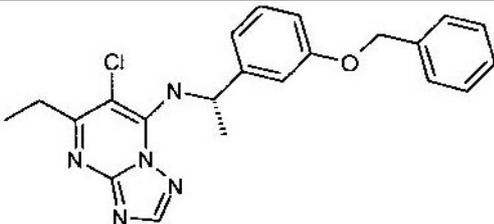
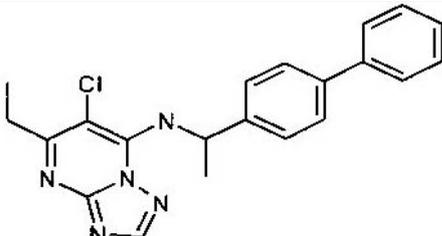
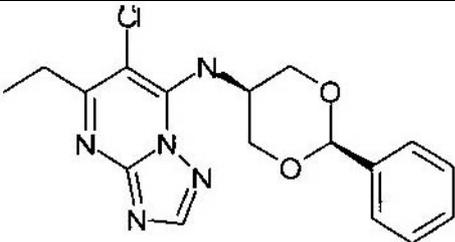
Compuesto N.º	Estructura	Comentario
C.I.28		Racemato
C.I.29		Enantiómero S
C.I.30		Racemato
C.I.31		Enantiómero S
C.I.32		

Compuesto N.º	Estructura	Comentario
C.I.33		Isómero cis
C.I.34		85 % de de isómero cis
C.I.35		Enantiómero S
C.I.36		Racemato
C.I.37		Enantiómero S
C.I.38		Racemato

Compuesto N.º	Estructura	Comentario
C.I.39		Racemato
C.I.40		Enantiómero S
C.I.41		Racemato
C.I.42		Enantiómero S
C.I.43		Mezcla de isómeros
C.I.44		Isómero cis

Compuesto N.º	Estructura	Comentario
C.I.45		Isómero cis
C.I.46		80 % de isómero cis
C.I.47		Enantiómero S
C.I.48		Enantiómero S
C.I.49		Racemato
C.I.50		Racemato

Compuesto N.º	Estructura	Comentario
C.I.51		Enantiómero S
C.I.52		Mezcla
C.I.53		Mezcla de isómeros
C.I.54	Dejado en blanco intencionalmente	
C.I.55		Isómero cis
C.I.56		Enantiómero S

Compuesto N.º	Estructura	Comentario
C.I.57		Isómero cis
C.1,58		Enantiómero S
C.I.59		Racemato
C.I.60		Isómero cis

### Ejemplos biológicos

#### B.1 Actividad contra la mosca de la fruta mediterránea (*Ceratitis capitata*)

5

**[0214]** Los compuestos se formularon en 1:3 de DMSO:agua. Se dispusieron 50 a 80 huevos dentro de placas de microtítulo llenas con 0,5 % de agar-agar y 14 % de dieta en agua. Los huevos se pulverizaron con 5 µl de la disolución de prueba, las placas se taparon con láminas perforadas y se mantuvieron a 27-29 °C y 75-85 % de humedad bajo luz fluorescente durante 6 días. La mortalidad se evaluó basándose en la agilidad de las larvas eclosionadas. Las pruebas se repitieron 2 veces. En esta prueba, los compuestos C.I de la Tabla C con N.º 22, 38, 43, 49, 53 y 55 a 2500 ppm mostraron más del 75 % de mortalidad en comparación con el 0 % de mortalidad de controles no tratados.

10

#### B.2 Actividad contra *Caenorhabditis elegans*

15

**[0215]** Los compuestos se formularon en 100 % de DMSO y se probaron en placas de microtitulación que contenían 50 µl de medio de crecimiento de nematodos, 1 % de *E. coli* y 20 L1 de *C. elegans*. La eficacia de un compuesto se determinó basándose en la motilidad de las larvas en comparación con la motilidad promedio de pocillos de control que contienen DMSO solo. Los compuestos con > 80 % de reducción en la motilidad se probaron en un ensayo de respuesta a dosis para determinar valores de CE50.

20

En esta prueba, los compuestos C.I. de la Tabla C con N.º 1, 2, 10, 11, 12, 23, 28-30, 32, 34, 40, 43, 45, 46, 49-53,

56, 58 y 59 mostraron valores de CE50 de <10 ppm.

#### B.3 Actividad contra el gusano Barber Pole (*Haemonchus contortus*)

5 **[0216]** Los compuestos se formularon en 100 % de DMSO y se probaron en placas de microtitulación que contenían 50 µl de medio de nematodos, 7 % de suspensión fecal y 20 L1 de *H. contortus*. La eficacia de un compuesto se determinó basándose en la motilidad de las larvas en comparación con la motilidad promedio de los pocillos de control que contenían DMSO solo. Se calculó un valor de MIC90 determinando la dosis más baja a la que hubo una reducción del 90 % en la motilidad en comparación con los pocillos de control.

10

En esta prueba, los compuestos C.I. de la Tabla C con N.º 10, 11, 12, 23, 28, 29, 32, 43, 45, 52, 56 y 59 mostraron un valor de MIC 90 de < 1 ppm.

#### B.4. Actividad contra el mosquito de la fiebre amarilla (*Aedes aegypti*)

15

**[0217]** Los compuestos se formularon en 100 % de DMSO y se probaron en placas de microtitulación que contenían 180 µl de 1X medio de caldo de Luria y 10 larvas neonatas de *A. aegypti*. La eficacia de un compuesto se determinó basándose en la motilidad de las larvas en comparación con la motilidad promedio de los pocillos de control que contenían DMSO solo. Los compuestos con > 80 % de reducción en la motilidad se probaron en un ensayo de respuesta a dosis para determinar valores de CE50.

20

En esta prueba, los compuestos C.I. de la Tabla C con N.º 1-11, 13-22, 25-29, 31, 33-53 y 56-60 mostraron valores de CE50 de <1 ppm.

#### 25 B.5 Actividad contra la pulga del gato (*Ctenocephalides felis*)

##### B.5.1 Ensayo de ingestión con *Ctenocephalides felis*

**[0218]** Los compuestos se formularon en 100 % de DMSO y se diluyeron con sangre de vaca fresca hasta 30 concentraciones de prueba finales de 50 ppm, 12,5 ppm, 3,125 ppm, 0,78 ppm y 0,195 ppm. Se cargaron diez *C. felis* adultos dentro de jaulas de prueba y se expusieron a sangre que contenía el compuesto de prueba durante hasta 72 horas. La sangre se cambió a intervalos de 24 horas hasta que la prueba se completó y se mantuvo a 37 ° C durante la duración de la prueba. La eficacia de un compuesto se determinó basándose en la mortalidad de *C. felis* 72 horas después del tratamiento. En esta prueba, los compuestos C.I. de la Tabla C con N.º 5, 7-9, 10, 11, 17, 35 18, 20, 31, 34, 37, 38, 42-52 y 58-60 mostraron valores de CE50 de < 50 ppm.

**[0219]** La eficacia de un compuesto también puede determinarse por los siguientes ensayos de contacto.

##### B.5.2 Ensayo de contacto con *Ctenocephalides felis*

40

**[0220]** Se formula un compuesto en 100 % de acetona a las concentraciones de compuesto de prueba finales definidas. Se dispone un limpiatubos en el fondo de un vial de centelleo de vidrio y se trata con compuesto y se deja secar durante 3-4 horas. Cada vial se infesta con 10 *C. felis* adultos. La eficacia de un compuesto se determina basándose en la mortalidad de *C. felis* hasta 72 horas después del tratamiento. También se calcula una 45 concentración eficaz sintomática (CES) para los compuestos de prueba. Este valor se genera basándose en la capacidad de un compuesto para afectar el movimiento de las pulgas; es decir, sacudidas, caerse de lado, o incapacidad para permanecer de pie.

45

##### B.6 Ensayo de contacto con *Rhipicephalus sanguineus*

50

**[0221]** Se formula un compuesto en 100 % de DMSO y se diluye en 100 % de acetona a las concentraciones de compuesto de prueba finales definidas. Los viales de vidrio se tratan con compuestos formulados y se dejan secar. Se disponen papeles de filtro en el fondo y la tapa de los viales de vidrio se trata con compuesto y se deja secar durante 3-4 horas. Cada vial se infesta con 10 *R. sanguineus* adultos. La eficacia de un compuesto se determina 55 basándose en la mortalidad de *R. sanguineus* 24 horas después del tratamiento y 48 horas después del tratamiento.

##### B.7 Estudio para evaluar la eficacia de compuestos contra pulgas y garrapatas en perros

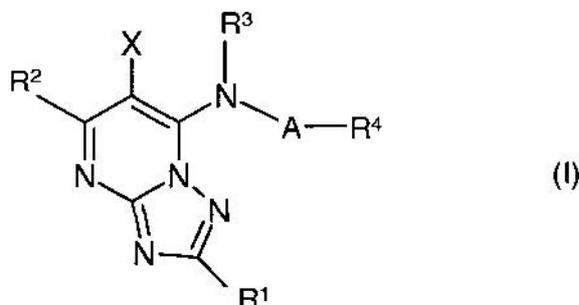
**[0222]** Se infestaron perros con 100 pulgas de gato en los días -1, 8, 15, 22, 29 y 36, y 50 garrapatas de perro

marrones en los días -1, 7 14, 21, 28 y 35. Los perros infestados reciben un tratamiento de un compuesto o placebo en forma de aplicación transcutánea aplicada en el centro del cuello entre los omóplatos. Se quitaron las pulgas y garrapatas vivas y se contaron en los días 2, 9, 16, 23, 30 y 37. El compuesto C.I. 20 de la Tabla C mostró >80 % de eficacia contra las pulgas y garrapatas en los días 9, 16 y 23 a 20 mg/kg en comparación con el grupo de placebo.

5

## REIVINDICACIONES

1. Compuesto de 6-halógeno-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pirimidina de la fórmula general I



5

en la que X es halógeno;

R<sup>1</sup> es hidrógeno, halógeno, OH, CN, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,  
 10 alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-  
 sulfonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-amino, di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)amino, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>, fenilo, fenoxi, benciloxi, alqueniloxi C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>,  
 alquiniloxi C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub> o alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>, en el que alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfinilo y alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfonilo pueden  
 estar sin sustituir o parcialmente o completamente sustituidos con halógeno, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-carbonilo o  
 COOH;

15

R<sup>2</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub> o alquinilo  
 C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>;

R<sup>3</sup> es hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-carbonilo, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-  
 20 carbonilo o arilcarbonilo;

A es un enlace sencillo o una cadena de alquileo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, en el que un grupo metileno puede estar sustituido con un  
 heteroátomo seleccionado de oxígeno o azufre;

R<sup>4</sup> es cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, fenilo, naftilo, o heterocíclico de 3 a 7 miembros, que está sin sustituir o sustituido con 1, 2 o  
 3 radicales que están seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi  
 C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, amino, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-amino, di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)amino, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>,  
 alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfonilo, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, fenilo, fenil-alcoxi C<sub>1</sub>-  
 C<sub>4</sub> y feniloxi, en el que los cinco últimos radicales mencionados por su parte pueden estar sin sustituir o pueden  
 30 llevar uno, dos o tres sustituyentes que están seleccionados del grupo que consiste en alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y  
 halógeno, y en el que el heterocíclico de 3 a 7 miembros contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados del grupo que  
 consiste en oxígeno, azufre, nitrógeno y un grupo NR<sup>a</sup>, siendo también posible que cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, fenilo y  
 heterocíclico de 3 a 7 miembros estén condensados con un anillo carbocíclico de 5 a 7 miembros saturado,  
 insaturado o aromático o con un anillo heterocíclico de 5 a 7 miembros y dicho anillo condensado puede estar sin  
 35 sustituir o puede él mismo llevar uno, dos, tres, cuatro, cinco o seis sustituyentes que están seleccionados del grupo  
 que consiste en halógeno y alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; en el que R<sup>a</sup> es hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> o alquinilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;  
 y/o un enantiómero, diaestereómero o sal veterinariamente aceptable del mismo para su uso en el tratamiento,  
 control, prevención o protección contra infestación o infección por parásitos en el que el compuesto es para  
 administración oral, tópica o parenteral a un animal.

40

2. Un compuesto para su uso según la reivindicación 1, en el que en compuestos de fórmula I, A es un  
 enlace sencillo.

3. Un compuesto para su uso según la reivindicación 1, en el que en compuestos de fórmula I, A es una  
 45 cadena de alquileo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>.

4. Un compuesto para su uso según la reivindicación 1, en el que en compuestos de fórmula I, A es CH<sub>2</sub>,  
 C<sub>2</sub>H<sub>4</sub>, CH(CH<sub>3</sub>) o CH(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>).

5. Un compuesto para su uso según cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que en compuestos de fórmula I el radical
- 5 R<sup>4</sup> está seleccionado de fenilo, fenil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, en el que cada grupo fenilo y cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> puede estar sin sustituir o puede llevar uno o dos sustituyentes como se define en la reivindicación 1.
6. Un compuesto para su uso según la reivindicación 2, en el que en compuestos de fórmula I el radical
- 10 R<sup>4</sup> es cis-ciclohexilo, que pueden estar sin sustituir o puede llevar uno o dos sustituyentes como se define en la reivindicación 1.
7. Un compuesto para su uso según la reivindicación 2 o 6, en el que en compuestos de fórmula I el radical
- 15 R<sup>4</sup> es ciclohexilo, que lleva un sustituyente en la posición 4.
8. Un compuesto para su uso según la reivindicación 2 o 6, en el que en compuestos de fórmula I el radical
- 20 R<sup>4</sup> es ciclohexilo, que lleva alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> en la posición 4.
9. Un compuesto para su uso según las reivindicaciones 3 o 4, en el que en compuestos de fórmula I el radical
- 25 R<sup>4</sup> es 1-feniletilo, que es un enantiómero S.
10. Un compuesto para su uso según las reivindicaciones 3, 4 o 9, en el que en compuestos de fórmula I el radical
- 30 R<sup>4</sup> es 1-feniletilo, que lleva un sustituyente en la posición 4.
11. Un compuesto para su uso según las reivindicaciones 3, 4 o 9, en el que en compuestos de fórmula I el radical
- 35 R<sup>4</sup> es 1-feniletilo, que lleva un sustituyente en la posición 4, y en el que el sustituyente está seleccionado del grupo que consiste en halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.
12. Un compuesto para su uso según cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que en compuestos de fórmula I el radical
- 40 R<sup>1</sup> es hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfínilo o alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonilo.
- 45 13. Un compuesto para su uso según cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que en compuestos de fórmula I el radical R<sup>1</sup> es hidrógeno.
14. Un compuesto para su uso según cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que en compuestos de fórmula I el radical
- 50 R<sup>2</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.
15. Un compuesto para su uso según cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que en compuestos de fórmula I el radical
- 55 R<sup>2</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o fluoroalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>.
16. Un compuesto para su uso según cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que en compuestos de fórmula I el radical

R<sup>3</sup> es hidrógeno o alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

17. Un compuesto para su uso según cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que en 5 compuestos de fórmula I el radical R<sup>3</sup> es hidrógeno.
18. Un compuesto para su uso según cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que en compuestos de fórmula I el radical X es cloro.
- 10 19. Un compuesto para su uso según cualquier reivindicación precedente, en el que los parásitos están seleccionados de los órdenes Diptera, Siphonaptera e Ixodida.
20. Un compuesto para su uso según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18, en el que los parásitos son mosquitos.
- 15 21. Un compuesto para su uso según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18, en el que los parásitos son moscas.
22. Un compuesto para su uso según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18 en el que los parásitos 20 son pulgas.
23. Un compuesto para su uso según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18 en el que los parásitos son garrapatas.
- 25 24. Un compuesto para su uso según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18 en el que los parásitos son endoparásitos.
25. Un compuesto para su uso según la reivindicación 24, en el que los endoparásitos son ascárides, acantocéfalos y planarios.
- 30 26. Un compuesto para su uso según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18, en el que los animales son animales domésticos.
27. Un compuesto para su uso según la reivindicación 26, en el que los animales son gatos o perros.
- 35 28. Uso de un compuesto de fórmula I como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18 para la preparación de un medicamento veterinario para tratar, controlar, prevenir o proteger animales contra infestación o infección por parásitos.